

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 383 948**

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: **10188671 .1**
96 Fecha de presentación: **31.08.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **2287161**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **23.02.2011**

54 Título: **Compuesto heterocíclico novedoso**

30 Prioridad:
31.08.2005 JP 2005251055

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
27.06.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
27.06.2012

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 y
Sakurai, Yohji

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 2 383 948 T3

DESCRIPCIÓN

Compuesto Heterocíclico novedoso.

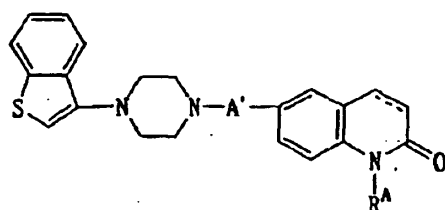
5 Campo Técnico

La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico novedoso.

10 Técnica Anterior

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

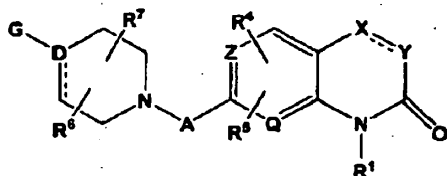
15 El documento WO2004/026864A1 describe que un derivado de carboestirilo representado por la fórmula general:



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

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

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



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

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

Descripción de la Invención

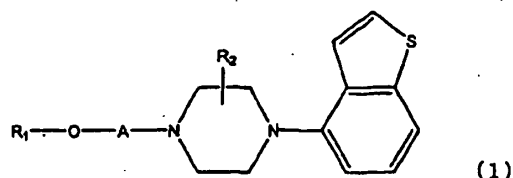
Un objeto de la presente invención es proporcionar un fármaco antipsicótico que tenga un espectro de tratamiento más amplio, menos efectos secundarios y tolerabilidad y seguridad excelentes en comparación con los fármacos antipsicóticos típicos y atípicos bien conocidos.

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

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

5

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



donde R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior;

10 A representa un grupo alqueno inferior o un grupo alquilenilo inferior; y

R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado del grupo un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; y

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

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

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

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

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

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

- grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener uno o varios grupos fenilo como sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior como sustituyente, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo,
- (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
- (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,
- (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior,
- (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
- (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior y un grupo arilo,
- (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,
- (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
- (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,
- (51) un grupo indolinilcarbonilo,
- (52) un grupo tetrahidroquinolilcarbonilo,
- (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
- (54) un grupo morfolinilalquilo inferior,
- (55) un grupo piperazinilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,
- (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- (58) un grupo oxo,
- (59) un grupo aminoalcoxi inferior (que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo amino),
- (60) un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior,
- (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
- (62) un grupo morfolinilo,
- (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
- (64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
- (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxi, y
- (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.
- La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R^1 representa un grupo heterocíclico seleccionado entre un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre, y que se selecciona del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo piranilo, y un grupo tienilo; donde, en el grupo aromático y el grupo heterocíclico representado por R^1 , pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) siguientes:
- (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alquenilo inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- (5) un grupo fenoxi,
- (6) un grupo alquil(inferior)tio,
- (7) un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno,
- (8) un grupo hidroxi,
- (9) un grupo fenilalcoxi inferior,
- (10) un grupo hidroxialquilo inferior,
- (11) un grupo alquil(inferior)alcoxi inferior,

- (12) un átomo de halógeno,
 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo fenilo,
 (15) un grupo nitro,
 5 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior y un grupo
 10 alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes,
 (18) un grupo alcanilo inferior,
 (19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo inferior en el grupo fenilo,
 (20) un grupo carboxi,
 (21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
 15 (22) un grupo carboxialquilo inferior,
 (23) un grupo alcoxi(inferior)carbonilalquilo inferior,
 (24) un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior,
 (25) un grupo carboxialquenilo inferior,
 (26) un grupo alcocicarbonilalquenilo inferior,
 20 (27) un grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener 1 ó 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 o sustituyentes,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:
 25 (i) un grupo alquilo inferior,
 (ii) un grupo alcoxi inferior,
 (iii) un grupo hidroxialquilo inferior,
 (iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,
 (v) un grupo fenoxialquilo inferior,
 30 (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo,
 35 (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 alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior como sustituyente o sustituyentes,
 (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,
 (x) un grupo alquenilo inferior,
 40 (xi) un grupo alquilo inferior que tiene 1 ó 2 grupos carbamoilo que pueden tener 1 o 2 grupos como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxi inferior como
 (xii) un grupo alquilo inferior que tiene 1 ó 2 grupos alcocicarbonilo,
 45 (xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener 1 ó 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes) en el grupo furilo,
 (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
 (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
 50 (xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener 1 ó 2 grupos alquilo inferior en el grupo pirrolilo como sustituyente o sustituyentes),
 (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 o sustituyentes en el grupo pirazolilo),
 55 (xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
 (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
 (xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazinilo),
 60 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolidinilo),
 (xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo),

- (xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
- 5 (xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
- (xxx) un grupo benzopiranylalquilo inferior (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- 10 (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo inferior,
- (xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(inferior)carbonilo 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 alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior,
- 15 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior como sustituyente,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo como sustituyente,
- 20 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como sustituyente o sustituyentes 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,
- (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 o sustituyentes,
- 30 (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- 35 (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente o sustituyentes,
- 40 (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (xlviii) un grupo benzodioxilalquilo inferior,
- (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en
- 45 un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alquenoil inferior; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo fenilo; un grupo fenilalcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener 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; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 55 (l) un grupo cianoalquilo inferior,
- (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- (lii) un grupo alquil(inferior)amino sustituido con halógeno,
- 60 (liii) un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior,
- (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior,
- (lv) un grupo amidinoalquilo inferior,
- (lvi) un grupo alquilen(inferior)oxialquilo inferior,
- (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que

- consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
- (lviii) un grupo fenilalquenilo inferior,
- (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- 5 (lx) un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener como sustituyente o sustituyentes 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 alcoxi inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo),
- 10 (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 alcoxi inferior; un grupo N-alcoxi(inferior)-N-alquil(inferior)carbamoilo y un grupooxopirrolidinilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- 15 (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenilalcoxi(inferior)alquilo inferior,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- (lxvii) un grupo azetidino que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
- 20 (lxviii) un grupo azetidinalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
- (lxix) un grupo tetrazolilo,
- (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquil(inferior)tio,
- 25 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoilo,
- (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
- 30 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(inferior)carbonilo, y
- (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior
- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
- 35 (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,
- 40 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- 45 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- 50 (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior,
- 55 (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 alquil(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes), un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo, un grupo
- 60

morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un solo grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxi inferior (que puede tener 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 alcoxi inferior y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo), 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 alcoxi inferior, un grupo hidroxilo), un grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo inferior (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 alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior en el grupo fenilo),
 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo inferior, 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, un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo en el grupo amino), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo piperidilalquilo inferior, un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo amino), un grupo feniloxi (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presentes un grupo oxo),
 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo aminoalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahydrofurilalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o 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 o sustituyentes 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 benzoilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo fenilalcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo,
 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes 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 pueden tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,
 (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,
 (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 aminoalcoxi inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,

- (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
 (64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un solo grupo tioxo, y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde A es un grupo alquileo inferior.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R¹ representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo y un grupo tiazolilo, y, en el grupo heterocíclico representado por R¹, pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1) a (66) definidos en la reivindicación 2.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado entre un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo y un grupo tiazolilo, y en el grupo heterocíclico representado por R¹, pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) mostrados más abajo.

(1) un grupo alquilo inferior,

(4) un grupo alcoxi inferior,

(10) un grupo hidroxialquilo inferior,

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

(18) un grupo alcanilo inferior,

(21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,

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

(i) un grupo alquilo inferior,

(ii) un grupo alcoxi inferior,

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

(xii) un grupo alquilo inferior que tiene 1 ó 2 grupos alcoxycarbonilo,

(xxi) un grupo piridilalquilo inferior,

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

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

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

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

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

(36) un grupo imidazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior,

(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 alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,

(62) un grupo morfolinilo,

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R¹ representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo y un grupo tiazolilo, y, en el grupo heterocíclico representado por R¹, pueden estar

presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) definidos en la reivindicación 5.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R^1 representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo y un grupo tiazolilo, y, en el grupo heterocíclico representado por R^1 , pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados

(1) un grupo alquilo inferior,

(17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes; y

(28) un grupo carbamoilo que puede tener 1 ó 2 grupos alquilo inferior

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), donde R^1 representa un grupo pirazolilo que tiene un solo grupo alquilo inferior y un solo grupo alcanilo(inferior)amino; un grupo pirazolilo que tiene un solo grupo alquilo inferior y un solo grupo N,N-dialquil(inferior)amino; un grupo piperidilo que tiene un solo grupo N,N-dialquil(inferior)carbamoilo; o un grupo tiazolilo que tiene un solo grupo N,N-dialquil(inferior)carbamoilo.

La presente invención proporciona una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico de fórmula general (1) o una de sus sales de acuerdo con la presente invención, como ingrediente activo y un portador farmacéuticamente aceptable.

La presente invención proporciona una composición farmacéutica de acuerdo con la presente invención que se puede utilizar como una composición farmacéutica para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central.

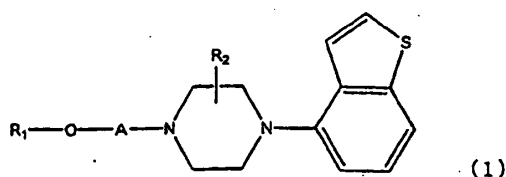
La composición farmacéutica de acuerdo con la presente invención se pueden utilizar en forma de una composición farmacéutica para el tratamiento o la prevención de trastornos del sistema nervioso central seleccionados del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica;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

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

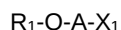
La presente invención proporciona el uso de un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una de sus sales como fármaco.

Se proporciona específicamente un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una de sus sales, como agonista parcial de receptor D_2 de dopamina y/o antagonista del receptor 5-HT_{2A} de serotonina y/o antagonista del receptor α_1 de adrenalina y/o inhibidor de la absorción de serotonina (o inhibidor de la reabsorción de serotonina).

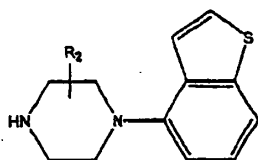
La presente invención proporciona un procedimiento para producir un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



[donde R_1 , R_2 y A son los mismos que se han definido en la reivindicación 1] o una de sus sales, caracterizado por comprender una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



[donde R_1 y A son los mismos que se han definido antes, y X_1 representa un átomo de halógeno o un grupo que ocasiona una reacción de sustitución igual que en un átomo de halógeno] o una de sus sales con un compuesto representado por la fórmula:



[donde R_2 es el mismo que se ha definido antes] o una de sus sales.

Mejor Modo de Llevar a Cabo la Invención

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.

El grupo alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo terc-butilo, un grupo sec-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo isopentilo, un grupo neo-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo 1,2,2-trimetilpropilo, un grupo 2,3-dimetilbutilo, un grupo 2-etilbutilo, un grupo isohexilo, y un grupo 5-metilpentilo.

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, un grupo etileno, un grupo trimetileno, un grupo 2-metiltrimetileno, un grupo 2,2-dimetiletileno, un grupo 2,2-dimetiltrimetileno, un grupo 1-metiltrimetileno, un grupo metilmetileno, un grupo etilmetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno, y un grupo hexametileno.

El grupo alquenileno inferior es un grupo alquenileno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo vinileno, un grupo 1-propenileno, un grupo 1-metil-1-propenileno, un grupo 2-metil-1-propenileno, un grupo 2-propenileno, un grupo 2-butenileno, un grupo 1-butenileno, un grupo 3-butenileno, un grupo 2-pentenileno, un grupo 1-pentenileno, un grupo 3-pentenileno, un grupo 4-pentenileno, un grupo 1,3-butadienileno, un grupo 1,3-pentadienileno, un grupo 2-penten-4-inileno, un grupo 2-hexenileno, un grupo 1-hexenileno, un grupo 5-hexenileno, un grupo 3-hexenileno, un grupo 4-hexenileno, un grupo 3,3-dimetil-1-propenileno, un grupo 2-etil-1-propenileno, un grupo 1,3,5-hexatrienileno, un grupo 1,3-hexadienileno, y un grupo 1,4-hexadienileno.

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

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

de yodo.

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

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

Los ejemplos del grupo arilo incluyen un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido, un grupo bifenilo, un grupo bifenilo sustituido, un grupo naftilo, y un grupo naftilo sustituido. Los ejemplos del sustituyente para un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo inferior lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos. Los ejemplos específicos del grupo arilo pueden incluir un grupo fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo (1- o 2-)naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-4-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftilo, un grupo 2,3-dimetilfenilo, un grupo 3,4-dimetilfenilo, un grupo 2,4-dimetilfenilo, un grupo 2,5-dimetilfenilo, un grupo 2,6-dimetilfenilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilo, un grupo pentametilfenilo, un grupo 2,4-dimetil-1-naftilo, un grupo 2,3-dimetil-1-naftilo, un grupo 3,9-dimetil-1-naftilo, un grupo 3,5,7-trietilnaftilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilo, un grupo heptametil-1-naftilo, un grupo 2,3-diaminofenilo, un grupo 2,4,6-triaminofenilo, y un grupo 2-metil-5-cloro-1-naftilo.

Los ejemplos del grupo ariloxi incluyen un grupo feniloxi, un grupo feniloxi sustituido, un grupo bifeniloxi, un grupo bifeniloxi sustituido, un grupo naftiloxi, y un grupo naftiloxi sustituido. Los ejemplos del sustituyente para un grupo ariloxi incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. En el grupo arilo, pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos. Los ejemplos específicos de los grupos ariloxi incluyen un grupo feniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-

bifeniloxi, un grupo (1- o 2-)naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)metil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)etil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-propil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-butil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-pentil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)n-hexil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)isobutil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6'-)terc-butil-4-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propilo-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 9-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofeniloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftiloxi, un grupo 2,3-dimetilfeniloxi, un grupo 3,4-dimetilfeniloxi, un grupo 2,4-dimetilfeniloxi, un grupo 2,5-dimetilfeniloxi, un grupo 2,6-dimetilfeniloxi, un grupo 2,9,6-trimetilfeniloxi, un grupo 3,4,5-trimetilfeniloxi, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfeniloxi, un grupo pentametilfeniloxi, un grupo 2,4-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 2,3-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 3,4-dimetil-1-naftiloxi, un grupo 3,5,7-trietil-1-naftiloxi, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftiloxi, un grupo heptametil-1-naftiloxi, un grupo 2,3-diaminofeniloxi, un grupo 2,4,6-triaminofeniloxi, y un grupo 2-metil-5-cloro-1-naftiloxi.

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

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes sustituido con 1 a 7, preferiblemente, de 1 a 3 átomos de halógeno. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo bromometoxi, un grupo dibromometoxi, un grupo diclorofluorometoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo heptafluoropropoxi, un grupo heptafluoroisopropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 2-cloropropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 4,4,4-trifluorobutoxi, un grupo 4,4,4,3,3-pentafluorobutoxi, un grupo 4-clorobutoxi, un grupo 4-bromobutoxi, un grupo 2-clorobutoxi, un grupo 5,5,5-trifluoropentoxi, un grupo 5-cloropentoxi, un grupo 6,6,6-trifluorohexiloxi, y un grupo 6-clorohexiloxi.

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

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

Los ejemplos del grupo hidroxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes que tiene

de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3 grupos hidroxilo (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo hidroximetilo, un grupo 2-hidroxietilo, un grupo 1-hidroxietilo, un grupo 3-hidroxipropilo, un grupo 2,3-dihidroxipropilo, un grupo 4-hidroxibutilo, un grupo 3,4-dihidroxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, un grupo 5-hidroxipentilo, un grupo 6-hidroxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-hidroxipropilo, un grupo 2-metil-3-hidroxipropilo, un grupo 2,3,4-trihidroxibutilo, y un grupo perhidroxihexilo.

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

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

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

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

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

El grupo alquil(inferior)carbamoilo es un grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como sustituyente o sustituyentes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-metilcarbamoilo, un grupo N,N-dimetilcarbamoilo, un grupo N-etilcarbamoilo, un grupo N,N-dietilcarbamoilo, un grupo N-n-propilcarbamoilo, un grupo N-n-butilcarbamoilo, un grupo N-n-pentilcarbamoilo, un grupo N-n-hexilcarbamoilo, un grupo N-isobutilcarbamoilo, un grupo N-terc-butilcarbamoilo, un grupo y N,N-di-n-propilcarbamoilo.

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

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

acetilamino)valerilo.

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

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

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

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

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

un grupo carbamoilo;

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

Los ejemplos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo radical arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similares y en el que están presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilsulfonilo, un grupo (1- o 2-)naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 9', 5', o 6')metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-

naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 9-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetil-fenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, un grupo pentametilfenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,5,7-trietil-1-naftilsulfonilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilsulfonilo, y un grupo heptametil-1-naftilsulfonilo.

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

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

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

Los ejemplos del grupo carboxialqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos carboxilo, incluyendo configuraciones tanto trans como cis (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carboxietenilo, un grupo 3-carboxi-2-propenilo, un grupo 4-carboxi-2-butenilo, un grupo 4-carboxi-3-butenilo, un grupo 4-carboxi-1,3-butadienilo, un grupo 5-carboxi-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-carboxi-2,4-hexadienilo, un grupo 5-carboxi-3-pentenilo, y un grupo 3-carboxi-1-propenilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi(inferior)carbonilalqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes, incluyendo configuraciones tanto trans como cis. Los ejemplos específicos del grupo alcoxi(inferior)carbonilalqueno inferior incluyen un grupo 2-metoxycarboniletenilo, un grupo 2-etoxycarboniletenilo, un grupo 1-etoxycarboniletenilo, un grupo 3-metoxycarbonil-2-propenilo, un grupo 3-etoxycarbonil-2-propenilo, un grupo 4-etoxycarbonil-2-butenilo, un grupo 4-etoxycarbonil-1,3-butadienilo, un grupo 5-isopropoxycarbonil-3-pentenilo, un grupo 6-n-propoxycarbonil-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxycarboniletenilo, un grupo 2-metil-3-terc-butoxycarbonil-2-propenilo, y un grupo 2-n-pentiloxycarboniletenilo.

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

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

Los ejemplos del grupo carbamoilalquenilo inferior que puede tener, como sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquenilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquenilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 enlaces dobles y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo carbamoil que puede tener, en el grupo carbamoil, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en

un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono preferiblemente que tiene de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 sustituyentes de átomo de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-carbamoiletlenilo, un grupo 2-(N-metilcarbamoil)etenilo, un grupo 2-(N-etilcarbamoil)etenilo, un grupo 2-(N,N-dimetilcarbamoil)etenilo, y un grupo 2-[N-(2,2,2-trifluoroetil)carbamoil]etenilo.

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

Los ejemplos del grupo ariloxialquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo ariloxi cuyo radical arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similares. Los ejemplos de un sustituyente para un grupo arilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, y un grupo amino. Pueden estar presentes de uno a siete sustituyentes de al menos un tipo de estos en un anillo de arilo. Los ejemplos específicos del ariloxialquilo inferior incluyen un grupo fenoximetilo, un grupo 2-fenoxietilo, un grupo 2-[(1- o 2-)naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)metilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)etilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-propilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-pentilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)n-hexilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)isobutilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)terc-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)clorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)fluorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)bromofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftiloxi] etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, o 4-)aminofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-(2,3-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(3,4-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,5-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,6-dimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4,6-trimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(3,4,5-trimetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,3,4,5-tetraetilfenoxi)etilo, un grupo 2-(pentametilfenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,4-dimetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,5,7-trietil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(3,4,5,7-tetrametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3,9,5,7-pentametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(heptametil-1-naftiloxi)etilo, un grupo 2-(2,3-diaminofenoxi)etilo, un grupo 2-(2,4,6-triaminofenoxi)etilo, un grupo 2-(2-metil-5-cloro-1-naftil)etilo, un grupo 3-fenoxipropilo, un grupo 2,3-difenoxipropilo, un grupo 4-fenoxibutilo, un grupo 3,4-difenoxibutilo, un grupo 1,1-dimetil-2-fenoxietilo, un grupo 5-fenoxipentilo, un grupo 6-fenoxihexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-fenoxipropilo, un grupo 2-metil-3-fenoxipropilo, un grupo y 2,3,4-trifenoxibutilo, un grupo 3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 2,3-di[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 4-[(1- o 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 3,4-di[(1- o 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- o 2-)naftiloxi]etilo, un grupo 5-[(1- o 2-)naftiloxi]pentilo, un grupo 6-[(1- o 2-)naftiloxi]hexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 2-metil-3-[(1- o 2-)naftiloxi]propilo, y un grupo 2,3,4-tri[(1- o 2-)naftiloxi]butilo.

Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un

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

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

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener un grupo, como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior incluyen un grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos, como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo hidroxilo; a un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes; y un grupo alcoxi inferior (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos fenilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo ciclooctilo, un grupo 1-ciclobutiletilo, un grupo 1-metilciclopentilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 2-metilciclohexilo, un grupo 4-hidroxiciclohexilo, un grupo 4-metoxycarbonilciclohexilo, un grupo 2-benciloxipentilo, y un grupo 2-benciloxihexilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C₃-C₈ incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo cicloalquilo C₃-C₈ como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo ciclopropilmetilo, un grupo ciclohexilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo 1-ciclobutiletilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo 3-ciclopentilpropilo, un grupo 4-ciclohexilbutilo, un grupo 5-cicloheptilpentilo, un grupo 6-ciclooctilhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-ciclohexiletilo, y un grupo 2-metil-3-ciclopropilpropilo.

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

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

Los ejemplos del grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos 1,3-dioxolanilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo [(2- o 4-)1,3-dioxolanil]metilo, un grupo 2-[(2- o 4-)1,3-

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

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

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

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

40 Los ejemplos del grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirazolilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos pirazolilo, en los cuales pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos
45 específicos incluyen un grupo 3-pirazolilmetilo, un grupo 2-(4-pirazolil)etilo, un grupo 2-(1-pirazolil)etilo, un grupo 1-(5-pirazolil)etilo, un grupo 3-(3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(4-pirazolil)butilo, un grupo 5-(1-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(5-pirazolil)hexilo, un grupo 2-metil-3-(1-pirazolil)propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(3-pirazolil)etilo, un grupo 1-metil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-pentil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-metil-4-pirazolilmetilo, un grupo 5-metil-3-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-4-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-hexil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3-metil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-etil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,5-dimetil-3-pirazolilmetilo, un grupo 3,5-dimetil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-dimetil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-dietil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-di-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4-di-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-trimetil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-trietil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-tri-n-propil-1-pirazolilmetilo, un grupo 3,4,5-tri-n-butil-1-pirazolilmetilo, un grupo 1-metil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-etil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-propil-5-pirazolilmetilo, un grupo 1-n-butil-5-pirazolilmetilo, un grupo 2-(3-pirazolil)etilo, un grupo 3-(3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(3-pirazolil)butilo, un grupo 5-(3-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(3-pirazolil)hexilo, un grupo 2-(1-(4-clorofenil)-3-pirazolil)etilo, un grupo 3-(1-metil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(3-metil-4-pirazolil)propilo, un grupo 3-(5-metil-4-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1,5-dimetil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-etil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-n-propil-3-pirazolil)propilo, un grupo 3-(1-n-butil-3-pirazolil)propilo, un grupo 4-(1-metil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-etil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-n-propil-3-pirazolil)butilo, un grupo 4-(1-n-butil-3-pirazolil)butilo, un grupo 5-(1-metil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-etil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-n-

propil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 5-(1-n-butil-3-pirazolil)pentilo, un grupo 6-(1-metil-3-pirazolil)hexilo, un grupo 6-(1-etil-3-pirazolil)hexilo, un grupo 6-(1-n-propil-3-pirazolil)hexilo, y un grupo 6-[1-(3-butil)-3-pirazolil]hexilo.

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener como sustituyente en el grupo piperidilo, un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que

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

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

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener un grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzopiranilo en el que puede estar presente como sustituyente un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (4H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (4H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (4H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(4H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(4H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(4H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(4H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(4H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (2H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(2H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(2H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(2H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(2H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(2H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-1-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-1-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-1-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-1-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-1-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-1-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(1H-2-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(1H-2-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)metilo, un grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)etilo, un grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)propilo, un grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)butilo, un grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)pentilo, un grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)hexilo, un grupo (9-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)hexilo, un grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)metilo, un grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)pentilo, y un grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)hexilo.

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

6-(1-benzimidazolil)hexilo, un grupo 2-benzimidazolilmetilo, un grupo 2-(2-benzimidazolil)etilo, un grupo 3-(2-benzimidazolil)propilo, un grupo 4-(2-benzimidazolil)butilo, un grupo 5-(2-benzimidazolil)pentilo, y un grupo 6-(2-benzimidazolil)hexilo.

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

15 Los ejemplos del grupo imidazolilalquilo inferior que tiene un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes en el grupo alquilo cuyo radical alquilo inferior es el mismo que se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de
20 carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo carbamoil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo metoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo etoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo isobutoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo terc-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo sec-butoxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-pentiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo neopentiloxi-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo n-hexiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo isohexiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o
25 5-)imidazolil]metilo, un grupo 3-metilpentiloxycarbonil-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]metilo, un grupo 1-carbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1-metoxycarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1,1-dimetoxycarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1,1-dicarbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 2-carbamoil-1-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 2-metoxycarbonil-3-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]propilo, un grupo 2-carbamoil-4-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]butilo, un grupo 1-metil-1-carbamoilmetil-2-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]etilo, un grupo 2-metoxycarbonil-5-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]pentilo, un grupo 3-carbamoil-6-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]hexilo, un grupo 2-metoxycarbonil-1-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]isopropilo, y un grupo 2-carbamoilmetil-3-[(1-, 2-, 4-, o 5-)imidazolil]propilo.

35 Los ejemplos del grupo piridilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior, como sustituyente incluyen un grupo piridilo que puede tener de 1 a 4 (preferiblemente 1) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o
40 ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior en el que cada uno de los dos radicales alquilo inferior están compuestos de un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 4-metil-2-piridilo, un grupo 5-metil-2-piridilo, un grupo 5-etil-3-piridilo, un grupo 2-n-propil-3-piridilo, un grupo 4-n-butil-2-piridilo, un grupo 4-terc-butil-2-piridilo, un grupo 5-n-pentil-3-piridilo, un grupo 4-n-hexil-2-piridilo, un grupo 4-metoxi-2-piridilo, un grupo 5-metoxi-2-piridilo, un grupo 2-metiltiometil-3-piridilo, un grupo 5-etiltiometil-2-piridilo, un grupo 4-n-propiltiometil-2-piridilo, un grupo 3-n-butiltiometil-2-piridilo, un grupo 5-n-pentiltiometil-3-piridilo, un grupo 4-n-hexiltiometil-3-piridilo, un grupo 2-(2-metiltioetil)-3-piridilo, un grupo 2-(3-metiltiopropil)-4-piridilo, un grupo 3-(4-metiltiobutil)-4-piridilo, un grupo 3-(5-metiltiopentil)-2-piridilo, un grupo 4-(6-metiltiohexil)-2-piridilo, un grupo 3,4-dimetil-2-piridilo, un grupo 2,4,6-trietil-3-piridilo, un grupo 2,3,5,6-tetrametil-4-piridilo, y un grupo 2-metil-3-metiltiometil-4-piridilo.

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

un grupo 2,4-dimetoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 3,4,5-trietoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 2-metil-4-metoxicarbonilpirrolidin-1-ilo, un grupo 1-benzoilpirrolidin-3-ilo, un grupo 1-acetilpirrolidin-3-ilo, y un grupo 1-butilpirrolidin-3-ilo.

- 5 Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un grupo como sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, y un grupo aroilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno incluyen un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 5 (preferiblemente de 1 a 4) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en
- 10 un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y
- 15 un grupo aroilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes y un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo benzoilo). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-piperidilo, un grupo 2-piperidilo, un grupo 3-piperidilo, un grupo 4-piperidilo, un grupo 1-metil-4-piperidilo, un grupo 2-etil-4-piperidilo, un grupo 3-n-propil-4-piperidilo, un grupo 4-n-butil-4-piperidilo, un grupo 1-n-pentil-4-piperidilo, un grupo 2-n-hexil-4-piperidilo, un grupo 1-metoxicarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-etoxicarbonil-4-piperidilo, un grupo 4-n-propoxicarbonil-4-piperidilo, un grupo 5-n-butoxicarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-terc-butoxicarbonil-4-piperidilo, un grupo 1-formil-4-piperidilo, un grupo 1-acetil-4-piperidilo, un grupo 1-butil-4-piperidilo, un grupo 1-butil-3-piperidilo, un grupo 2-propionil-4-piperidilo, un grupo 3-butil-4-piperidilo, un grupo 4-isobutil-4-piperidilo, un grupo 1-n-pentanoil-4-piperidilo, un grupo 2-terc-butilcarbonil-4-piperidilo, un grupo 3-n-hexanoil-4-piperidilo, un grupo 1-benzoil-4-piperidilo, un grupo 1-benzoil-3-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-clorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-fluorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3-, o 4-metilbenzoil)-4-piperidilo, un grupo 2,6-dimetil-4-piperidilo, un grupo 2,4,6-trimetil-3-piperidilo, un grupo 2,2,6,6-tetrametil-4-piperidilo, y un grupo 2,2,4,4,6-pentametil-3-piperidilo.
- 20
- 25
- 30 Los ejemplos del grupo tetrahydrofurilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo 2-tetrahydrofurilo, un grupo 3-tetrahydrofurilo, un grupo 3-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 4-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 5-oxo-2-tetrahydrofurilo, un grupo 2-oxo-3-tetrahydrofurilo, un grupo 4-oxo-3-tetrahydrofurilo, y un grupo 5-oxo-4-tetrahydrofurilo.
- 35
- Los ejemplos del grupo hexahidroazepinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo 2-hexahidroazepinilo, un grupo 3-hexahidroazepinilo, un grupo 4-hexahidroazepinilo, un grupo 2-oxo-3-hexahidroazepinilo, un grupo 3-oxo-2-hexahidroazepinilo, un grupo 4-oxo-2-hexahidroazepinilo, un grupo 5-oxo-2-hexahidroazepinilo, y un grupo 6-oxo-2-hexahidroazepinilo.
- 40
- Los ejemplos del grupo pirazolilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo arilo, y un grupo furilo como sustituyente incluyen un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 45 un grupo arilo como se ha ilustrado antes y un grupo furilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 1-pirazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 4-pirazolilo, un grupo 1-metil-5-pirazolilo, un grupo 1-etil-5-pirazolilo, un grupo 3-n-propil-5-pirazolilo, un grupo 4-n-butil-5-pirazolilo, un grupo 1-terc-butil-4-pirazolilo, un grupo 1-n-pentil-4-pirazolilo, un grupo 3-n-hexil-4-pirazolilo, un grupo 3-fenil-5-pirazolilo, un grupo 1-(2-naftil)-3-pirazolilo, un grupo 4-(2-metilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 5-(3-etilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 1-(4-n-propilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 3-(2-n-butilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 5-(3-n-pentilfenil)-4-pirazolilo, un grupo 1-(4-n-hexilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 3-(2-isobutilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 4-(3-terc-butilfenil)-5-pirazolilo, un grupo 3-(2-clorofenil)-1-pirazolilo, un grupo 4-(3-fluorofenil)-1-pirazolilo, un grupo 5-(4-bromofenil)-1-pirazolilo, un grupo 1-(2-aminofenil)-3-pirazolilo, un grupo 4-(2,3-dimetilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 5-(3,4,5-trimetilfenil)-3-pirazolilo, un grupo 1-(2,3-diaminofenil)-4-pirazolilo, un grupo 3-(2-furil)-5-pirazolilo, un grupo 1,3-dimetil-5-pirazolilo, un grupo 1,3,4-trietil-5-pirazolilo, un grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolilo, y un grupo 1-metil-3-fenil-5-pirazolilo.
- 50
- 55

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

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

tiadiazol-3-ilo, un grupo 5-n-butil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 4-terc-butil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo, un grupo 5-n-pentil-1,2,4-tiadiazol-3-ilo, y un grupo 5-n-hexil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alqueno inferior; un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior, y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano, un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo arilalcoxi inferior; un grupo hidroxil; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un grupo oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener un grupo oxo; un grupo imidazolilalcanoilo inferior; y un grupo piperidinilcarbonilo incluyen un grupo arilo como se ha ilustrado antes

que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos, como sustituyente o sustituyentes, que se seleccionan del grupo que consiste en

un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes;

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

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

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

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

un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado antes (

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

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

un grupo sulfamilo;

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

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

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo como se ilustra más abajo; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo arilo cuyo radical arilo es como se ha ilustrado antes; un grupo arilo alcoxi inferior cuyo radical arilo y radical alcoxi inferior son como se ha ilustrado antes; un grupo hidroxilo;

un grupo hidroxialquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es como se ha ilustrado antes; un grupo carbamilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo arilo como se ha ilustrado antes; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes; un grupo dihidrofurilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo; un grupo tiazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo y que

tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes; un grupo imidazolilalcanilo inferior cuyo radical alcanilo es como se ha ilustrado antes y un grupo piperidinilcarbonilo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2- un grupo naftilo, (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fluorofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isopropoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butoxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutoxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)sec-butoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isopentiloxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)neopentiloxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexiloxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-) isohexiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(3-metilpentiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorometilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoroetil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-bromopropil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-clorobutil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(5-fluoropentil)fenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(6-bromohexil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorometoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)(2-fluoroetoxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-bromopropoxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-clorobutoxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(5-fluoropentiloxi)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)trifluorometoxifenilo, un grupo 4-(6-bromohexiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenilo, un grupo 7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftilo, un grupo 2-vinilfenilo, un grupo 2-(1-metilvinil)fenilo, un grupo 2-(1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-metil-1-propenil)fenilo, un grupo 3-(2-metil-1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(1-propenil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-propenil)fenilo, un grupo 4-(2-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-butenil)fenilo, un grupo 5-(3-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-pentenil) fenilo, un grupo 6-(1-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-pentenil)fenilo, un grupo 7-(9-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,3-butadienil)fenilo, un grupo 8-(1,3-pentadienil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-penten-4-inil)fenilo, un grupo 1-(2-hexenil)-2-naftilo, un grupo 4-(1-hexenil)fenilo, un grupo a 3-(5-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(3-hexenil), un grupo 4-(4-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3,3-dimetil-1-propenil)fenilo, un grupo 5-(2-etil-1-propenil)-2-naftilo, un grupo 9-(1,3,5-hexatrienil)fenilo, un grupo 6-(1,3-hexadienil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1,4-hexadienil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-formilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-acetilamino)fenilo, un grupo 7-(N-acetilamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-propionilamino) fenilo, un grupo 8-(N-butililamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-isobutililamino)fenilo, un grupo 2-(N-pentanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-terc-butilcarbonilamino)fenilo, un grupo 3-(N-hexanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N,N-diformilamino)fenilo, un grupo 4-(N,N-diacetilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N,N-dimetilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-fenilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)sulfamioilfenilo, un grupo 5-sulfamioil-1-naftilo, un grupo

(2-, 3-, o 4-)metiltiofenilo, un grupo 6-etiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propiltiofenilo, un grupo 7-isopropiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butiltiofenilo, un grupo 8-terc-butiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiltiofenilo, un grupo 1-n-hexiltio-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-metil(sulfonilamino)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)formilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butirilfenilo, un grupo 3-acetil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)propionilfenilo, un grupo 4-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutililfenilo, un grupo 5-pentanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)cianofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxicarbonilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilcarbonilfenilo, un grupo 6-hexanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonilfenilo, un grupo 7-etoxicarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propoxycarbonilfenilo, un grupo 8-isopropoxycarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butoxycarbonilfenilo, un grupo 2-isobutoxycarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxycarbonilfenilo, un grupo 3-sec-butoxycarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentiloxycarbonilfenilo, un grupo 4-neopentilo-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexiloxycarbonilfenilo, un grupo 5-isohexiloxycarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metilpentiloxycarbonil)fenilo, un grupo 6-(1-pirrolil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-pirrolil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etinilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-metilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-fenilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(2-hidroxietyl)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fenoxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)nitrofenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benciloxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroxifenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-oxo-2,5-dihidrofuran-9-il)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-imidazolilacetil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(2,9-dioxotiazolidin-5-ilmetil)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)[(1-,2-, 3-, o 4-)piperidilcarbonil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-,3-, 4-, o 5-)pirazolil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-oxo-(1- o 3-)pirrolidinil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 4-, o 5-)oxazolil]fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-etil-4-metilimidazol-1-il)fenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilo, un grupo 2,3-dimetoxifenilo, un grupo 2,4-dimetoxifenilo, un grupo 2,5-dimetoxifenilo, un grupo 2,6-dimetoxifenilo, un grupo 3,4-dimetoxifenilo, un grupo 3,5-dimetoxifenilo, un grupo 2,3-diclorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, un grupo 3,4-diclorofenilo, un grupo 2-metoxi-5-clorofenilo, un grupo 2-metoxi-5-metilfenilo, un grupo 2-metoxi-5-acetilaminofenilo, un grupo 2-vinil-4-metilfenilo, un grupo 2-vinil-5-etilfenilo, un grupo 2,6-disulfamoilfenilo, un grupo 2,4,6-trimetoxifenilo, un grupo 3,9,5-trietoxifenilo, un grupo 2-vinil-3,4,5-trietilfenilo, un grupo pentametoxifenilo, un grupo 2-vinilnaftilo, un grupo 2,3-dimetoxi-1-naftilo, un grupo 3,4-dietoxifenilo, un grupo 2-metoxi-5-metoxicarbonilfenilo, un grupo 3,5-dimetoxicarbonilfenilo, un grupo 3-cloro-4-hidroxifenilo, un grupo 2-cloro-5-(N-acetilamino)fenilo, un grupo 2-cloro-5-cianofenilo, un grupo 2-cloro-5-carbamoilfenilo, un grupo 2-metoxi-5-(N-acetilamino)fenilo, un grupo 2-cloro-5-etoxicarbonilfenilo, un grupo 3,5,7-trietoxi-1-naftilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5-tetrametil-7-(N-pentaacetilamino)-1-naftilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetoxi-1-naftilo, y un grupo heptametoxi-1-naftilo.

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

Los ejemplos del grupo alcanilo(inferior)aminoalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos amino que tiene de 1 a 2 grupos alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-(N-formilamino)etilo, un grupo 2-(N-acetilamino)etilo, un grupo 2-(N-propionilamino)etilo, un grupo 2-(N-butililamino)etilo, un grupo 2-(N-isobutililamino)etilo, un grupo 2-(N-pentanoilamino)etilo, un grupo 2-(N-terc-butilcarbonilamino)etilo, un grupo 2-(N-hexanoilamino)etilo, un grupo N-acetilaminometilo, un grupo 1-(N-acetilamino)etilo, un grupo 3-(N-acetilamino)propilo, un grupo 4-(N-acetilamino)butilo, un grupo 5-(N-acetilamino)pentilo, un grupo 6-(N-acetilamino)hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(N-acetilamino)etilo, un grupo 2-metil-3-(N-acetilamino)propilo, y un grupo 2-(N,N-diacetilamino)etilo.

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

Los ejemplos del grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alquil(inferior)tio cuyo radical alquilo es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o

ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo 2-metiltioetilo, un grupo 2-etiltioetilo, un grupo 2-n-propiltioetilo, un grupo 2-n-butiltioetilo, un grupo 2-terc-butiltioetilo, un grupo 2-n-pentiltioetilo, un grupo 2-n-hexiltioetilo, un grupo metiltiometilo, un grupo 1-metiltioetilo, un grupo 3-metiltiopropilo, un grupo 4-metiltiobutilo, un grupo 5-metiltiopentilo, un grupo 6-metiltiohexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-metiltioetilo, un grupo 2-metil-3-metiltiopropilo, un grupo 2,2-dietiltioetilo, y un grupo 2,2,2-trietiltioetilo.

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

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

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

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

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

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

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

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

un grupo alcoxi sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo N-fenilamino, un grupo N-2-naftilamino, un grupo N-(2-metilfenil)amino, un grupo N-(3-etil-1-naftil)amino, un grupo N-(4-n-propilfenil)amino, un grupo N-(2-n-butil-1-fenil)amino, un grupo N-(3-n-pentilfenil)amino, un grupo N-(4-n-hexil-1-naftil)amino, un grupo N-(2-isobutilfenil)amino, un grupo N-(3-terc-butil-1-naftil)amino, un grupo N-(2-metoxifenil)amino, un grupo N-(3-etoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(4-n-propoxifenil)amino, un grupo N-(3-isopropoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(n-butoxifenil)amino, un grupo N-(1-isobutoxi-2-naftil)amino, un grupo N-(terc-butoxifenil)amino, un grupo N-(5-sec-butoxi-1-naftil)amino, un grupo N-(n-pentiloxifenil)amino, un grupo N-(5-isopentiloxi-1-naftil)amino, un grupo N-(1-neopentiloxifenil)amino, un grupo N-(6-

n-hexiloxi-2-naftil)amino, un grupo N-(isohexiloxifenil)amino, un grupo N-(3-metilpentiloxi-1-naftil)amino, un grupo N-(2-trifluorometilfenil)amino, un grupo N-(4-trifluorometilfenil)amino, un grupo N-(2-clorometilfenil)amino, un grupo N-[3-(2-fluoroetil)-1-naftil]amino, un grupo N-[4-(3-bromopropil)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutil)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentil)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexil)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftil]amino, un grupo N-(2-clorometoxifenil)amino, un grupo N-(4-trifluorometoxifenil)amino, un grupo N-(3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil)amino, un grupo N-[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino, un grupo N-(2-clorometoxifenil)amino, un grupo N-[3-(2-fluoroetoxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[4-(3-bromopropoxi)fenil]amino, un grupo N-[2-(4-clorobutoxi)-1-fenil]amino, un grupo N-[3-(5-fluoropentiloxi)fenil]amino, un grupo N-[4-(6-bromohexiloxi)-1-naftil]amino, un grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenil]amino, un grupo N-[7-(2-metil-3-fluoropropoxi)-2-naftil]amino, y un grupo N,N-difenilamino.

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

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

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

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

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

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

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

un grupo carbamoilo; y

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

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

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

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

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

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

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

60 Los ejemplos del grupo azetidínialquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo incluyen un grupo azetidínialquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferible 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes y tienen un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes. Sus

ejemplos específicos incluyen un grupo 2- o 3-azetidiniometilo, un grupo 2-(2- o 3-azetidini)etilo, un grupo 1-acetil-(2- o 3-)azetidiniometilo, un grupo 1-butil-(2- o 3-)azetidiniometilo, un grupo 1-benzil-(2- o 3-)azetidiniometilo, un grupo 2-[1-acetil-(2- o 3-)azetidini]etilo, un grupo 2-[1-butil-(2- o 3-)azetidini]etilo y un grupo 2-[1-benzil-(2- o 3-)azetidini]etilo.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolilalquilo inferior como se ha ilustrado antes, cuyo grupo alquilo como se ha ilustrado antes, tiene de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes en el anillo de oxazol. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 4- o 5-)oxazolilmetilo, un grupo 2-(2-, 4- o 5-)oxazolilmetilo, un grupo [2-metil-(4- o 5-)oxazolil]metilo y un grupo (2,5-dimetil-4-oxazolil)metilo.

Los ejemplos del grupo aminoalquilo inferior que puede tener un grupo, en el grupo amino, que se selecciona del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo arilo, un grupo arilalquilo inferior, un grupo aroilo, y un grupo alquilo sustituido con amino (en el grupo amino del grupo alquilo sustituido con amino, puede estar presente un grupo alquilo inferior como sustituyente) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferible de 1 a 3, más preferiblemente 1, un grupo amino. Obsérvese que, en el grupo amino, pueden estar presentes de 1 a 2 sustituyentes que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con 1 a 13, preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de halógeno);

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

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

un grupo arilo como se ha ilustrado antes;

un grupo arilalquilo inferior como se ha ilustrado antes;

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

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

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

Los ejemplos del grupo tiocarbamoilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo tiocarbamoilo, un grupo N-metil-tiocarbamoilo, un grupo N-etil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-propiltiocarbamoilo, un grupo N-n-butil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-pentil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-hexil-tiocarbamoilo, un grupo N-isobutil-tiocarbamoilo, un grupo N-terc-butil-tiocarbamoilo, un grupo N,N-dimetil-tiocarbamoilo, y un grupo N-metil-N-etil-tiocarbamoilo.

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

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

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

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

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

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

15 fenilo, bifenilo, naftilo y similares. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bifenilsulfonilo, un grupo (1- o 2-)naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')etil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5', o 6')terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)terc-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)clorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)fluorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)bromofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)cloro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)fluoro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)bromo-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)aminofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, u 8-)amino-2-naftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,5-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,6-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,4,5-trimetilfenilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5-tetraetilfenilsulfonilo, un grupo pentametilfenilsulfonilo, un grupo 2-metilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilnaftilsulfonilo, un grupo 3,4-dimetilfenilsulfonilo, un grupo 3,5,7-trietilnaftilsulfonilo, un grupo 3,4,5,7-tetrametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,7-pentametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetilnaftilsulfonilo, un grupo heptametilnaftilsulfonilo, un grupo 2,3-diaminofenilsulfonilo, un grupo 2,4,6-triaminofenilsulfonilo, y un grupo 2-metil-5-cloronaftilsulfonilo.

55 Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior; un grupo alcanilo inferior; un grupo arilsulfonilo; un grupo oxo; un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior incluyen un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3, más preferiblemente 1 sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alcanilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6

átomos de carbono); y

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

Los ejemplos del piperidilcarbonilo grupo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquilo(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2, grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un grupo alquilo inferior), un grupo 1,4-dioxo-8-azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un grupo alquilo inferior), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxi inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno), un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alcoxi sustituido con halógeno), un grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno), un grupo alcoxi inferior y un grupo hidroxilo), un grupo ariloxi (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior) incluyen un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo piperidilo, seleccionados del grupo que consiste en

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

un grupo hidroxilo;

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

un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes;

un grupo carboxialquilo inferior como se ha ilustrado antes que tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes;

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

un grupo carbamoilo;

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

un grupo carboxi;

un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado

un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes);

un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo aroilo como se ha ilustrado antes);

un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono));

un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo;

un grupo morfolinilo;

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

un grupo piridilo;

un grupo piridiloxi;

un grupo piridilalcoxi inferior que tiene un radical alcoxi inferior como se ha ilustrado antes;

un grupo tetrahidroquinolilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo);

un grupo benzodioxolilo (preferiblemente un grupo benzo[1,3]dioxolilo);

un grupo arilalcoxi inferior que tiene un radical arilo y un radical alcoxi inferior como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alcoxi sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes);

un grupo arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo hidroxilo);

un grupo ariloxi que tiene un radical arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, átomo de halógeno, un

grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes);

un grupo arilalquilo inferior que tiene un radical arilo y un radical alquilo inferior como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con

halógeno); y

un grupo aroilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado antes y un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado antes). Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)piperidilcarbonilo, un

grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)etil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)metil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroxil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroxil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroxil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)hidroxil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)hidroximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroximetil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)hidroximetil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)hidroximetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)(2-hidroxietil)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(N-etil-carbamoilmetil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)N-etil-carbamoilmetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)carbamoil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)carbamoil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)carbamoil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)carboximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 9-)metoxi-9-piperidilcarbonilo, un grupo 2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo

(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 5-)etoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-) acetilamino-9-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo

(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonilamino-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butirilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benzoilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo

(2-, 3-, o 9-)(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 9-)(N-metil-N-butilamino)-1-

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

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

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

un grupo carbamoilo;

un grupo hidroxi;

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

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo inferior, un grupo hidroxialquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo aminoalquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente en el grupo amino, como sustituyente), un grupo piperidilalquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente en el grupo piperidilo, como sustituyente), un grupo morfolinilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilalquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior, un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior, un grupo piridilalquilo inferior (un grupo fenilo puede estar presente en el grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo imidazolilalquilo inferior, un grupo furilalquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonilalquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente, un grupo piridilo (un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano, y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno puede estar presente en el grupo piridilo, como sustituyente), un grupo tieno[2,3-c]piridilo grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furilalquilo inferior, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo y un grupo oxo, incluyen un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo piperazinilo, que se seleccionan del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo piridilo (pueden estar presentes en el grupo piridilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo ciano, y

30 un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado antes (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomo de halógeno)): un grupo tieno[2,3-c]piridilo; un grupo arilo como se ha ilustrado antes (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo como se ha ilustrado antes, un grupo furilalquilo inferior que tiene un radical alquilo inferior como se ha ilustrado

35 antes, un grupo arilalcoxi(inferior)carbonilo que tiene un radical arilo y un radical alcoxi(inferior)carbonilo como se ha ilustrado antes y un grupo oxo. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-propil-1-piperazinilcarbonilo; (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-propil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-butil-1-

40 piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-etil-n-propil)]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-etil-n-propil)]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)isopropil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)isopropil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)n-hexil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)n-hexil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o

45 4-)ciclopentil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)ciclopentil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)cicloheptil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)cicloheptil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)acetil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)butiril-1-piperazinil carbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)acetil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-hidroxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o

50 6-)(2-hidroxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-metoxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-metoxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metoxipropil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-metoxipropil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-metoxibutil)-1-

55 piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metoxibutil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)etoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)etoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)terc-butoxicarbonil-2-

60 piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)metoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)metoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(N,N-dimetilamino)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(N,N-dimetilamino)etil]-2-

piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-(1-piperidil)etil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-(1-piperidil)etil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(4-morfolinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(4-morfolinil)etil]-2-

piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o

6-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1,3-dioxolanil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(-2-[2-(1,3-dioxolanil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-tetrahidrofurilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-tetrahidrofurilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(2-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(4-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(2-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(2-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[2-(1-imidazolil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[2-(1-imidazolil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-furilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-furilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(1-metil-4-piperidil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(1-metil-4-piperidil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(2-, 3-, o 4-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-ciano-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-ciano-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[4-metil-2-piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(4-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-metil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)(3-trifluorometil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)(3-trifluorometil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)tieno[2,3-c]piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)[(2-, 3-, 4-, 5-, o 6-)tieno[2,3-c]piridil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)clorofenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2-, 3-, o 4-)metilfenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo 3-oxo-(2- o 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)benzoil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)[(2- o 3-)furilcarbonil]-1-piperazinilcarbonilo, y un grupo (2-, 3-, o 4-)benciloxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo.

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

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

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

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

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

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

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

Los ejemplos del grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano incluyen un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) arilo grupos que pueden tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados

del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano como se ha ilustrado antes. Sus ejemplos específicos incluyen un grupo (2-, 3-, 4- o 5-)tiazolidinilcarbonilo, un grupo (2-, 4- o 5-)[(2-, 3- o 4-)metoxifenil]-3-tiazolidinilcarbonilo y un grupo (2-, 4- o 5-)[(2-, 3- o 4-)cianofenil]-3-tiazolidinilcarbonilo.

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

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

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

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

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

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

- 60 Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinilcarbonilalquilo inferior cuyo radical alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado antes (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado antes (grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo. Sus ejemplos

específicos incluyen un grupo (1- o 2-)piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 1-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 3-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]propilo, un grupo 4-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]butilo, un grupo 5-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]pentilo, un grupo 6-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-(1- o 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1- o 2-)piperazinilcarbonil]propilo, un grupo 4-metil-1-piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(4-metil-2-piperazinilcarbonil)etilo, un grupo 3-(2-etil-1-piperazinilcarbonil)propilo, un grupo 4-(3-n-propil-1-piperazinilcarbonil)butilo, un grupo 5-(4-n-butiril-1-piperazinilcarbonil)pentilo, un grupo 6-(1-n-pentil-2-piperazinilcarbonil)hexilo, un grupo 2-n-hexil-2-piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(3-isobutil-2-piperazinilcarbonil)etilo, y un grupo 3-(4-terc-butil-2-piperazinilcarbonil)propilo.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

(1) un grupo heteromonocíclico de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros saturado que tiene de 1 a 4

(preferiblemente de 1 a 2) átomos de nitrógeno (por ejemplo, un grupo pirrolidinilo, un grupo imidazolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo hexahidropirimidinilo, un grupo piperazinilo, un grupo azepanilo y un grupo azocanilo);

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

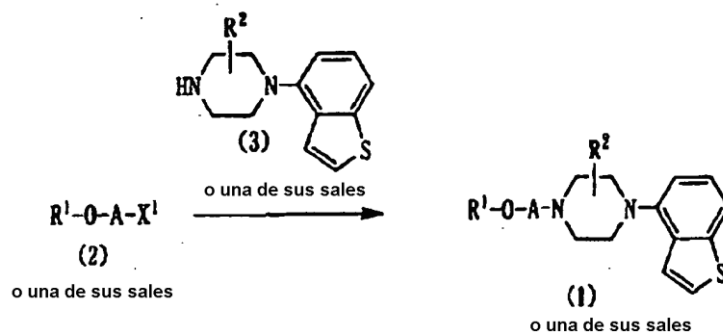
20 Los ejemplos del grupo benzoxatiolilo incluyen un grupo (2-, 4-, 5-, 6- o 7-)-benzo[d][1,3]oxatiolilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-3H-benzo[c][1,2]oxatiolilo y, un grupo (3-, 4-, 5-, 6- o 7-)-3H-benzo[d][1,2]oxatiolilo.

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

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

[Fórmula 4]

Fórmula de Reacción 1



30 donde R¹, R² y A son los mismos que se han definido antes; y X¹ 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 halógeno incluyen un grupo alcano(inferior)sulfonilo, un grupo arilsulfonilo, y un grupo aralquilsulfonilo.

35 El átomo de halógeno representado por X¹ en la fórmula general (2) es un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

40 Los ejemplos específicos del grupo alcano(inferior)sulfonilo representado por X¹ incluyen un grupo alcanosulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como un grupo metanosulfonilo etanosulfonilo, un grupo isopropanosulfonilo, un grupo n-propanosulfonilo, un grupo n-butanosulfonilo, un grupo terc-butanosulfonilo, un grupo n-pentanosulfonilo, y un grupo n-hexanosulfonilo.

45 Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo representado por X¹ incluyen un grupo fenilsulfonilo y un grupo naftilsulfonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo nitro, y un átomo de halógeno, en el anillo de fenilo. Los ejemplos específicos del

grupo fenilsulfoniloxi que puede tener un sustituyente incluyen un grupo fenilsulfoniloxi, un grupo 4-metilfenilsulfoniloxi, un grupo 2-metilfenilsulfoniloxi, un grupo 4-nitrofenilsulfoniloxi, un grupo 4-metoxifenilsulfoniloxi, un grupo 2-nitrofenilsulfoniloxi, y un grupo 3-clorofenilsulfoniloxi. Los ejemplos específicos del grupo naftilsulfoniloxi incluyen un grupo α -naftilsulfoniloxi y un grupo β -naftilsulfoniloxi.

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

Los ejemplos específicos del grupo alkilsulfoniloxi sustituido con un grupo fenilo como se ha mencionado antes incluyen un grupo bencilsulfoniloxi, un grupo 2-feniletilsulfoniloxi, un grupo 4-fenilbutilsulfoniloxi, un grupo 2-metilbencilsulfoniloxi, un grupo 4-metoxibencilsulfoniloxi, un grupo 4-nitrobencilsulfoniloxi, y un grupo 3-clorobencilsulfoniloxi. Los ejemplos específicos del grupo alkilsulfoniloxi sustituido con un grupo naftilo incluyen un grupo α -naftilmetilsulfoniloxi y un grupo β -naftilmetilsulfoniloxi.

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

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

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

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

La reacción mencionada anteriormente se puede realizar, si fuera necesario, con la adición de un yoduro de metal alcalino que sirve como acelerador, tal como yoduro de potasio y yoduro de sodio.

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

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

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

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

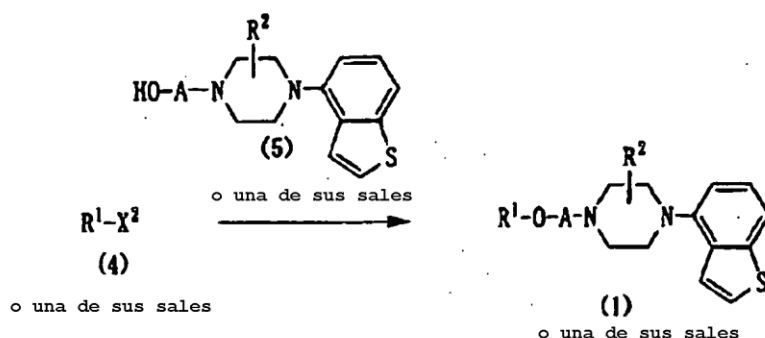
Se puede utilizar una sal de un compuesto (2) en lugar del compuesto (2) y una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3). Las sales de los compuestos (2) y (3) incluyen sales de adición de ácido. Estas sales de adición de

ácido se pueden preparar haciendo reaccionar un ácido farmacéuticamente aceptable con un compuesto (2) o (3). Los ejemplos del ácido utilizado en la presente memoria incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido clorhídrico, ácido fosfórico, y ácido bromhídrico; ácidos sulfónicos tales como ácido p-toluenosulfónico, ácido metanosulfónico, y ácido etanosulfónico; y ácidos orgánicos tales como ácido acético, ácido oxálico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido málico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, y ácido benzoico.

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

[Fórmula 5]

Fórmula de reacción 2



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

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

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

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

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

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

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

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

La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de

refrigeración o calentamiento, y preferiblemente se realiza a una temperatura de 0°C a aproximadamente 150°C durante 1 a 10 horas.

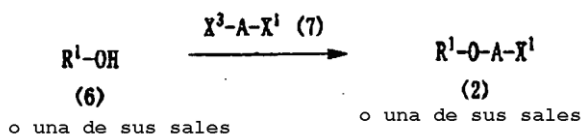
El compuesto (4) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

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

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

[Fórmula 6]

Fórmula de reacción 3



donde R^1 , X^1 y A son los mismos que se han definido antes; y X^3 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^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 que se han mencionado antes.

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

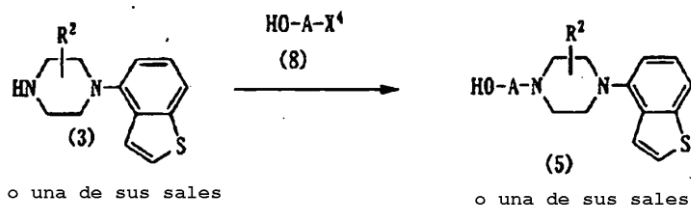
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

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

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

[Fórmula 7]

Fórmula de reacción 4



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

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

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

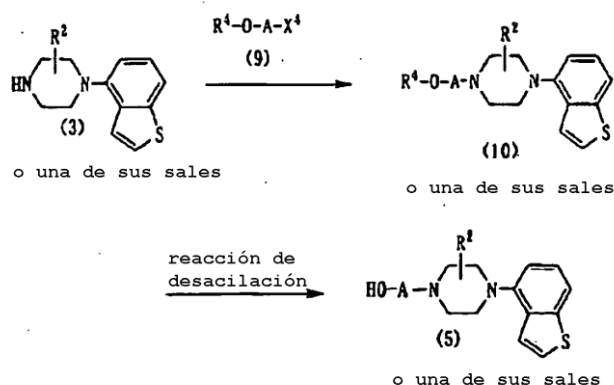
La reacción se puede realizar en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

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

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

[Fórmula 8]

Fórmula de reacción 5



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

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

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

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

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

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

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

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

Como método de reacción preferible, se puede mencionar una reacción convencional tal como la hidrólisis. La reacción de hidrólisis se puede realizar preferiblemente en presencia de una base o un ácido incluyendo un ácido de Lewis. Los ejemplos de la base preferible incluyen sales inorgánicas tales como un metal alcalino (p. ej., sodio y potasio), un hidrogenocarbonato de metal alcalino (p. ej., hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, e hidrogenocarbonato de potasio), un hidróxido de metal alcalino (p. ej., hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, e hidróxido de cesio), un carbonato de metal alcalino (p. ej., carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, y carbonato de cesio), un alcóxido inferior de metal alcalino (p. ej., metóxido de sodio y etóxido de sodio), e hidruros (p. ej., hidruro de sodio e hidruro de potasio); y bases orgánicas tales como una trialkilamina (p. ej., trimetilamina, trietilamina, y N-etildisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanilina, N-metilmorfolina, DBN, DABCO, y DBU. Como ácido preferible, se

puede hacer mención a ácidos orgánicos (tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido tricloroacético, ácido trifluoroacético) y ácidos inorgánicos (tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, cloruro de hidrógeno, y bromuro de hidrógeno). La reacción de eliminación utilizando un ácido de Lewis tal como un ácido trihaloacético (p. ej., ácido tricloroacético y ácido trifluoroacético) se puede realizar preferiblemente en presencia de un agente captador de cationes (p. ej., anisol y fenol).

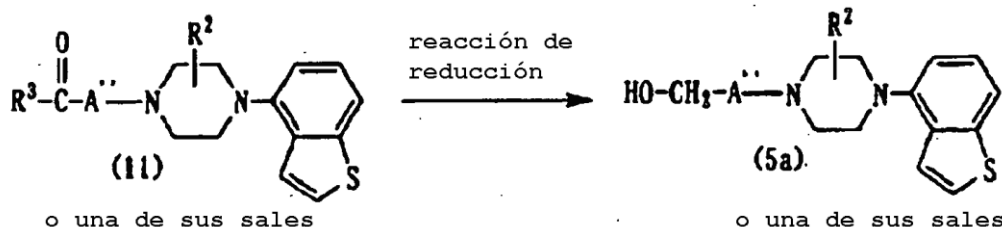
Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente con una base alcohólica tal como Metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona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

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

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

[Fórmula 9]

Fórmula de reacción 6



donde R^2 es el mismo que se ha definido antes; y R^3 es un grupo alcoxi inferior. A' representa un grupo alquileo C_1 a C_5 . El grupo alcoxi inferior representado por R^3 en la fórmula general (11) es el mismo que se ha definido antes.

Los ejemplos del grupo alquileo C_1 a C_5 representado por A' en las fórmulas generales (11) y (5a) incluyen un grupo alquileo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono tal como metileno, etileno, metilmetileno, trimetileno, tetrametileno, 1-metiltrimetileno, 2-metiltrimetileno, 3-metiltetrametileno, pentametileno, y 2,2-dimetiltrimetileno.

El compuesto (5a) se puede producir sometiendo un compuesto (referido más adelante como un compuesto (11)) representado por la fórmula general (11) a una reacción de reducción.

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

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

Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como un disolvente con una base alcohólica tal como Metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de

metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla disolvente de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y realizar preferiblemente de cerca de la temperatura ambiente a cerca del punto de ebullición del disolvente que se vaya a utilizar durante 0.5 a 75 horas.

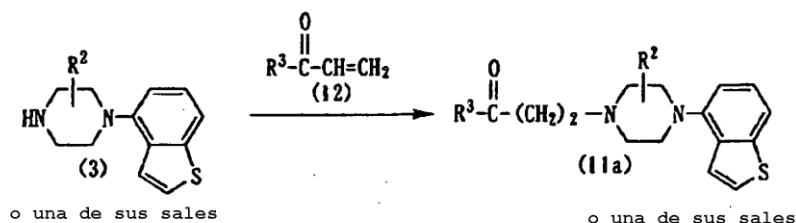
El compuesto (11) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

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

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

[Fórmula 10]

Fórmula de reacción 7



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

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

La reacción se puede realizar mediante el método mostrado en el Ejemplo de Referencia 5 o un método similar al mismo. Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que no puede afectar negativamente a la reacción, tal como agua, un disolvente con una base alcohólica tal como Metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol, y etilenglicol; un disolvente con una base cetónica tal como acetona y metiletilcetona; un disolvente con una base etérica tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico, y diglima; un disolvente con una base de éster tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar no protónico tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, y dimetilsulfóxido; un disolvente con una base de hidrocarburo halogenado tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción se puede realizar en una mezcla disolvente de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no está limitada particularmente y se puede realizar generalmente en condiciones de refrigeración o calentamiento, y realizar preferiblemente de cerca de la temperatura ambiente a cerca del punto de ebullición del disolvente que se vaya a utilizar durante 0.5 a 75 horas.

El compuesto (12) que sirve como sustancia de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que se puede producir fácilmente a partir de un compuesto conocido.

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

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

Las sales preferibles del compuesto (1) son sales farmacológicamente aceptables y sus ejemplos incluyen sales metálicas tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal de sodio, sal de potasio, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal de calcio, sal de magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas tales como sal de amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, etc.), hidrogenocarbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas tales como trialkil(inferior)aminas (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etildisopropilamina), piridina, quinolina,

piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilnilina, 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 hidrocloreuro, hidrobromuro, hidroyoduro, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, p-toluenosulfonato, glutamato.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

[Ventajas de la Invención]

Un compuesto de acuerdo con la presente invención tiene un efecto agonístico parcial sobre el receptor D_2 , un efecto antagonístico del receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la absorción de serotonina.

El efecto agonístico parcial de receptor D_2 hace referencia a una acción que desacelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando ésta aumenta, mientras que acelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando ésta disminuye. De esta manera, el agonista parcial del receptor D_2 actúa como un estabilizador del sistema de dopamina, que estabiliza la neurotransmisión DA en un estado normal. En virtud de este efecto, el compuesto de la presente invención produce un excelente efecto de mejora clínica sobre los síntomas causados por la neurotransmisión anómala de DA (aceleración o desaceleración) sin desarrollar efectos secundarios. En cuanto al excelente efecto de mejora clínica, se puede hacer mención a, los efectos mejoradores de los síntomas positivos y negativos, del deterioro cognitivo y de los síntomas depresivos (véanse Michio Toru, *Psychiatry*, Vol. 46, páginas 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi y Hirose Takeshi, *Brain Science*, vol. 25, páginas 579-583 (2004); y Harrison, T. S. y Perry, C.M.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004).

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

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

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

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

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

Por lo tanto, un compuesto de la presente invención es extremadamente eficaz para mejorar diferentes clases de trastornos del sistema nervioso central tales como esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y trastorno bipolar de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno de ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico, trastorno por pánico, agorafobia, fobia social, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno por estrés post-

traumático, trastorno de ansiedad generalizado, trastorno de estrés agudo, etc.); trastorno somatomorfo (por ejemplo, histeria, trastorno de somatización, trastorno de conversión, trastorno por dolor, hipocondriasis, etc.); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de la excitación sexual, disfunción eréctil, etc.); trastorno de la conducta alimentaria (por ejemplo, anorexia nerviosa, bulimia nerviosa, etc.); trastorno del sueño; trastorno de adaptación; trastorno relacionado con sustancias (por ejemplo, abuso de alcohol, intoxicación alcohólica, adicción a fármacos, intoxicación con estimulantes, narcotismo, etc.); anhedonia (por ejemplo, anhedonia iatrogénica, anhedonia de causa psíquica o mental, anhedonia asociada a depresión, y anhedonia asociada a esquizofrenia, etc.); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

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

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

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

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

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

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

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

Para el moldeo en forma de comprimido, se pueden utilizar generalmente varias sustancias bien conocidas convencionalmente como portador en la técnica. Como ejemplos, se pueden utilizar, por ejemplo, un excipiente tal como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina, silicato; un aglutinante tal como agua, etanol, propanol, jarabe simple, disolución de glucosa, almidón líquido, disolución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metilcelulosa, fosfato de potasio, polivinilpirrolidona; un agente disgregante tal como almidón seco, alginato de sodio, polvo de agar, polvo de laminaria, hidrogenocarbonato sódico, carbonato de calcio, ésteres de ácidos grasos y polioxietileno-sorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, lactosa; un agente para prevenir la disgregación, estearina, manteca de cacao, aceite

hidrogenado; un sorbefaciente tal como una base de amonio cuaternario, laurilsulfato de sodio; un agente humectante tal como glicerina, almidón; un agente absorbente tal como almidón, lactosa, caolín, bentonita, sílice coloidal; un lubricante tal como talco purificado, estearato, polvo de borato, polietilenglicol. Además, el comprimido puede ser un comprimido proporcionado con un revestimiento convencional según se requiera, por ejemplo, un comprimido revestido de azúcar, un comprimido encapsulado con gelatina, un comprimido con revestimiento entérico, un comprimido con revestimiento pelicular o un comprimido bicapa, o un comprimido multicapa.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

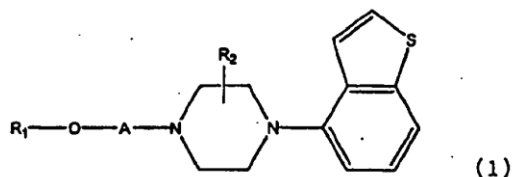
Por lo tanto, los compuestos de la presente invención tienen un amplio espectro de tratamiento para, y excelente efecto clínico sobre, la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central.

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

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

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

[Fórmula 1]



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

R¹ representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre y seleccionado del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, un grupo imidazolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo hexahidropirimidinilo, un grupo piperazinilo, un grupo azepanilo, un grupo azocanilo, un grupo pirrolilo, un grupo dihidropirrolilo, un grupo imidazolilo, un grupo dihidroimidazolilo, un grupo triazolilo, un grupo dihidrotriazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo dihidropiridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo dihidropirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo dihidropirazinilo, un grupo piridazinilo, un grupo tetrazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo oxazolidinilo, un grupo isoxazolidinilo, un grupo morfolinilo, un grupo tiazolilo, un grupo dihidrotiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo dihidrotiazinilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahydrofurilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo piranilo, un grupo tetrahidrotiofurilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo tienyl and un grupo tiopiranilo (más preferiblemente, un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre y seleccionado del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo piranilo y un grupo tienilo; y más preferiblemente, un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre y seleccionado del grupo que consiste en un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo y un grupo tiazolilo; and

donde, en el grupo heterocíclico representado por R¹, pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 5 (más preferiblemente de 1 a 3) grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo :

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

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

- (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcoxi inferior,
- (iii) un grupo hidroxialquilo inferior,
- (iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,
- (v) un grupo fenoxialquilo inferior,
- (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (vii) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo (más preferiblemente un grupo N,N-dialquil(inferior)aminoalquilo inferior, un grupo N-alcanilo(inferior)-aminoalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)-aminoalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)-N-benzilaminoalquilo inferior, o un grupo N-carbamoilaminoalquilo inferior)
- (viii) un grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos, y más preferiblemente 1 grupo) seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo fenilalcoxi inferior como sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,
- (x) un grupo alqueno inferior
- (xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxi inferior como sustituyente o sustituyentes (más preferiblemente un grupo carbamoilalquilo inferior, un grupo dicarbamoilalquilo inferior, un grupo N-alquil(inferior)carbamoilalquilo inferior, un grupo N,N-dialquil(inferior)-carbamoilalquilo inferior, un grupo N-[alquil(inferior)alquil(inferior)fenil]-carbamoilalquilo inferior, o un grupo N-[alcoxi(inferior)fenil]carbamoilalquilo inferior),
- (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(inferior)carbonilo,
- (xiii) un grupo furilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo furilo),
- (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo inferior,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo inferior,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo inferior,
- (xvii) un grupo pirrolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo dihidropirazolilalquilo inferior que puede tener un solo grupo oxo,
- (xix) un grupo pirazolilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolilalquilo inferior,
- (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,
- (xxii) un grupo pirazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyentes en el grupo pirazinilo),
- (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo),
- (xxv) un grupo piperazinilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinilalquilo inferior,
- (xxvii) un grupo tienilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupo alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolilalquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo inferior,
- (xxx) un grupo benzopiranilalquilo inferior (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
- (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo inferior,
- (xxxii) un grupo indolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior),
- (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes (preferiblemente 1 sustituyente) seleccionado del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo en el grupo alquilo inferior,
- (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del

grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior como sustituyente o sustituyentes,

(xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanoilo inferior y un grupo benzoilo como sustituyente,

(xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanoilo inferior y un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno en el grupo fenilo,

(xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo,

(xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,

(xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente,

(xl) un grupo tiazolilo,

(xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,

(xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior,

(xliii) un grupo indazolilo,

(xliv) un grupo indolilo,

(xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,

(xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente,

(xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,

(xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo inferior,

(xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior; un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno; un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno; un grupo alquenilo inferior; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(inferior)tio; un grupo alcanoilo inferior; un grupo alcoxi(inferior)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo fenilo; un grupo fenilalcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo tiazolidinilalquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,

(l) un grupo cianoalquilo inferior,

(li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,

(lii) un grupo alquil(inferior)amino sustituido con halógeno,

(liii) un grupo alquil(inferior)tioalquilo inferior,

(liv) un grupo amidino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,

(lv) un grupo amidinoalquilo inferior,

(lvi) un grupo alquilen(inferior)oxialquilo inferior,

(lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferiblemente 1 sustituyente) seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo,

(lviii) un grupo fenilalquenilo inferior,

(lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior (más preferiblemente un grupo N-alquil(inferior)-N-[alquil(inferior)piridil]amino),

(lx) un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo como sustituyente en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior),

(lxi) un grupo alquinilo inferior,

(lxii) un grupo fenoxialquilo inferior (que puede tener como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior, un grupo N-alcoxi(inferior)-N-alquil(inferior)carbamoilo y un grupo oxopirrolidinilo),

(lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener un solo grupo oxo,

- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
 (lxv) un grupo fenilalcoxi(inferior)alquilo inferior,
 (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
 (lxvii) un grupo azetidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo)
 5 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
 (lxviii) un grupo azetidinilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo)
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior y un grupo benzoilo,
 (lxix) un grupo tetrazolilo,
 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 10 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos)
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquil(inferior)tio,
 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos carbamoilo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
 15 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
 (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos
 alcoxi(inferior)carbonilo, y
 20 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos
 alquilo inferior
- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
 25 un grupo alcanilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo
 sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior como
 sustituyente o sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con
 30 halógeno,
 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupo alquilo inferior,
 (32) un grupo sulfamoilo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo (más preferiblemente un grupo oxazolidinilo
 sustituido con un solo grupo oxo),
 35 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en
 un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 40 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aun más preferiblemente 1)
 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un
 grupo alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2
 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo
 45 alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior (más preferiblemente un grupo
 piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aun más preferiblemente 1) sustituyentes
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo
 alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo N-alquil(inferior)amino,
 un grupo N,N-dialquil(inferior)amino, un grupo N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alquil(inferior)-N-
 50 alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)amino, y un grupo N-
 alcanilo(inferior)aminoalcanilo-(inferior)amino),
 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) sustituyentes
 seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo
 inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo carboxialquilo inferior, un grupo alquil(inferior)carbamoilalquilo
 inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un
 55 grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un
 grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un
 grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (más preferiblemente
 1 grupo) seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior, un grupo
 60 alcoxi(inferior)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como
 sustituyentes de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior), un grupo 1,4-dioxa-8-
 azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente
 un solo grupo alquilo inferior como sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxi
 inferior, un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo
 benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxi inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2

grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo), un grupo fenilo (en los cuales pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior y un grupo hidroxilo), un grupo fenilo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo inferior (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), y un grupo benzoilo (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior),

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

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

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

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

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

(46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,

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

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

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

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

(51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,

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

(54) un grupo morfolinilalquilo inferior,

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

(56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo inferior,

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

- (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxi inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi(inferior)alcoxi inferior,
 5 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo (más preferiblemente, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alquilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo alcanilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcanilo inferior, y un grupo piperazinilo sustituido con un solo grupo oxo y un solo grupo alcoxi(inferior)carbonilo),
 10 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
 (64) un grupo tetrahidropiranylcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos piridilo,
 15 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo tioxo, y
 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

En la fórmula general (1), R^1 es preferiblemente un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, o un grupo tiazolilo. El anillo de cada uno de los grupos está sustituido preferiblemente con 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en:

- (1) un grupo alquilo inferior,
 (4) un grupo alcoxi inferior,
 25 (10) un grupo hidroxialquilo inferior,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, a un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alquil(inferior)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(inferior)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo inferior, un grupo alcanilo(inferior)aminoalcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilaminoalcanilo inferior como sustituyente o sustituyentes,
 30 (21) un grupo alcoxi(inferior)carbonilo,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) de más abajo:
 35 (i) un grupo alquilo inferior,
 (ii) un grupo alcoxi inferior,
 (iv) un grupo alcoxi(inferior)alquilo inferior,
 (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alquil(inferior)carbonilo,
 (xxi) un grupo piridilalquilo inferior,

- (29) un grupo aminoalquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, un grupo alcanilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
 45 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 50 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (39) un grupo piperidilo que puede tener un solo sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquil(inferior)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo N-alquil(inferior)amino, un grupo N,N-di-alquil(inferior)amino, un grupo N-alcanilo(inferior)amino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcoxi(inferior)carbonilamino, un grupo N-alquil(inferior)-N-alcanilo(inferior)amino, y un grupo N-alcanilo(inferior)aminoalcanilo(inferior)amino,
 55 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxi(inferior)carbonilo, y
 60 (62) un grupo morfolinilo.

EJEMPLO

A continuación, la presente invención se aclarará adicionalmente con referencia a los Ejemplos de Referencia, los

Ejemplos y los Ejemplos Experimentales Farmacológicos y los Ejemplos de Preparación.

Ejemplo de Referencia 1

5 Síntesis de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina

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

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

Punto de fusión 276-280°C

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

Ejemplo de Referencia 2

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

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

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

Ejemplo de Referencia 3

35 Síntesis de dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina

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

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

Ejemplo de Referencia 4

50 Síntesis de dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazina

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

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

Ejemplo de Referencia 5

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

Se añadieron 5,05 g (19,8 mmoles) de hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina a una disolución acuosa de hidróxido de sodio, y la mezcla se extrajo con diclorometano. La disolución de extracción se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se disolvió en 50 ml de etanol y a esto se añadió

acrilato de etilo (2,44 ml, 21,8 mmoles), y a continuación la mezcla de reacción se sometió a reflujo calentando durante 4 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. Se añadió éter diisopropílico al residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con éter diisopropílico, y se secó para obtener 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo (5,26 g) en forma de polvo de color blanco.

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

Ejemplo de Referencia 6

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

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

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

Ejemplo de Referencia 7

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

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

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

Ejemplo de Referencia 8

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

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

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

Ejemplo de Referencia 9

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

Se suspendieron 3,56 g (12,9 mmoles) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol en 30 ml de diclorometano, y a esto se añadieron tetracloruro de carbono (30 ml) y trifetilfosfina (4,06 g, 15,5 mmoles). La mezcla se sometió a reflujo calentando durante 3 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después se añadieron a esto Metanol y diclorometano para homogeneizar la mezcla. Se añadió gel de sílice (30 g) a la disolución, y el disolvente se evaporó a presión reducida. El residuo obtenido se cargó en una columna de gel de sílice (300 g) y se extrajo con una mezcla disolvente de n-hexano:acetato de etilo = 2:1. La disolución de extracción

se concentró a presión reducida para obtener 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina (2,36 g) en forma de un aceite incoloro.

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

Ejemplo de Referencia 10

Síntesis de 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo

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

Ejemplo de Referencia 11

Síntesis de 6-hidroxipirimidin-4-carboxilato de etilo

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

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

Ejemplo de Referencia 12

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

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

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

Ejemplo de Referencia 13

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

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

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

Ejemplo de Referencia 14

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

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,53 g, 3,5 mmoles), hidrocloreto de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida

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

Ejemplo de Referencia 15

Síntesis de 2-clorotiazol-4-carboxamida

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

Ejemplo de Referencia 16

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

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

RMN ^2H (CDCl_3) δ ppm: 3,00 (3H, d, J = 4,9 Hz), 5,92 (1H, ancho), 7,84 (1H, ancho).

Ejemplo de Referencia 17

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

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

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,53 (6H, s), 3,78 (3H, s), 6,40 (1H, d, J = 2,8 Hz), 6,52 (1H, dd, J = 2,8 Hz, J = 8,8 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,7 Hz), 8,66 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 18

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

Una disolución en diclorometano (36 ml) de tribromuro de boro 2M se añadió gota a gota a una disolución en diclorometano de 6-metoxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (5,0 g, 26 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó durante la noche. Se añadió agua a la disolución de reacción para descomponer los reactivos presentes en exceso. La disolución de reacción se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 2:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 6-hidroxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (4,02 g) en forma de polvo de color blanco.

RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1,34 (6H, s), 6,25-6,40 (2H, m), 6,70 (1H, d, J = 8,5 Hz), 9,09 (1H, s), 10,41 (1H, s ancho).

Ejemplo de Referencia 19

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

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

Polvo de color blanco

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

Ejemplo de Referencia 20

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

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

Ejemplo de Referencia 21

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

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

Polvo de color pardo

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

Ejemplo de Referencia 22

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

Se añadió borohidruro de sodio (0,28 g, 6,9 mmoles) a una disolución en THF (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,2 g 13,8 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 2 horas. Se añadió ácido acético a la disolución de reacción para ajustar el pH a 3, se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 5:1 $\rightarrow$ 1:1) y se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol (3,23 g) en forma de aceite de color amarillo claro. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 3,88 (3H, s), 4,71 (2H, s), 6,94 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,03 (1H, d, J = 2,0 Hz).

Ejemplo de Referencia 23

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

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

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

Ejemplo de Referencia 24

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

Se añadieron 2-oxazolidinona (0,38 g, 4,36 mmoles), dipaladio-tris(dibencilidenacetona) (0,17 g, 0,18 mmoles), 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfina)xanteno (XANTPHOS) (0,32 g, 0,55 mmoles) y carbonato de cesio (1,66 g, 5,1 mmoles) a una disolución en dioxano (20 ml) de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído (1,0 g, 3,6 mmoles) y la

mezcla se agitó a 100°C durante 24 horas en atmósfera de argón. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió acetato de etilo. La mezcla se filtró con cerite. El producto filtrado se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 4:1 → 1:1). El producto purificado se

concentró a presión reducida. Se añadieron acetato de etilo y éter diisopropílico al residuo. La materia insoluble purificada de este modo se obtuvo mediante filtración y se secó para obtener 3-metoxi-2-metoximetoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (0,5 g) en forma de polvo de color blanco.

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

Ejemplo de Referencia 25

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

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

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

Ejemplo de Referencia 26

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

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

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

Ejemplo de Referencia 27

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

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

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

Ejemplo de Referencia 28

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

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

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

Ejemplo de Referencia 29

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

El compuesto del título se obtuvo utilizando 5-bromo-3-metoxi-2-metoximetoxibenzaldehído y 2-pirrolidona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 25. RMN ^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).

Ejemplo de Referencia 30

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

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

RMN ^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).

Ejemplo de Referencia 31

Síntesis de 3,4-diacetoxi-5-metilbenzaldehído

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

RMN ^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).

Ejemplo de Referencia 32

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

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

Polvo de color blanco

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

Ejemplo de Referencia 33

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

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

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

Ejemplo de Referencia 34

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

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

Polvo de color pardo claro

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

Ejemplo de Referencia 35**Síntesis de 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo**

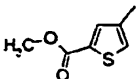
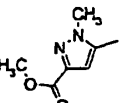
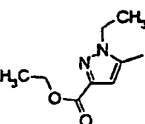
- 5 Se añadieron carbonato de cesio (2,08 g, 6,4 mmoles) y 1-bromo-3-cloropropano (1,6 ml) a una disolución en DMF (5 ml) de 5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (0,83 g, 5,3 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 21 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 100:1 → 4:1). El producto purificado se concentró hasta sequedad a presión reducida para obtener 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g) en forma de un sólido de color blanco.
- 10 RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,21-2,32 (2H, m), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,72 (2H, s), 3,91 (3H, s), 4,24 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,10 (1H, s).

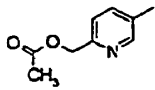
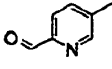
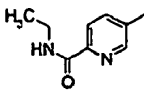
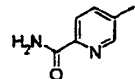
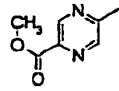
Ejemplo de Referencia 36**Síntesis de 7-(3-cloropropoxi)-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona**

- El compuesto del título se obtuvo utilizando 7-hidroxi-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona y 1-bromo-3-cloropropano de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 35.
- 20 Cristales en forma de agujas de color pardo claro (etanol-n-hexano)
Punto de fusión: 119-120°C

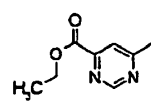
- Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 1 a 12 se produjeron utilizando sustancias de partida apropiadas de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia de 1 a 36.
- 25

[Tabla 1]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de Referencia	R1	RMN
37		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,15-2,30 (2H, m), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,87 (3H, s), 4,05-4,15 (2H, m), 6,55 (1H, d, J = 1,8 Hz), 7,42 (1H, d, J = 1,8 Hz),
38		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,21-2,31 (2H, m), 3,70 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,95 (3H, s), 4,46 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,54 (1H, s)
39		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,21-2,32 (2H, m), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,72 (2H, s), 3,91 (3H, s), 4,24 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,10 (1H, s)
40		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,39 (3H, t, J = 7,0 Hz), 1,39 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,22-2,32 (2H, m), 3,71 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,10(2H, q, J = 7,3 Hz), 4,24(2H, t, J = 5,8 Hz), 4,39(2H, c, J = 7,0 Hz), 6,08 (1H, s)
41		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 220-229 (2H, m), 246 (3H, s), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,12 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,84 (1H, dd, J = 2,5 Hz, 8,8 Hz), 7,13 (1H, d, J = 8,8 Hz), 8,07 (1H, d, J = 2,5 Hz)
42		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,13

		(3H, s), 2,21-2,31 (2H, m), 3,76 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,18 (2H, t, J = 5,8 Hz), 5,17 (2H, s), 7,19-7,32 (2H, m), 8,30 (1H, d, J = 25 Hz)
43		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,27-2,36 (2H, m), 3,77 (2H, t, J = 6,0 Hz), 4,28 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,33 (1H, dd, J = 25 Hz, 8,5 Hz), 7,97 (1H, dd, J = 2,5 Hz, 8,5 Hz), 8,44 (1H, d, J = 2,5 Hz), 10,00 (1H, s)
44		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,26 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,24,2,34 (2H, m), 3,55 (2H, dq, J = 6,0 Hz, 7,3 Hz), 3,77 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,22 (2H, t, J = 5,8 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 2,3 Hz, 8,8 Hz), 7,83 (1H, ancho), 8,18 (1H, d, J = 8,8 Hz), 8,20 (1H, d, J = 2,3 Hz)
45		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,25-2,34 (2H, m), 3,77 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,23 (2H, t, J = 5,8 Hz), 5,48 (1H, ancho), 7,31 (1H, dd, J = 2,3 Hz, 8,8 Hz), 7,68 (1H, ancho), 8,16 (1H, d, J = 8,8 Hz), 8,23 (1H, d, J = 2,3 Hz)
46		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,24-2,34 (2H, m), 3,73 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,00 (3H, s), 4,58 (2H, t, J = 6,0 Hz), 8,28 (1H, d, J = 1,3 Hz), 8,87 (1H, d, J = 1,3 Hz)

[Tabla 2]

R1-O-(CH ₂) ₃ -Cl		
Ejemplo de Referencia	R1	RMN
47		RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,44 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,22-2,31 (2H, m), 3,72 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,48 (2H, c, J = 7,0 Hz), 4,59 (2H, t, J = 6,0 Hz), 7,44 (1H, d, J = 1,0 Hz), 8,90 (1H, o, J = 1,0 Hz)

[Tabla 3]

R1-O-(CH ₂) ₄ -Cl		
Ejemplo de Referencia	R1	RMN
48		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,85-2,05 (4H, m), 3,62 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,33 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,72 (1H, d, J = 8,3 Hz), 6,85 (1H, dt, J = 0,8, 5,1 Hz), 7,56 (1H, dt, J = 2,0, 8,4 Hz), 8,14 (1H, dd, J = 5,1, 1,4 Hz),
49		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,95-2,05 (4H, m), 3,62 (2H, t, J = 6,2 Hz), 4,05 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,80 (2H, dd, J = 4,8, 1,6 Hz), 8,43 (2H, dd, J = 4,9, 1,5 Hz),

Ejemplo 1**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 mmoles), hidrocloreuro de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina (1,35 g, 5,3 mmoles), carbonato de potasio (1,74, 12,6 mmoles) e Yoduro de sodio (0,75 g, 5,0 mmoles) a DMF (12 ml), y la mezcla se agitó a 80°C durante 3 horas. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a esto se añadió agua, y a continuación, se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (n-hexano : acetato de etilo = 7:3 → diclorometano : Metanol = 100:3). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener una sustancia oleosa de color amarillo claro (1,97 g). La sustancia oleosa se dejó estar a temperatura ambiente para obtener una sustancia sólida, que se lavó con éter diisopropílico y se secó para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxil-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,49 g)

Punto de fusión: 109,0-110,5°C

MS 414 (M⁺)

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

Se añadió una disolución acuosa 6N de hidróxido de sodio (2 ml) a una disolución etanólica (10 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,62 g, 3,9 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. A continuación, se añadió ácido clorhídrico 6N (2 ml) a la disolución de reacción enfriando con hielo y la mezcla disolvente se agitó. Se añadió diclorometano a la disolución de reacción y el precipitado se obtuvo mediante filtración. El producto filtrado se separó y la fase orgánica se concentró a presión reducida. La torta del filtro y el residuo se combinaron, se lavaron con agua y se secaron para obtener ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (1,53 g) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 119,5-118,0°C

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

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

benzo[b]tiofen-9-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida (0,24 g) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 228,0-232,5°C (descomp.)

5 Ejemplo 4

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

10 El compuesto del título se obtuvo utilizando ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico y cloruro de amonio de la misma manera que en el Ejemplo 3.

Polvo de color blanco (acetato de etilo-éter diisopropílico)

Punto de fusión: 186,5-188,5°C

15 Ejemplo 5

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

El compuesto del título se obtuvo utilizando 4-(3-cloropropoxi)-3-metoxi-5,N-dimetilbenzamida e hidrocloreuro de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina de la misma manera que en el Ejemplo 1.

20 Polvo de color blanco (acetato de etilo-Metanol)

Punto de fusión: 141,5-142,5°C

Ejemplo 6

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

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

35 Punto de fusión: 199,5-202,5°C

40 Ejemplo 7

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

El compuesto del título se obtuvo utilizando 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmol) and 2-clorotiazol-4-carboxamida de la misma manera que en el Ejemplo 6.

45 Polvo de color blanco (acetato de etilo-éter diisopropílico)

Punto de fusión: 139,5-140,5°C

Ejemplo 8 (Referencia)

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

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

60 Punto de fusión: 155,0-158,0°C

MS 411 (M⁺)

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

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

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

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

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

Punto de fusión: 239,5-244,0°C (descomp.)

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

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

Punto de fusión: 230,0-234,0°C (descomp.)

Ejemplo 13 (Referencia)**Síntesis de hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilfenilamina**

Se añadieron formalina (37%, 0,29 ml, 3,9 mmoles) y cianoborohidruro de sodio (0,21 g, 3,1 mmoles) a una disolución metanólica (6 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenilamina (0,32 g, 0,78 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a 0°C durante 15 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió ácido acético (0,18 ml, 3,1 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió una disolución acuosa de carbonato de potasio a la disolución de reacción enfriando con hielo, y la extracción se realizó con acetato de etilo. La sustancia extraída se secó sobre sulfato de magnesio. La disolución de reacción se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-

hexano:etilo acetato de = 11:1 → 3:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadió una disolución de ácido clorhídrico 4N y acetato de etilo a una disolución en acetato de etilo del residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración para obtener hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilanilina (137 mg) en forma de polvo de color blanco.

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

Ejemplo 14 (Referencia)

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

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

Punto de fusión 207,9-208,8°C

Ejemplo 15 (Referencia)

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

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

Punto de fusión; 248,1-249,6°C

Ejemplo 16 (Referencia)

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

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

MS: 438 (M⁺).

Una disolución de elución de diclorometano/Metanol (10:1) se hizo pasar a través de a columna de la cromatografía

en columna de gel de sílice. El producto eluido obtenido se concentró a presión reducida y a continuación el residuo se disolvió en acetato de etilo (5 ml). A esto, se le añadió una disolución (0,226 ml) de ácido clorhídrico 1N/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo mediante filtración, se lavó con acetato de etilo, y se secó para obtener hidrocloreto de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinazolina (49 mg) en forma de un sólido de color blanco.
Punto de fusión: 203,1-204,4°C

Ejemplo 17 (Referencia)

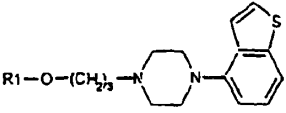
Síntesis de hidrocloreto de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-2,3-dihidro-1H-indol

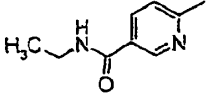
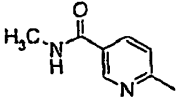
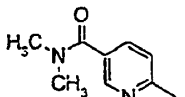
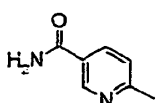
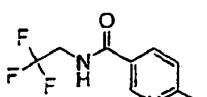
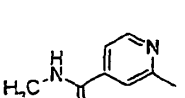
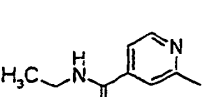
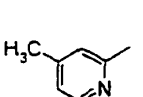
Se añadió trietilsilano (1,14 ml, 7,14 mmoles) a una disolución en ácido trifluoroacético (5 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-indol (228 mg, 0,71 mmoles) y la mezcla se agitó a 50°C durante 2 horas. La mezcla se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en diclorometano,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

Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 4 a 164 se produjeron utilizando sustancias de partida apropiadas de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia de 1 a 36 o los Ejemplos de 1 a 17 y 1751 a 1767.

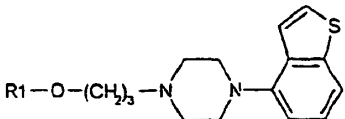
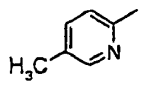
En las siguientes Tablas, se prepararon realmente los compuestos con propiedades físicas, tales como la forma cristalina, el p.f. (punto de fusión), la sal, el RMN H^1 y el EM (espectro de masas).

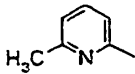
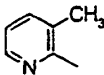
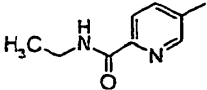
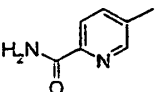
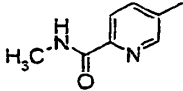
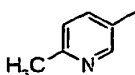
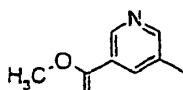
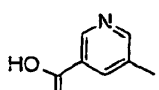
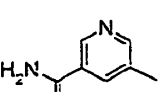
[Tabla 4]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
18		Sólido de color blanco (Etanol)	225- 228	Trihidrocloreto
19		Cristales en forma de agujas de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	165.0- 167.0	Hidrocloreto
20		Sólido de color blanco (Etanol)	204- 206	Hidrocloreto
21		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	201.5- 207.5	Hidrocloreto

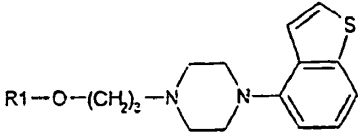
				
22		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	132.5-133.5	-
23		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	205.5-208.0	Hidrocioruro
24		Polvo de color blanco (2-propanol)	206.5-208.0	-
25		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	201.5-204.0	Hidrocioruro
26		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	155.5-162.0	Hidrocioruro
27		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	140.0-141.5	Hidrocioruro
28		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	192-194	Dihidrocioruro

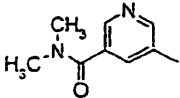
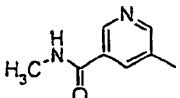
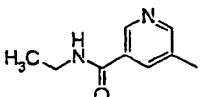
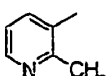
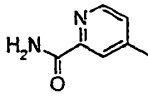
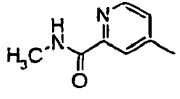
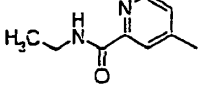
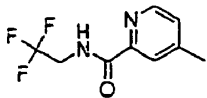
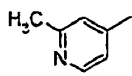
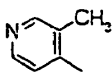
[Tabla 5]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
29		Polvo de color amarillo claro (Etanol)	201-203	Dihidrocioruro
30		Polvo de color blanco (Etanol)	201-203	Hidrocioruro

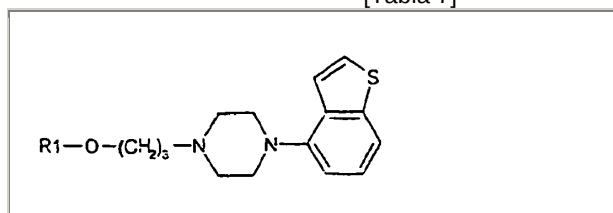
				
31		Polvo de color blanco (Etanol)	214.0-215.0	Hidrocloreuro
32		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	131.5-132.0	-
33		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	193.0-194.0	-
34		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	128.0-129.5	-
35		Polvo de color blanco (Etanol)	234.0-236.0	Hidrocloreuro
36		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	224.0-226.0	Dihidrocloreuro
37		Polvo de color blanco (agua)	230.0 (desc.)	Hidrocloreuro
38		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	171.0-174.5	-

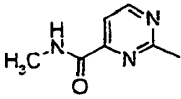
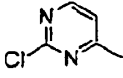
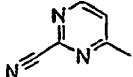
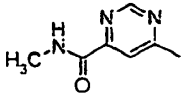
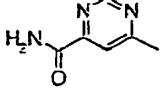
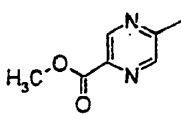
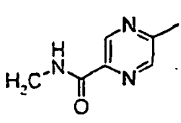
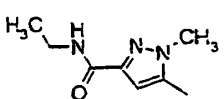
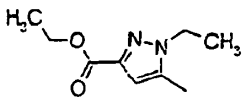
[Tabla 6]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
39		Polvo de color amarillo claro	166.0 (desc.)	Dihidrocloreuro

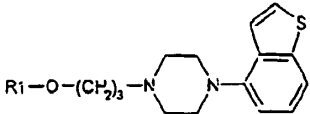
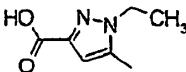
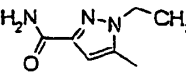
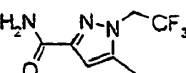
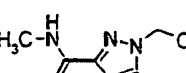
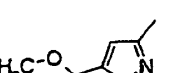
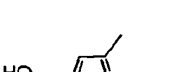
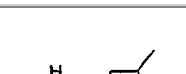
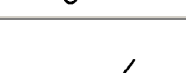
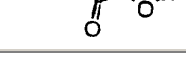
		(Acetato de etilo)		
40		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	198.5-204.0	Dihidrocloruro
41		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	211.5-214.5	Dihidrocloruro
42		Polvo de color blanco (Etanol)	241.0-243.0	Hidrocloruro
43		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	150.0-150.5	-
44		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	199.0-200.5	Dihidrocloruro
45		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	206.0-208.5	Hidrocloruro
46		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	208.0-213.0	Hidrocloruro
47		Polvo de color blanco (Etanol)	157-159	Hidrocloruro
48		Polvo de color blanco (Etanol)	197.0-199.0	Dihidrocloruro

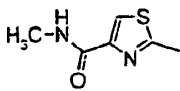
[Tabla 7]



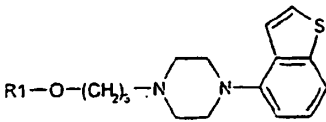
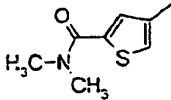
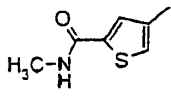
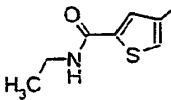
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
49		Polvo de color blanco (Etanol)	205-207	Hidrocloruro
50		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	178.0-182.5	Hidrocloruro
51		Polvo de color amarillo claro (acetato de etilo)	191.5-195.5	Hidrocloruro
52		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	112.0-115.5	-
53		Polvo de color blanco (Metanol)	205.0-209.5	Hidrocloruro
54		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	149.5-151.0	-
55		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	114.5-115.5	-
56		Polvo de color blanco (Metanol)	116.5-118.0	-
57		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210.5-214.5	Hidrocloruro
58		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo/éter isopropílico)	109.0-110.0	-

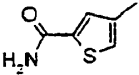
[Tabla 8]

				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
59		Polvo de color blanco (Etanol/agua)	129.0-131.0	-
60		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	247.5 (desc.)	Hidrocloruro
61		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	231.0-234.0	Hidrocloruro
62		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	245.5 (desc.)	Hidrocloruro
63		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	199.5-201.5	Hidrocloruro
64		Polvo de color blanco (Etanol/agua)	252.5-255.0 (desc.)	-
65		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	131.5-132.5	-
66		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	167.5-169.0	-
67		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	219.5-222.5 (desc.)	Hidrocloruro
68		Polvo de color amarillo claro (Acetato de etilo)	151.0-153.5	Hidrocloruro

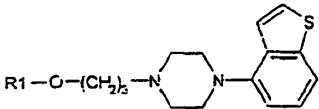
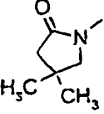
69		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	138.5-140.0	-
----	---	--	-------------	---

[Tabla 9]

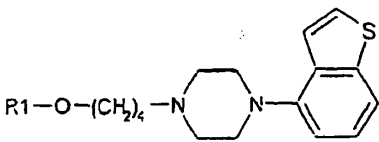
				
Ejemplo	R1	RMN	Sal	
70		RMN H ¹ (DMSO-d ₆) δ ppm: 2,10-2,30 (2H, m), 2,80-3,90 (16H, m), 4,09 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,88 (1H, d, J = 1,5 Hz), 6,96 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,17 (1H, d, J = 1,4 Hz), 7,31 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,48 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,6 Hz), 10,68 (1H, s ancho),	Hidrocloruro	
71		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,62 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,65-2,80 (4H, m), 2,98 (3H, d, J = 4,9 Hz), 3,15-3,25 (4H, m), 4,05 (2H, t, J = 6,3 Hz), 5,94 (1H, s ancho), 6,43 (1H, d, J = 1,8 Hz), 6,90 (1H, dd, J = 1,4, 7,6 Hz), 7,15 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz),	-	
72		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm 1,23 (3H, t, J = 7,3 Hz), 1,95-2,05 (2H, m), 2,61 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,65-2,80 (4H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,40-3,55 (2H, m), 4,04 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,01 (1H, s ancho), 6,43 (1H, d, J = 1,6 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,16 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz),	-	

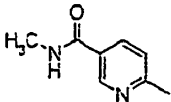
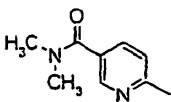
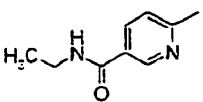
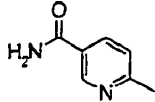
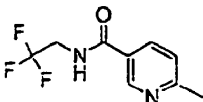
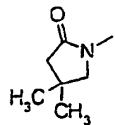
73		RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,63 (2H, t, $J = 7,3$ Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,06 (2H, t $J = 6,3$ Hz), 5,74 (2H, s ancho), 6,51 (1H, d $J = 1,7$ Hz), 6,90 (1H, dd, $J = 0,5$, 7,6 Hz), 7,19 (1H, d, $J = 1,7$ Hz), 7,28 (1H, dd, $J = 7,8$, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, $J = 8,0$ Hz),	-
----	---	--	---

[Tabla 10]

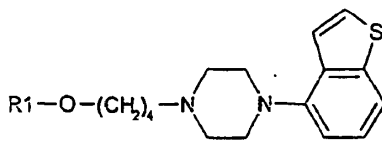
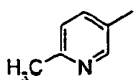
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
74		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	183- 186	Hidrocloreuro

[Tabla 11]

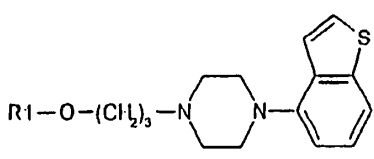
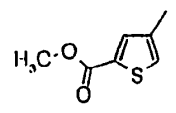
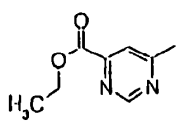
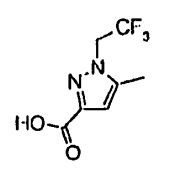
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
75		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	183,0- 185,0	Dihidrocloreuro
76		Polvo de color blanco (Etanol/ethylacetate)	205,0- 207,0	Hidrocloreuro
77		Polvo de color blanco	197,0- 199,0	Hidrocloreuro
78		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	166,5- 168,0	Hidrocloreuro

				
79		(Acetato de etilo)	196,0-201,0	Hidrocloruro
80		Polvo de color blanco	175,0-176,0	Hidrocloruro
81		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	150,0-154,5	-
82		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	172,0-175,0	Hidrocloruro
83		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ether)	201-205	Hidrocloruro

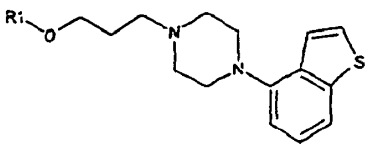
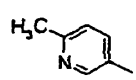
[Tabla 12]

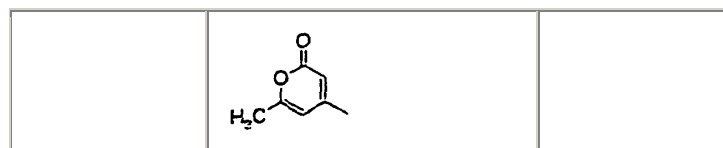
				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
84		Polvo de color blanco (Etanol)	195-197	Hidrocloruro
85		Polvo de color blanco (Etanol)	190-192	Hidrocloruro

[Tabla 13]

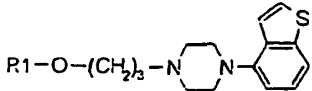
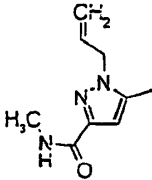
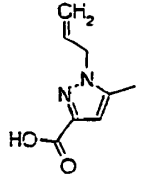
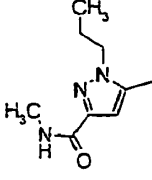
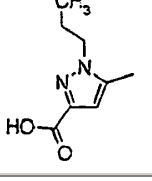
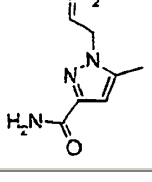
			
Ejemplo	R1	RMN	Sal
86		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,63 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,89 (3H, s), 4,00-4,10 (2H, m), 8,57 (1H, d, J = 1,9 Hz), 6,91 (1H, d, J = 7,0 Hz), 7,20-7,35 (2H, m), 7,35-7,50 (3H, m), 7,50 (1H, d, J = 8,0 Hz),	-
87		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,44 (3H, t, 7,0 Hz), 2,01-2,12 (2H, m), 2,03 (2H, t, J = 7,5 Hz), 2,67-2,81 (4H, m), 3,12-3,29 (4H, m), 4,44-4,55 (1H, m), 6,90 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,27 (1H, dd, J = 5,5 Hz, 7,5 Hz), 7,40 (2H, dd, J = 5,5 Hz, 8,0 Hz), 7,44 (1H, d, J = 1,0 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,90 (1H, d, J = 1,0 Hz)	-
88		RMN H ¹ (DMSO-d ₆) δ ppm : 1,83-2,00 (2H, m), 2,59-2,70 (4H, m), 3,00-3,15 (4H, m), 3,17 (1H, d, J = 4,5 Hz), 3,31 (1H, d, J = 4,5 Hz), 4,15 (2H, t, J = 6,0 Hz), 4,77 (2H, q, J = 8,8 Hz), 0,90 (1H, d, J = 7,3 Hz), 7,27 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,40 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,01 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,09 (1H, d, J = 5,5 Hz),	-

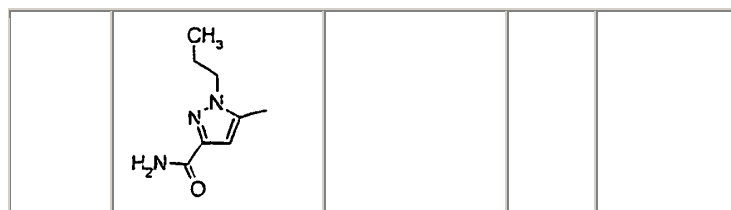
[Tabla 14]

		
Ejemplo	R1	MS (M+1)
89	-3-PIRIDILO	354
90		368
91		385

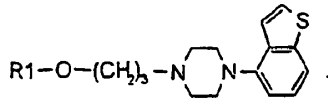
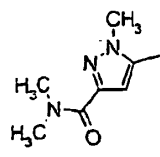
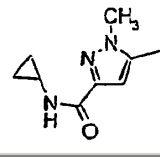
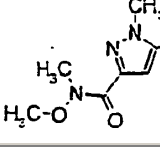
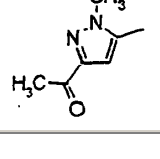
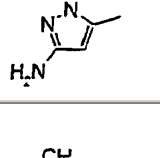
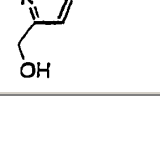


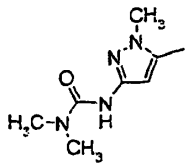
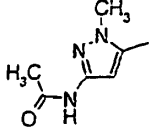
[Tabla 15]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión	Sal
92		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	138,5-140,5	-
93		Polvo de color blanco (Etanol)	233,5 (desc.)	Hidrocloreuro
94		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	147,0-148,5	-
95		Polvo de color blanco (agua)	115,0-121,0	-
96		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	129,0-130,5	-
97		(Acetato de etilo/éter isopropílico)	139,0-140,5	-

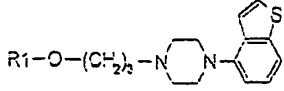
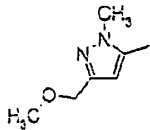
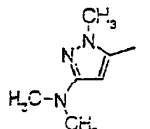
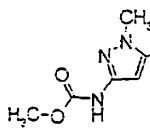
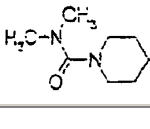
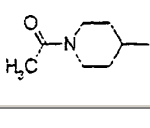
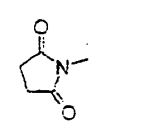


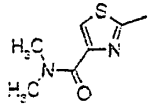
[Tabla 16]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
98		Polvo de color blanco (Acetato de etilo éter isopropílico)	128,5- 131,5	-
99		Polvo de color blanco (Alcohol isopropílico/ cetato de etilo)	227,0 (desc.)	Hidrocloreuro
100		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	211,0- 213,5	Hidrocloreuro
101		Polvo de color blanco (Etanol/agua)	245,0 (desc.)	Hidrocloreuro
102		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	112,0- 113,0	-
103		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	123,5- 126,0 0	-
104		Polvo de color amarillo claro	174,0- 176,5	Hidrocloreuro

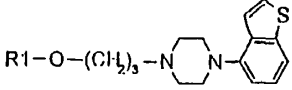
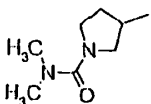
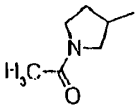
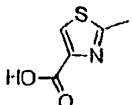
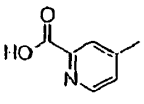
		(Acetato de etilo)		
105		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ éter isopropílico)	137,0-139,0	-

[Tabla 17]

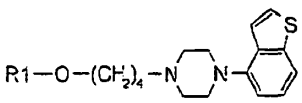
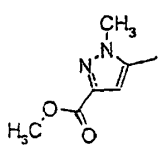
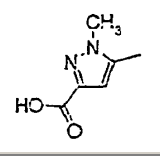
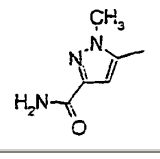
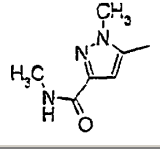
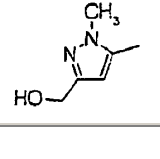
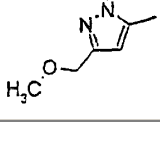
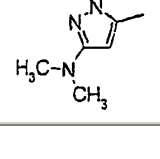
				
Ejemplo	R1	Forma cristalina (Disolvente de recristalización)	point Punto de Fusión (°C)	Sal
106		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	194,0-196,0	Hidrocloreuro
107		(Acetato de etilo)	173,0-177,0	Dihidrocloreuro
108		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	162,5-165,0	-
109		Polvo de color blanco (Metanol)	202-205	Hidrocloreuro
110		Polvo de color blanco (Metanol)	208-210	Hidrocloreuro
111		Polvo de color blanco (Etanol)	255,0-257,0	Hidrocloreuro

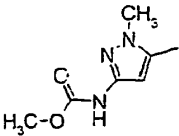
112		Polvo de color blanco (Metanol)	178-182	Hidrocloruro
-----	---	------------------------------------	---------	--------------

[Tabla 18]

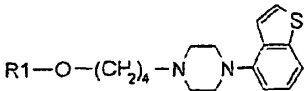
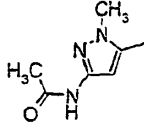
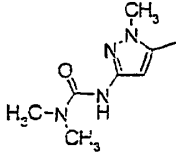
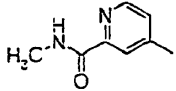
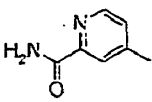
				
Ejemplo	R1	Punto de Fusión (°C)	Sal	
113		RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 1,80-2,10 (4H, m), 2,74 (6H, s), 3,10-3,70 (16H, m), 4,00-4,10 (1H, m), 6,97 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,32 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,49 (1H, d, J = 5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 10,91 (1H, s ancho),	Hidrocloruro	
114		RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 1,00-2,10 (4H, m), 1,93 (3H, s), 3,10-3,60 (16H, m), 3,90-4,10 (1H, m), 6,95 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,30 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,47 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,68 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,5 Hz), 11,30 (1H, s ancho),	Hidrocloruro	
115		RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 2,20-2,40 (2H, m), 2,70-3,70 (10H, m), 4,55 (2H, t, J = 5,9 Hz), 6,98 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,32 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,50 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,89 (1H, s), 10,97 (1H, s ancho), 12,93 (1H, s ancho),	Hidrocloruro	
116		RMN ^1H (DMSO- d_6) δ ppm: 2,25-2,35 (2H, m), 3,20-4,00 (10H, m), 4,30 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,97 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,24 (1H, dd, J = 5,5, 2,8 Hz), 7,31 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,49 (1H, d, J = 5,4 Hz), 7,59 (1H, d, J = 2,5 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J = 5,5 Hz), 8,53 (1H, d, J = 5,7 Hz), 10,99 (1H, s ancho),	Hidrocloruro	

[Tabla 19]

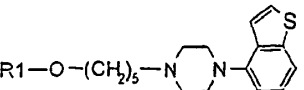
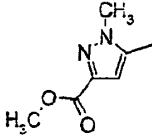
 $\text{R1}-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-\text{N}-\text{C}_4\text{H}_8\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4\text{S}$				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
117		Polvo de color pardo claro(Etanol/acetato de etilo)	103,5-106,0	-
118		Polvo de color pardo claro(Dichloromethane/agua)	140,5-144,0	-
119		Polvo de color blanco de etilo/éter isopropílico)	143,0-144,5	-
120		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	211,0-213,5	Hidrocloreuro
121		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	207,5-209,5	Hidrocloreuro
122		Polvo de color blanco (Etanol)	167,0-168,5	Hidrocloreuro
123		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	156,5-158,5	Hidrocloreuro
124		Polvo de color blanco de etilo/éter isopropílico)	157,5-161,5	-

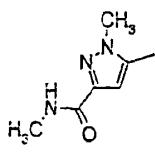
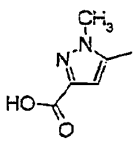
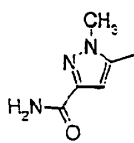
				
--	---	--	--	--

[Tabla 20]

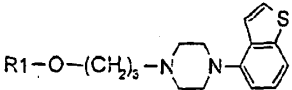
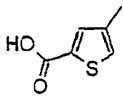
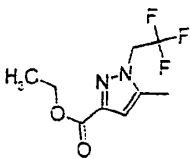
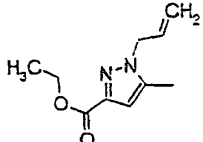
				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
125		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	203,5- 206,0	Hidrocloreuro
126		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	186,0- 187,5	Hidrocloreuro
127		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	203,0- 207,0	Hidrocloreuro
128		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	146,5- 148,0	-

[Tabla 21]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión, (°C)	Sal
129		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	200,5- 201,5	Hidrocloreuro
130		Polvo de color blanco	225,0-	Hidrocloreuro

		(Etanol/acetato de etilo)	230,0	
131		Polvo de color blanco (Dichloromethane/agua)	156,0- 158,5	-
132		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	169,0- 171,5	-

[Tabla 22]

		
Ejemplo	R1	RMN
133		RMN H ¹ (DMSO-d ₆) δ ppm: 1, 85-1, 95 (2H, m), 2, 57 (2H, t, J = 7,1 Hz), 2,60-2,75 (4H, m), 3,05-3,15 (4H, m), 4,03 (2H, t, J = 6, 3 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,20-7,31 (2H, m), 7, 35-7,41 (1H, m), 7, 60 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,68 (1H, d, J = 5,5 Hz),
134		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,00-2,11 (2H, m), 2, 60 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,63-2,80 (4H, m), 3,09-3,25 (4H, m), 4, 24 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4, 40 (2H, q, J = 7, 0 Hz), 4, 64 (2H, q, J = 8,3 Hz), 6,12 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J = 0,5 Hz, 7,5 Hz), 7,25-7,31 (1H, m), 7,36-7,43 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,1 Hz),
135		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,39 (3H, t, J = 7,0 Hz), 2,00-2,06 (2H, m), 2,60 (2H, t, J = 7,5 Hz), 2,67-2,83 (4H, m), 3,13-3,28 (4H, m), 4,18 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,39 (2H, q, J = 7,0 Hz), 4, 61 (2H, m), 5,08-5,23 (2H, m), 5,87-6,09 (1H, m), 6,11 (1H, s), 6, 75 (1H, dd, J = 0,6 Hz, 7,5 Hz), 7,25-7,37 (1H, m), 7,40-7,43 (2H, m), 7,65 (1H, d, J = 8,0 Hz),
136		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 0,91 (3H, t, J = 7, 5 Hz), 1, 38 (3H, t, J = 7,0 Hz), 1, 72-1, 93 (2H, m), 1,98-2,13 (2H, m), 2,61 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,67-2,83 (4H, m), 3,09-3,28 (4H, m),

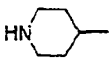
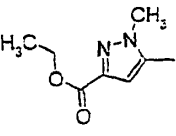
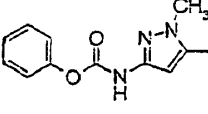
		m), 4,01 (2H, t, J = 7,0 Hz), 4,18 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,39 (2H, q, J = 7,0 Hz), 6,08 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J = 0,7 Hz, 7,5 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,37-7,43 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz),
--	--	--

[Tabla 23]

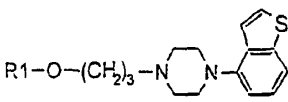
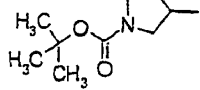
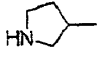
R1-O-(CH ₂) ₃ -N ₂ -N ₂ -S		
Ejemplo	R1	RMN
137		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,51 (9H, s), 1,97-2,12 (2H, m), 2,52-2,57 (2H, m), 2,67-2,80 (4H, m), 3,07-3,29 (4H, m), 4,38 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,52 (1H, br), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,03 (1H, br), 7,21-7,33 (1H, m), 7,40 (2H, dd, J = 5,6 Hz, 7,3 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz),
138		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 0,10 (6H, s), 0,92 (9H, s), 1,93-2,13 (2H, m), 2,62 (2H, t, J = 7,5 Hz), 2,70-2,83 (4H, m), 3,09-3,28 (4H, m), 3,59 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,60 (2H, s), 5,54 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J = 0,7 Hz, 7,5 Hz), 7,20-7,33 (1H, m), 7,35-7,48 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz),
139		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,50 (9H, s), 1,94-2,12 (2H, m), 2,60 (2H, t, J = 7,0 Hz), 2,66-2,80 (4H, m), 3,10-3,27 (4H, m), 3,52 (3H, s), 4,15 (2H, t, J = 6,4 Hz), 5,85 (1H, s), 6,81-6,97 (2H, m), 7,20-7,33 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz),

[Tabla 24]

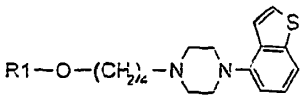
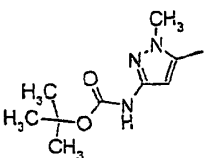
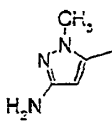
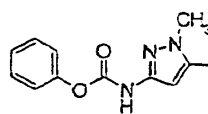
R1-O-(CH ₂) ₂ -N ₂ -N ₂ -S		
Ejemplo	R1	RMN
140		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,46 (9H, s), 1,45-1,60 (2H, m), 1,75-1,90 (4H, m), 2,50-2,60 (2H, m), 2,65-2,80 (4H, m), 3,05-3,25 (6H, m), 3,40-3,50 (1H, m), 3,53 (2H, t, J = 6,4 Hz), 3,70-3,80

		(2H, m), 6,89 (1H, dd, J = 7,6, 0,7 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,54 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,02 (1H, s),
141		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,30-1,60 (2H, m), 1,75-2,00 (4H, m), 2, 50-2, 75 (4H, m), 3,05-3,25 (6H, m), 3,30-3,40 (1H, m), 3, 55 (2H, t, J = 6,5 Hz), 6,9C (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,1 Hz),
142		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,38 (3H, t, J = 7,1 Hz), 2,00-2,10 (2H, m), 2, 60 (2H, t, J = 7,1 Hz), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3, 72 (3H, s), 4,17 (2H, t, J = 6,4 Hz), 4, 38 (2H, q, J = 7,1 Hz), 6,08 (1H, s), 6,89 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7, 54 (1H, d, J = 8,1 Hz),
143		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,94-2,10 (2H, m), 2, 60 (2H, t, J = 7,1 Hz), 2,65-2,78 (4H, m), 3,10-3,25 (4H, m), 3,57 (3H, s), 4, 15 (2H, t, J = 6,3 Hz), 5, 93 (1H, s), 6,89 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,12-7,32 (3H, m), 7,33-7,45 (4H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,93 (1H, br),

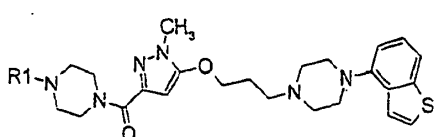
[Tabla 25]

		
Ejemplo	R1	RMN
144		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,75-2,00 (4H, m), 2,50-2,60 (2H, m), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3, 35-3, 80 (6H, m), 4, 00-4,05 (1H, m), 6, 91 (1H, dd, J = 7,6, 0,5 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J = 8,0 Hz),
145		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: 1,75-1,95 (4H, m), 2, 51 (2H, t, J = 7,1 Hz), 2,50-2,75 (8H, m), 3,10-3,20 (4H, m), 3,46 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,00-4,10 (1H, m), 6,88 (1H, d, J = 7,1 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,30-7,45 (2H, m), 7,53 (1H, d, J = 8,0 Hz),

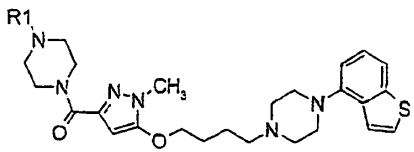
[Tabla 26]

		
Ejemplo	R1	RMN
146		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: : 1,50 (9H, s), 1,59-1,77 (2H, m), 1,77-1,93 (2H, m), 2, 50 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,61-2,80 (4H, m), 3,11-3,27 (4H, m), 3,54 (3H, s), 4,09 (2H, t, J = 6,3 Hz), 5,85 (1H, s), 6,90 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,23-7,32 (1H, m), 7,36-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,80 (1H, br),
147		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: : 1,64-1,93 (4H, m), 2,51 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,61-2,79 (4H, m), 3,11-3,29 (4H, m), 3,46 (3H, s), 3,49 (2H, br), 4,02 (2H, t, J = 6,2 Hz), 4, 94 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J = 0,7hz, 7, 6 Hz), 7,22-7,33 (1H, m), 7,35-7,46 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz),
148		RMN H ¹ (CDCl ₃) δ ppm: : 1,64-1,78 (2H, m), 1,78-1,94 (2H, m), 2,50 (2H, t, J = 7,3 Hz), 2,61-2,81 (4H, m), 3,10-3,28 (4H, m), 3,57 (3H, s), 4,09 (2H, t, J = 6,3 Hz), 5,92 (1H, s), 6,77-6,98 (4H, m), 7,11-7,32 (2H, m), 7,32-7,47 (4H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,47 (1H, br),

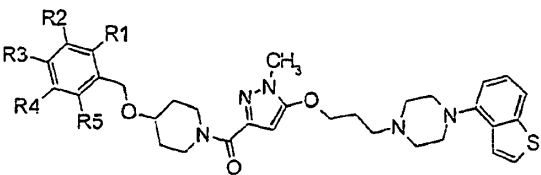
[Tabla 27]

		
Ejemplo	R1	MS (M+1)
149	-CO ₂ CH ₂ C ₂ H ₅	603
150	-CO ₂ C ₂ H ₅	541
151	-COCH ₃	511
152	-CO ₂ C (CH ₃) ₃	569
153	-COC ₆ H ₅	573
154	-COC ₂ H ₇	539
155		563

[Tabla 28]

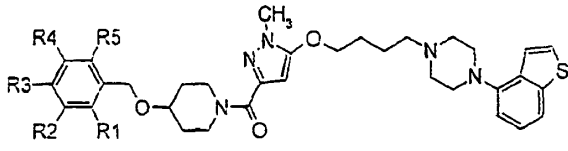
		
Ejemplo	R1	MS (M+1)
156	-CO ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	617
157	-CO ₂ C ₂ H ₅	555
158	-COCH ₃	525
159	-CO ₂ C (CH ₃) ₃	583
160	-COC ₆ H ₅	587
161	-COC ₃ H ₇	553
162		577

[Tabla 29]

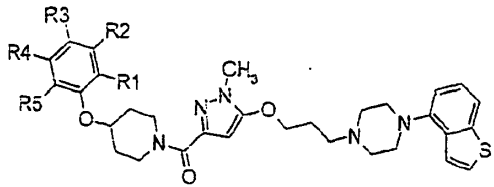
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
163	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
164	-H	-H	-H	-H	-F	592
165	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
166	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	642
167	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	604
168	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	634
169	-H	-H	-OH ₃	-H	-H	588
170	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	588
171	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	588
172	-H	-H	-F	-H	-H	592
173	-H	-H	-H	-F	-H	592
174	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	658
175	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	658
176	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	658
177	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	638
178	-H	-H	-H	-Br	-H	652
179	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	604

180	-H	-H	-H	-H	-H	574
-----	----	----	----	----	----	-----

[Tabla 30]

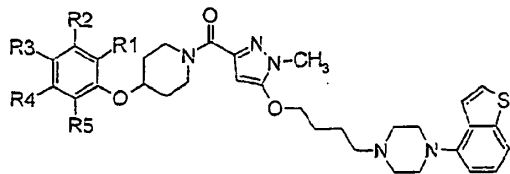
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
181	-H	-H	-H	-Cl	-H	622
182	-H	-H	-H	-H	-F	606
183	-H	-H	-H	-H	-Cl	622
184	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	656
185	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	618
186	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	648
187	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	602
188	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	602
189	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	602
190	-H	-H	-F	-H	-H	606
191	-H	-H	-H	-F	-H	606
192	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	672
193	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	672
194	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	672
195	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	652
196	-H	-H	-H	-Br	-H	666
197	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	618
198	-H	-H	-H	-H	-H	588

[Tabla 31]

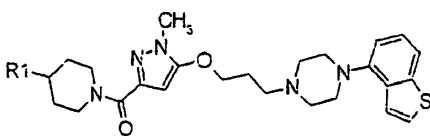
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
199	-H	-H	-CN	-H	-H	585
200	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	590
201	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	590
202	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	590
203	-H	-H	-H	-H	-H	560
204	-H	-H	-H	-H	-Cl	594

205	-H	-H	-H	-Cl	-H	594
206	-H	-H	-Cl	-H	-H	594
207	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	574
208	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	574
209	-H	-H	-F	-H	-H	578
210	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	628

[Tabla 32]

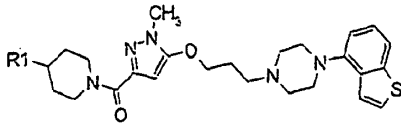
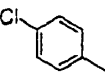
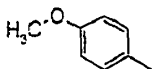
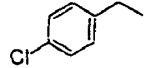
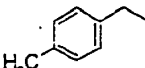
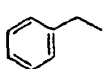
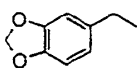
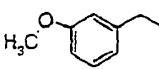
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
211	-H	-H	-CN	-H	-H	599
212	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	604
213	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	604
214	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	604
215	-H	-H	-H	-H	-H	574
216	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
217	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
218	-H	-H	-Cl	-H	-H	608
219	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	588
220	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	588
221	-H	-H	-F	-H	-H	592
222	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	642

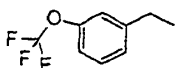
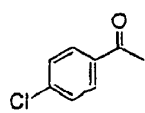
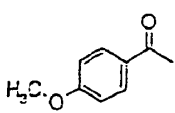
[Tabla 33]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
223	-OCH ₃	498
224	-CH ₂ CONHC ₂ H ₅	553
225	-OH	484
226	-CO ₂ C ₂ H ₅	540
227	-CONH ₂	511
228	-CH ₂ OH	498
229	-N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	597
230	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	583

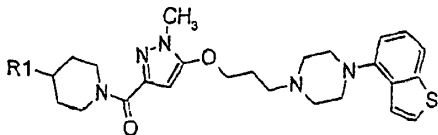
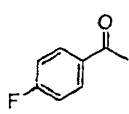
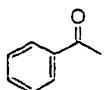
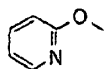
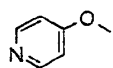
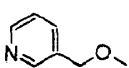
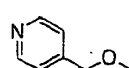
231	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	568
232	-NHCOCH ₃	525
233	-N(CH ₃)COCH ₃	539
234	-COOH	512
235	-N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	567
236	-NHCO(CH ₂) ₂ CH ₃	553

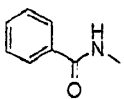
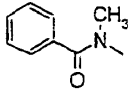
[Tabla 34]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
237		578
238		574
239		560
240		592
241		572
242		558
243		602
244		588
245		642

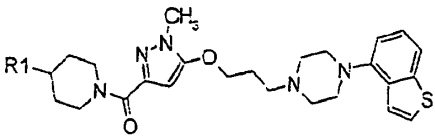
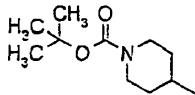
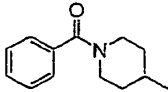
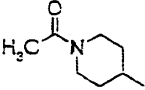
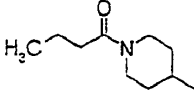
		
246		606
247		602

[Tabla 35]

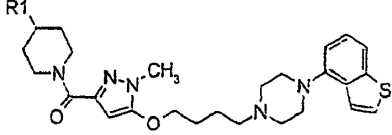
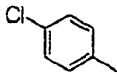
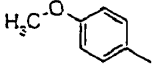
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
248		590
249		572
250		545
251		561
252		561
253		575
254		575
255		587

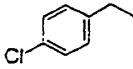
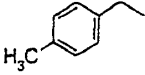
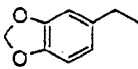
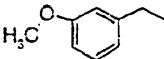
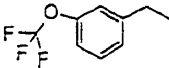
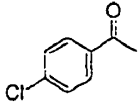
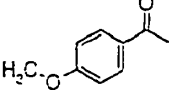
		
256		601

[Tabla 36]

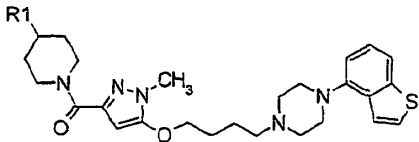
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
257		651
258		655
259		593
260		621

[Tabla 37]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
261		592
262		588
263		574

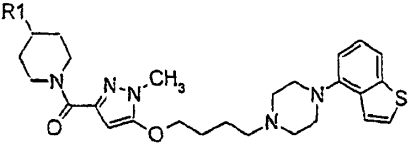
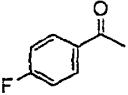
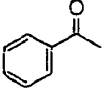
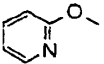
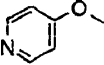
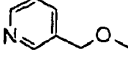
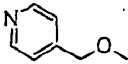
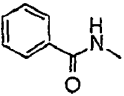
		
264		606
265		586
266		572
267		616
268		602
269		656
270		620
271		616

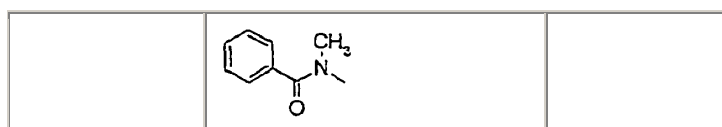
[Tabla 38]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
272	-OCH ₃	512
273	-CH ₂ CONHC ₂ H ₅	567
274	-OH	498
275	-CO ₂ C ₂ H ₅	554
276	-CONH ₂	525
277	-CH ₂ OH	512

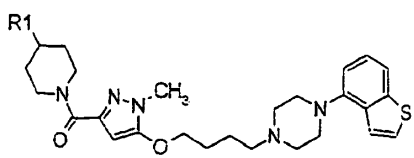
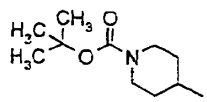
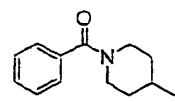
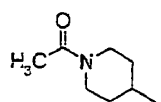
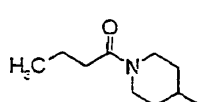
278	-N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	611
279	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	597
280	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	582
281	-NHCOCH ₃	539
282	-N(CH ₃)COCH ₃	553
283	-N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	581
284	-NHCO(CH ₂) ₂ CH ₃	567
285	-COOH	526

[Tabla 39]

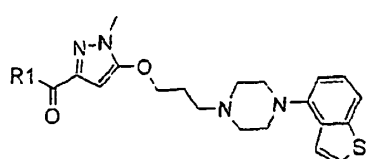
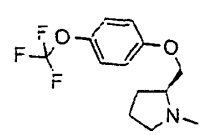
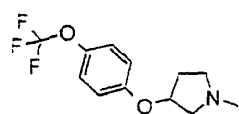
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
286		604
287		586
288		559
289		575
290		575
291		589
292		589
293		601
294		615

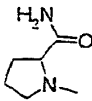
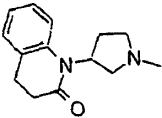
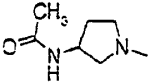
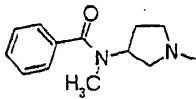
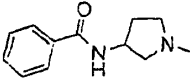
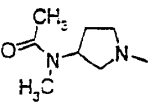
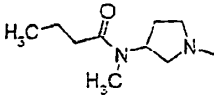
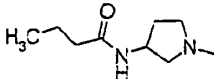


[Tabla 40]

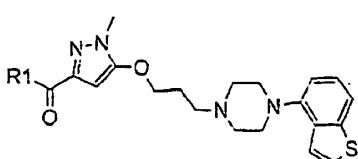
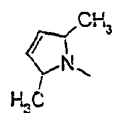
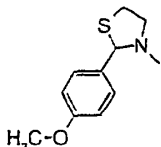
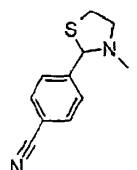
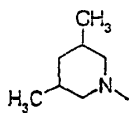
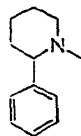
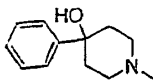
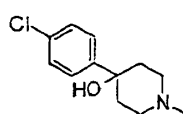
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
295		665
296		669
297		607
298		635

[Tabla 41]

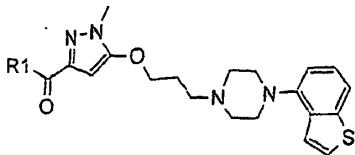
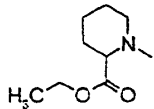
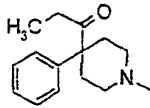
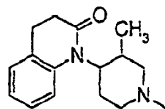
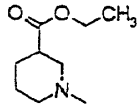
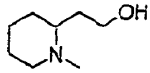
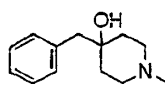
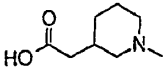
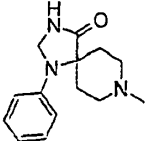
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
299		644
300		630
301		497

		
302		599
303		511
304		587
305		573
306		525
307		553
308		539

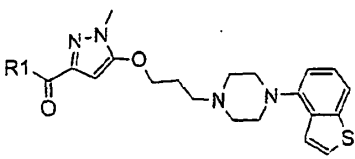
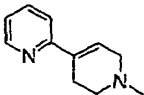
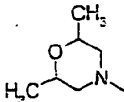
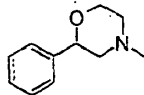
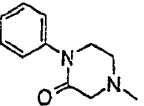
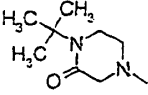
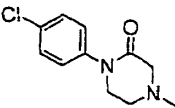
[Tabla 42]

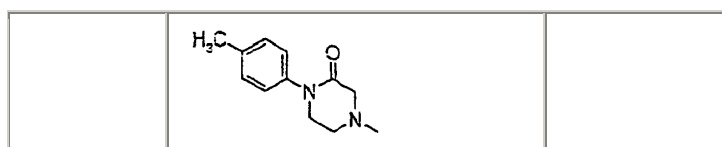
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
309		480
310		472
311		578
312		573
313		496
314		544
315		560
316		594

[Tabla 43]

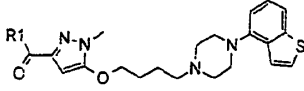
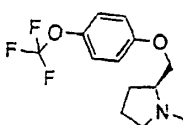
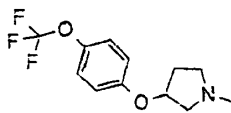
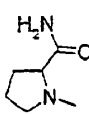
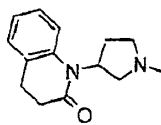
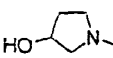
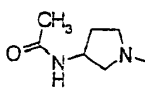
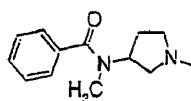
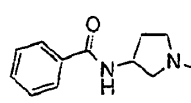
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
317		540
318		600
319		627
320		484
321		540
322		512
323		574
324		526
325		614

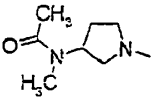
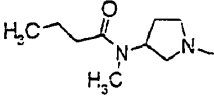
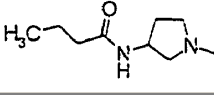
[Tabla 44]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
326		543
327		486
328		470
329		498
330		546
331		559
332		539
333		483
334		593
335		573

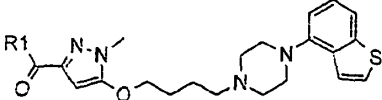
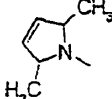
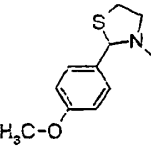
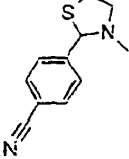
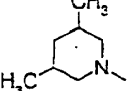


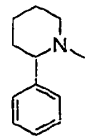
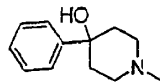
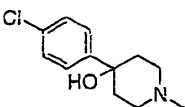
[Tabla 45]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
336		468
337		658
338		644
339		511
340		613
341		484
342		525
343		601
344		587
345		539

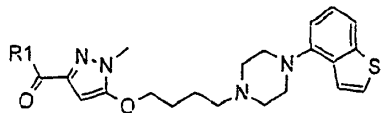
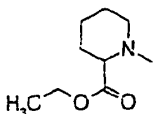
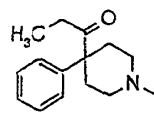
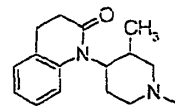
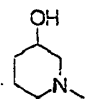
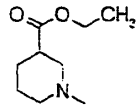
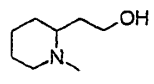
		
346		567
347		553

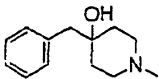
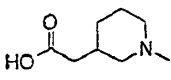
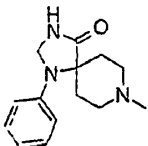
[Tabla 46]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
348		494
349		486
350		592
351		587
352		499
353		510
354		558

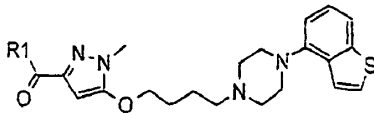
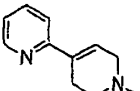
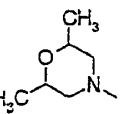
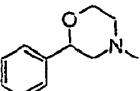
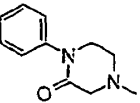
		
355		574
356		608

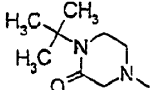
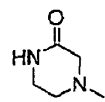
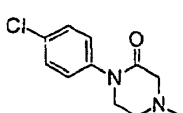
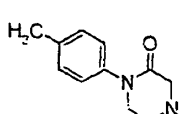
[Tabla 47]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
357		554
358		614
359		641
360		498
361		554
362		526
363		588

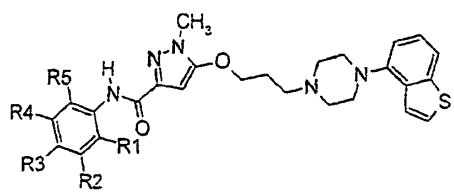
		
364		540
365		628

[Tabla 48]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
366		557
367		500
368		484
369		512
370		560
371		573
372		553

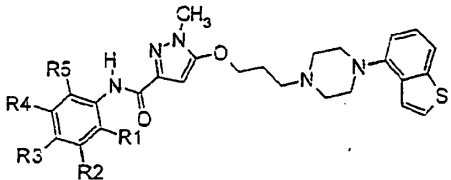
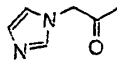
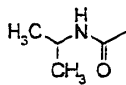
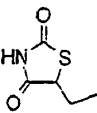
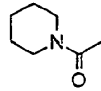
		
373		497
374		607
375		587

[Tabla 49]

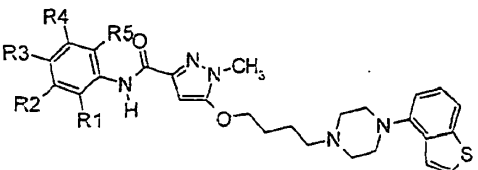
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
376	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	560
377	-H	-H	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	555
378	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	506
379	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	506
380	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	518
381	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	534
382	-H	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	536
383	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	536
384	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	536
385	-OCH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	563
386	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	536
387	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	519
388	-H	-H	-H	-COCH ₃	-H	518
389	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	533

390	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	533
391	-H	-CN	-H	-H	-H	501
392	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	564
393	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	568
394	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	592
395	-H	-H	-OH	-Cl	-H	526
396	-Cl	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	567
397	-H	-CN	-H	-H	-Cl	535
398	-Cl	-H	-H	-CONH ₂	-H	553
399	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	521
400	-H	-H	-CN	-H	-H	501

[Tabla 50]

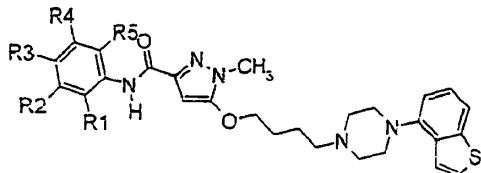
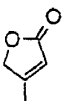
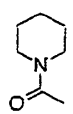
						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
401	-H	-H		-H	-H	558
402	-H	-H		-H	-H	584
403	-H	-H		-H	-H	561
404	-H	-H		-H	-H	605
405	-H	-H	-H		-H	587
406	-H	-H	-H		-H	542

[Tabla 51]

						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
407	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	574
408	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	520
409	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
410	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	532
411	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	-H	548
412	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
413	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	550
414	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	550
415	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	577
416	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	550
417	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	533
418	-H	-COCH ₃	-H	-H	-H	532
419	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	547
420	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	547
421	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	578
422	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	582
423	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	606
424	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
425	-H	-Cl	-OH	-H	-H	540
426	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	-H	596
427	-H	-H	-NHSO ₂ CH ₃	-H	-H	583
428	-H	-H	-CONHC ₆ H ₅	-H	-H	609
429	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	547
430	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	581
431	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	534
432	-H	-H	-CCH	-H	-H	514
433	-H	-H	-COC ₃ H ₇	-H	-H	560
434	-	-H	-H	-H	-H	547

	NHCOCH ₃					
435	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	-H	547

[Tabla 52]

						
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	EM (M+1)
436	-H	-H		-H	-H	573
437	-H	-H		-H	-H	672
438	-H		-H	-H	-H	601
439	-H		-H	-H	-H	556
440	-H		-H	-H	-H	557

[Tabla 53]

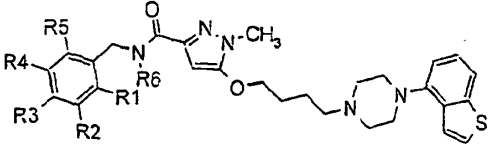
[Table 50]

The chemical structure shows a benzimidazole core. The benzene ring is substituted with R2 at position 1, R3 at position 2, R4 at position 3, and R5 at position 4. The imidazole ring is substituted with R1 at position 2 and R6 at position 3. The imidazole ring is linked via a carbonyl group to a 1-methyl-1H-imidazole ring, which is further linked via an ether oxygen to a 4-(thienyl)piperazine moiety.

Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
441	-H	-H	-H	-H	-H	-H	490
442	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	524
443	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	524
444	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	524
445	-H	-H	-H	-H	-H	-	561

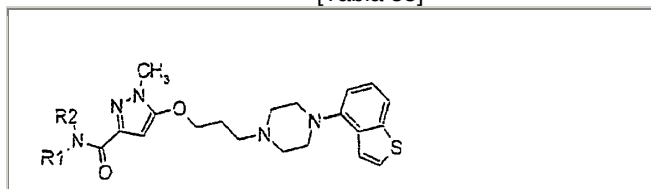
						CH ₂ CONHCH ₃	
446	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	548
447	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	564
448	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	562
449	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
450	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	520
451	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	588
452	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	574
453	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
454	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₅	578
455	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	520
456	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
457	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	634
458	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	534
459	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₂ OH	548
460	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	590
461	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	574
462	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	534

[Tabla 54]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
463	-H	-H	-H	-H	-H	-H	504
464	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	538
465	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	538
466	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	538
467	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	575
468	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	562
469	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	578
470	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	576
471	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	534
472	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	534
473	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	602
474	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	588

475	-H	-OCH ₃	-OCH ₂	-H	-H	-H	564
476	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	592
477	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	534
478	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	564
479	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	648
480	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	548
481	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₂ OH	562
482	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	604
483	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	588
484	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	548

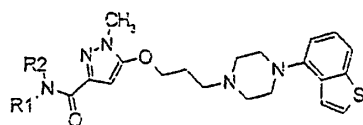
[Tabla 55]



Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
485	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	496
486	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-H	482
487	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	512
488	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	488
489	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	472
490	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	526
491	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	516
492	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	456
493	-C ₄ H ₉	-H	456
494	-C(CH ₃) ₂	-H	456
495	-ciclo-C ₂ H ₅	-H	440
496	-CH ₃	-H	414
497	-C ₂ H ₅	-H	428
498	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	456
499	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂	-H	458
500	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	472
501	-(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	-H	486
502	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-H	520
503	-CH ₂ -ciclo-C ₂ H ₅	-H	454
504	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	-H	485
505	-(CH ₂) ₅ OH	-H	486
506	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	504
507	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	472
508	-CH ₂ CONH ₂	-H	457

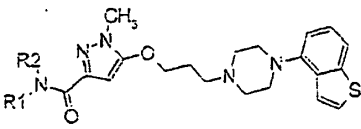
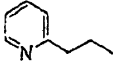
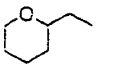
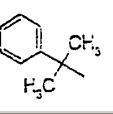
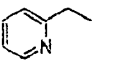
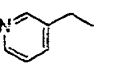
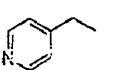
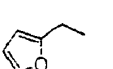
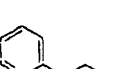
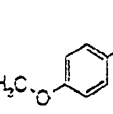
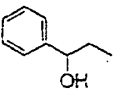
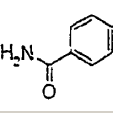
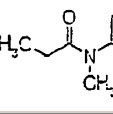
509	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	-H	558
510	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	-H	500
511	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₃	486
512	-CH ₂ CCH	-H	438
513	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	470
514	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	-CH ₃	528
515	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	528
516	-CH(CONH ₂) ₂	-H	500
517	-CH ₂ CF ₃	-H	482
518	-NHCH ₂ CF ₃	-H	497
519	-CH ₃	-CH ₃	426
520	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	500

[Tabla 56]

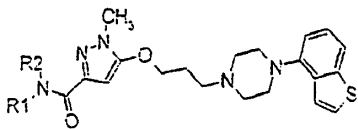
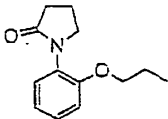
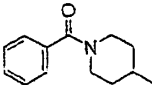
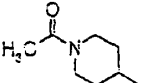
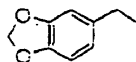
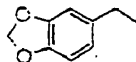
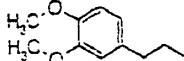
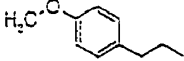
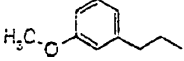
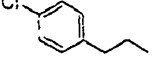
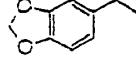


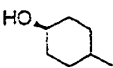
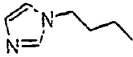
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
521	-CH ₂ CN	-H	439
522	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	486
523	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	-H	486
524	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₂	-H	472
525	-CH ₂ CH ₂ F	-H	446
526	-CH ₃ CH(OH)CH ₂ OH	-H	474
527	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	471
528	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	-H	474
529	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	444
530	-C ₅ H ₁₃	-H	484
531	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	499
532	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	499
533	-(CH ₂) ₂ N(CH ₂)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	-H	527

[Tabla 57]

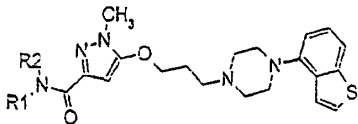
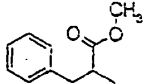
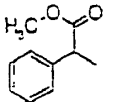
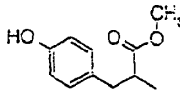
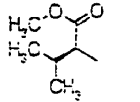
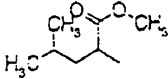
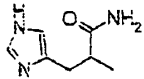
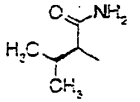
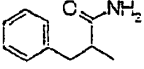
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
534		-CH ₃	519
535		-C ₂ H ₅	526
536		-H	518
537		-H	491
538		-H	491
539		-H	491
540		-H	480
541		-C ₂ H ₅	533
542		-C ₂ H ₅	572
543		-CH ₃	534
544		-C ₂ H ₅	531
545		-C ₂ H ₅	633

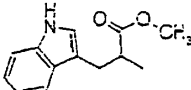
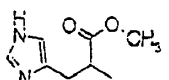
[Tabla 58]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
546		-C ₂ H ₅	631
547		-CH ₂	601
548		-CH ₃	539
549		-CH ₉	548
550		-C ₂ H ₅	562
551		-C ₂ H ₅	592
552		-H	454
553		-H	534
554		-H	534
555		-H	538
556		-H	534
557		-H	498

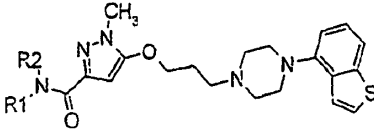
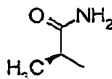
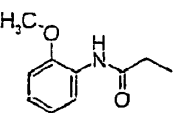
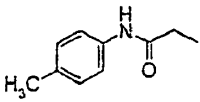
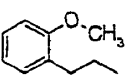
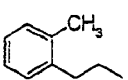
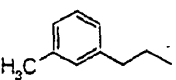
			
558		-H	508

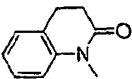
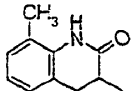
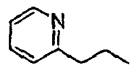
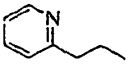
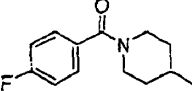
[Tabla 59]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
559		-H	562
560		-H	548
561		-H	578
562		-H	514
563		-H	528
564		-H	537
565		-H	499
566		-H	547
567		-H	601

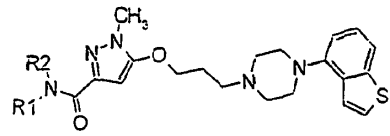
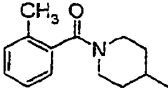
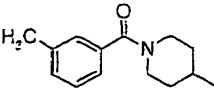
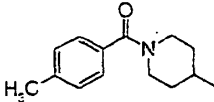
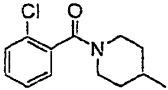
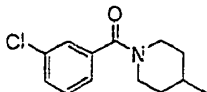
			
568		-H	552
569		-H	484

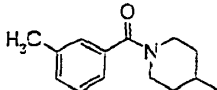
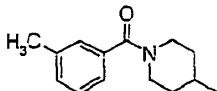
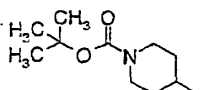
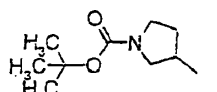
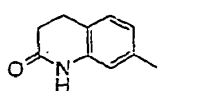
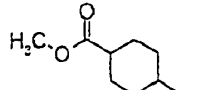
[Tabla 60]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
570		-H	471
571		-H	485
572		-CH ₃	577
573		-CH ₃	561
574		-H	534
575		-H	518
576		-H	518
577		-H	545

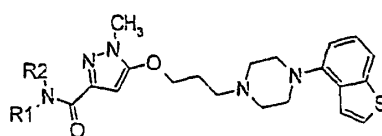
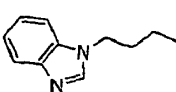
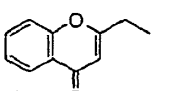
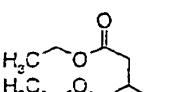
			
578		-H	559
579		-H	505
580		-CH(CH ₃) ₂	547
581		-CH ₃	619

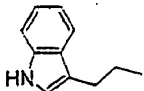
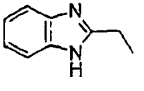
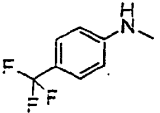
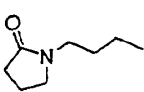
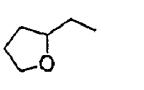
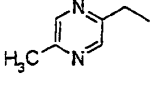
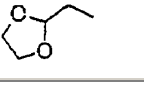
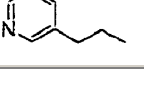
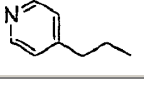
[Tabla 61]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
582		-CH ₃	615
583		-CH ₃	615
584		-CH ₃	615
585		-CH ₃	635
586		-CH ₃	635
587		-C ₄ H ₉	657

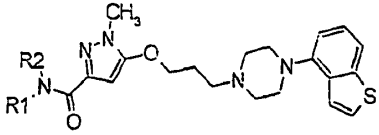
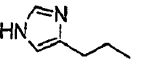
			
588		-CH(CH ₃) ₂	643
589		-H	583
590		-H	569
591		-C ₂ H ₅	573
592		-H	540

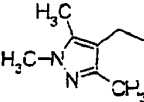
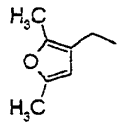
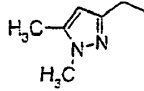
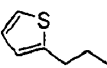
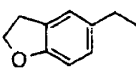
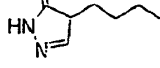
[Tabla 62]

				
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)	MW
593		-H	558	557.72
594		-H	558	557.68
595		-H	572	571.70
596		-H	543	542.71

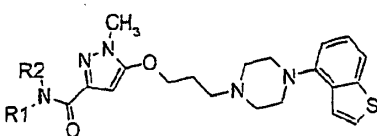
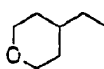
				
597		-H	530	529.67
598		-H	559	558.63
599		-H	525	524.69
600		-H	484	483.64
601		-H	506	505.65
602		-H	486	485.61
603		-H	505	504.66
604		-H	505	504.66

[Tabla 63]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
605		-H	494
606		-H	494
607		-H	493

			
608		-H	522
609		-H	508
610		-H	508
611		-H	480
612		-H	497
613		-H	510
614		-H	532
615		-H	454
616		-H	524

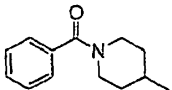
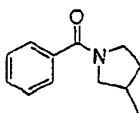
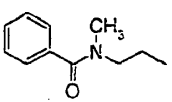
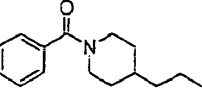
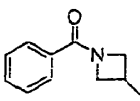
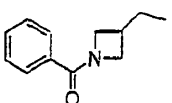
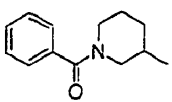
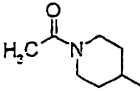
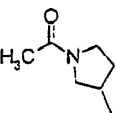
[Tabla 64]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
617		-H	498
618		-H	588

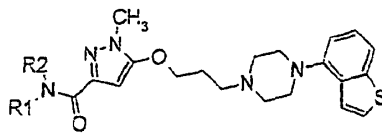
619		-CH ₃	580
620		-H	516
621		-H	494
622		-H	505
623		-H	562
624		-H	543
625		-H	574
626		-H	574

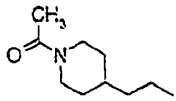
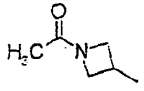
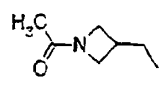
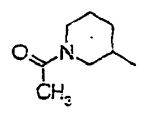
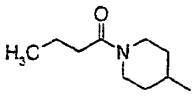
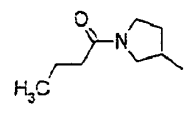
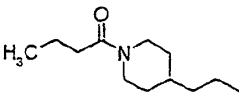
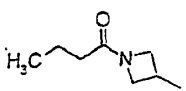
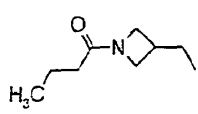
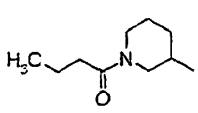
[Tabla 65]

Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
627		-H	484
628		-H	587

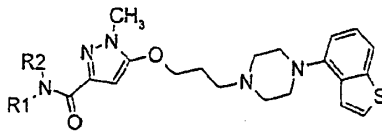
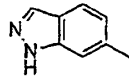
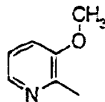
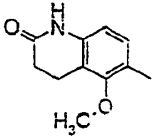
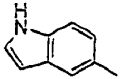
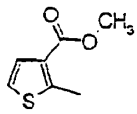
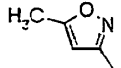
			
629		-H	573
630		-H	561
631		-H	615
632		-H	559
633		-H	573
634		-H	587
635		-H	525
636		-H	511

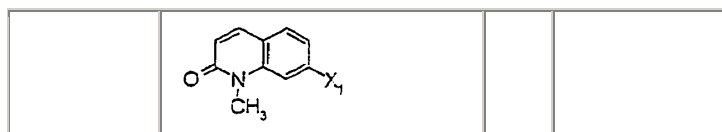
[Tabla 66]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
637		-H	553

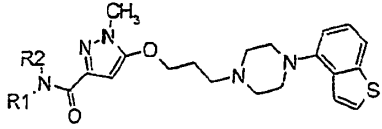
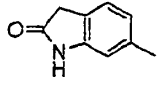
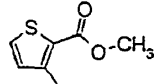
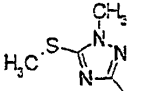
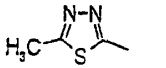
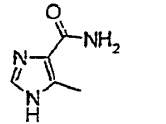
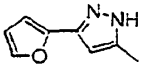
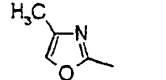
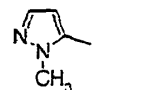
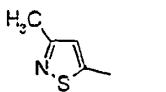
			
638		-H	497
639		-H	511
640		-H	525
641		-H	553
642		-H	539
643		-H	581
644		-H	525
645		-H	539
646		-H	553
647		-H	477

[Tabla 67]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
648		-H	516
649		-H	477
650		-H	507
651		-H	575
652		-H	515
653		-H	483
654		-H	540
655		-H	467
656		-H	443
657		-H	481
658		-H	557

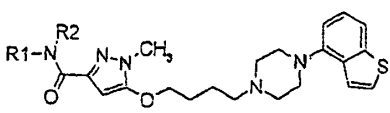


[Tabla 68]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
659		-H	531
660		-H	340
661		-H	527
662		-H	498
663		-H	509
664		-H	532
665		-H	481
666		-H	480
667		-H	497
668		-H	467

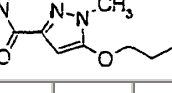


[Tabla 69]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
669	-CH ₃	-ciclo-C ₆ H ₁₁	510
670	-H	-ciclo-C ₆ H ₁₁	496
671	-H	-CH(CH ₃) ₂	456
672	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	526
673	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	502
674	-C ₂ H ₆	-CH ₂ CH ₂ O _H	486
675	-CH ₂ CH ₂ OH	-ciclo-C ₆ H ₁₁	540
676	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	530
677	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	470
678	-H	-C ₄ H ₈	470
679	-H	-C(CH ₃) ₃	470
680	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	454
681	-H	-CH ₂	428
682	-H	-C ₂ H ₅	442
683	-H	-C ₃ H ₁	456
684	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	470
685	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	472
686	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	486
687	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	500
688	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₁ H ₅	534
689	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	468
690	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	499
691	-H	-(CH ₂) ₅ OH	500
692	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	518
693	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	486
694	-H	-CH ₂ CONH ₂	471
695	-H	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	572
696	-H	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	514
697	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	500
698	-H	-CH ₂ CCH	452
699	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	484
700	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	542

701	-H	$-(\text{CH}_2)_4\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	542
702	-H	$-\text{CH}(\text{CONH}_2)_2$	514
703	-H	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$	486
704	-H	$-\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	511

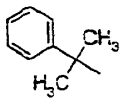
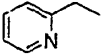
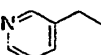
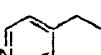
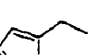
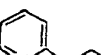
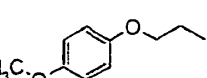
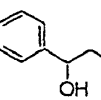
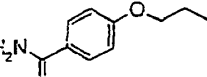
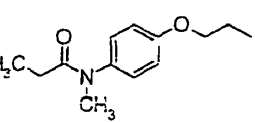
[Tabla 70]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
705	-CH ₃	-CH ₃	442
706	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	502
707	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	514
708	-H	-CH ₂ CN	453
709	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	486
710	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	500
711	-H	-CH(C ₂ H ₅ CH ₂ OCH ₃)	500
712	-H	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	486
713	-H	-CH ₂ CH ₂ F	460
714	-H	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	488
715	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	485
716	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	488
717	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	458
718	-H	-C ₁ H ₁₃	498
719	-CH ₃	-CH ₃ CON(CH ₃) ₂	513
720	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	513
721	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO(CH ₂)-CH ₃	541

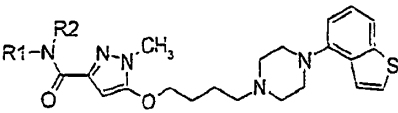
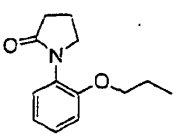
[Tabla 71]

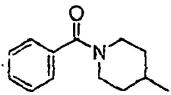
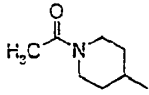
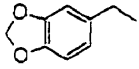
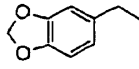
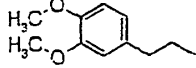
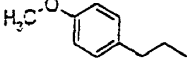
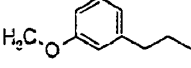
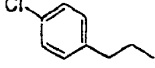
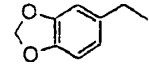
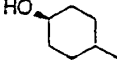
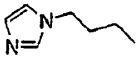
[Tabla 7.2]

Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
722		-CH ₃	533
723		-C ₂ F ₅	540
724		-H	532

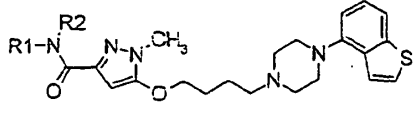
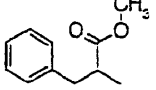
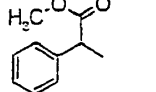
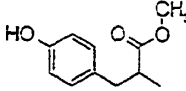
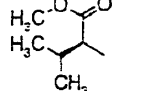
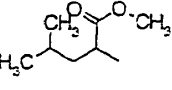
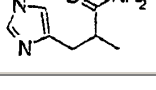
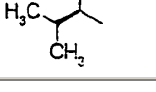
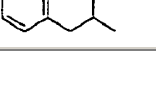
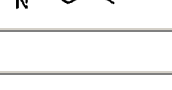
			
725		-H	505
726		-H	505
727		-H	505
728		-H	494
729		-C ₂ H ₅	547
730		-C ₂ H ₅	592
731		-CH ₃	548
732		-C ₂ H ₅	605
733		-C ₂ H ₅	647

[Tabla 72]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
734		-C ₂ H ₅	645
735		-CH ₃	615

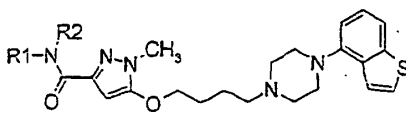
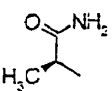
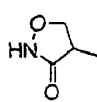
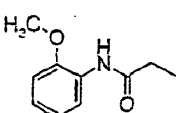
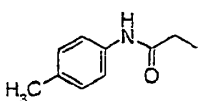
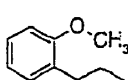
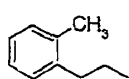
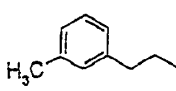
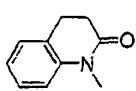
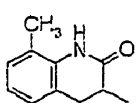
			
736		-CH ₃	553
737		-CH ₃	562
738		-C ₂ H ₅	576
739		-C ₂ H ₅	606
740		-H	468
741		-H	548
742		-H	548
743		-H	552
744		-H	548
745		-H	512
746		-H	522

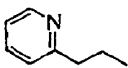
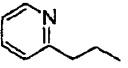
[Tabla 73]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
747		-H	576
748		-H	562
749		-H	592
750		-H	528
751		-H	542
752		-H	551
753		-H	513
754		-H	561
755		-H	615
756		-H	566
757		-H	498

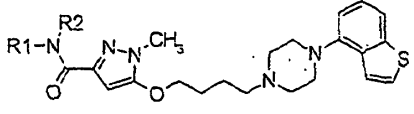
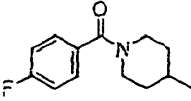
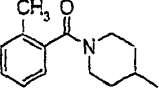
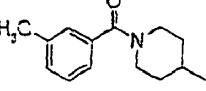
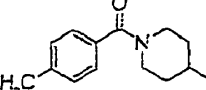
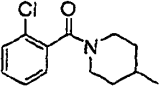
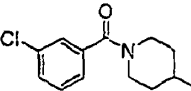
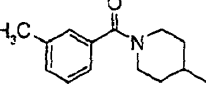
			
--	---	--	--

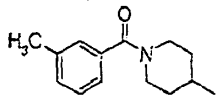
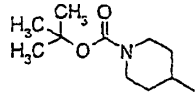
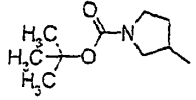
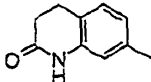
[Tabla 74]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
758		-H	485
759		-H	499
760		-CH ₃	591
761		-CH ₃	575
762		-H	548
763		-H	532
764		-H	532
765		-H	559
766		-H	573
767		-H	519

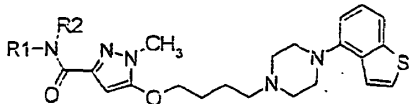
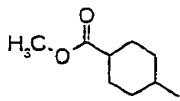
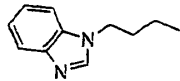
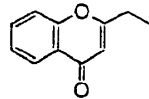
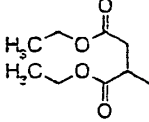
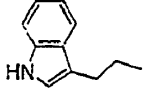
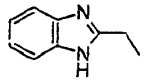
			
768		-CH(CH ₃) ₂	561
769		-H	470

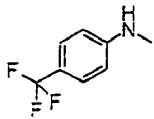
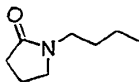
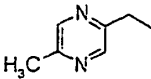
[Tabla 75]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
770		-CH ₃	633
771		-CH ₃	629
772		-CH ₃	629
773		-CH ₃	629
774		-CH ₃	649
775		-C ₄ H ₈	649
776		-C ₄ H ₈	671
777		-CH(CH ₃) ₂	657

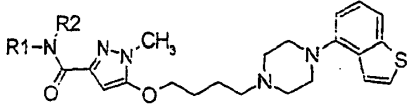
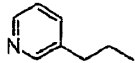
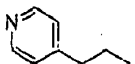
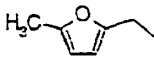
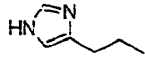
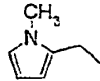
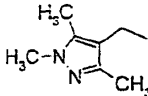
			
778		-H	597
779		-H	583
780		-C ₂ H ₅	587

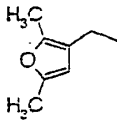
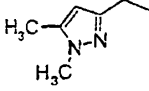
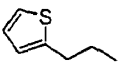
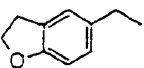
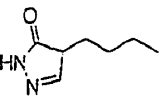
[Tabla 76]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
781		-H	554
782		-H	572
783		-H	572
784		-H	586
785		-H	557
786		-H	544
787		-H	573

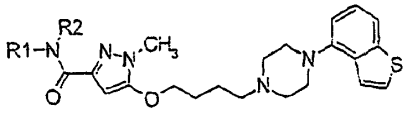
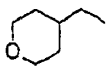
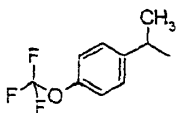
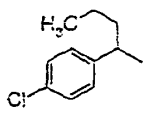
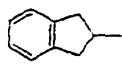
			
788		-H	539
789		-H	498
790		-H	520
791		-H	500

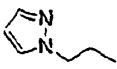
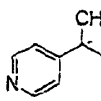
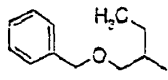
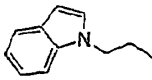
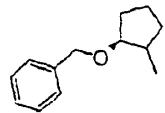
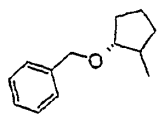
[Tabla 77]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
792		-H	519
793		-H	519
794		-H	508
795		-H	508
796		-H	507
797		-H	536
798		-H	522

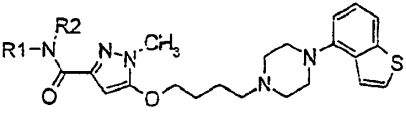
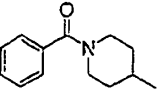
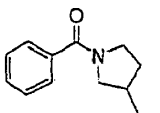
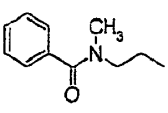
			
799		-H	522
800		-H	494
801		-H	511
802		-H	524
803		-H	546
804		-H	538

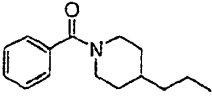
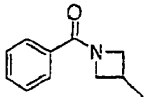
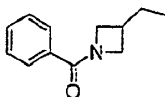
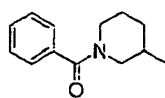
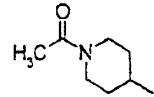
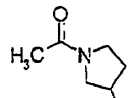
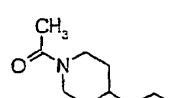
[Tabla 78]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
805		-H	512
806		-H	602
807		-CH ₃	594
808		-H	530

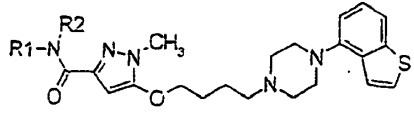
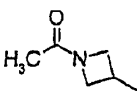
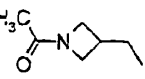
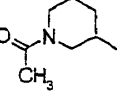
809		-H	508
810		-H	519
811		-H	576
812		-H	557
813		-H	588
814		-H	588
815		-H	498

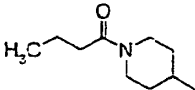
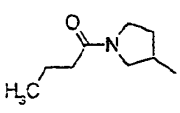
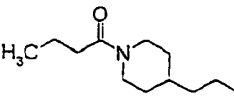
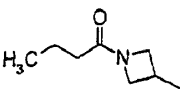
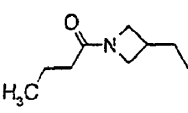
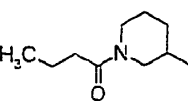
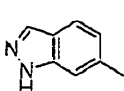
[Tabla 79]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
816		-H	601
817		-H	587
818		-H	575

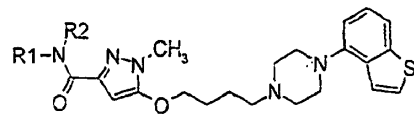
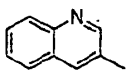
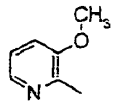
819		-H	629
820		-H	573
821		-H	587
822		-H	601
823		-H	539
824		-H	525
825		-H	567

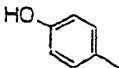
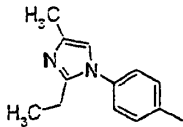
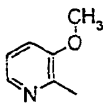
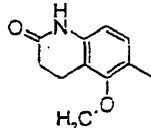
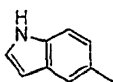
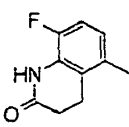
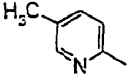
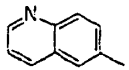
[Tabla 80]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
826		-H	511
827		-H	525
828		-H	539
829		-H	567

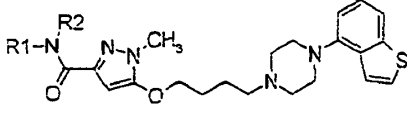
			
830		-H	553
831		-H	595
832		-H	539
833		-H	553
834		-H	567
835		-H	491
836		-H	530

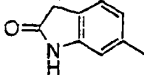
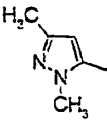
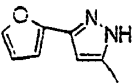
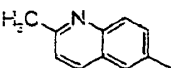
[Tabla 81]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
837		-H	541
838		-H	505
839		-CH ₃	520

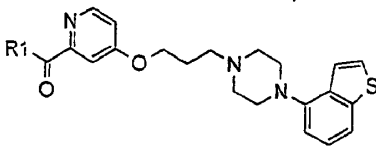
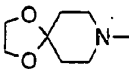
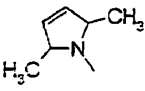
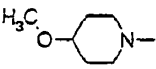
			
840		-CH ₃	612
841		-H	521
842		-H	589
843		-H	529
844		-H	577
845		-H	505
846		-H	497
847		-H	541

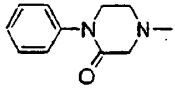
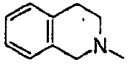
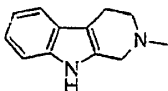
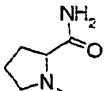
[Tabla 82]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
848		-H	456
849		-H	545

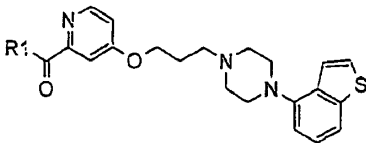
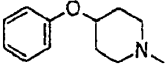
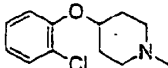
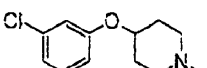
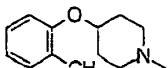
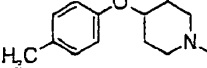
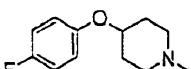
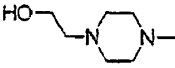
			
850		-H	508
851		-H	546
852		-H	494
853		-H	555

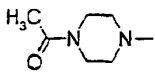
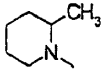
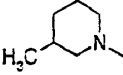
[Tabla 83]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
854		523
855		483
856		477
857		469
858		467
859		495

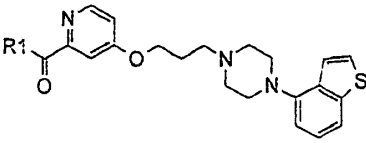
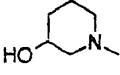
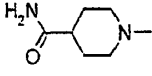
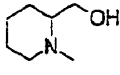
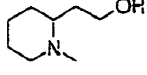
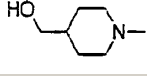
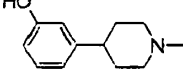
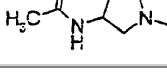
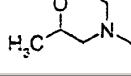
860		556
861		513
862		552
863		494

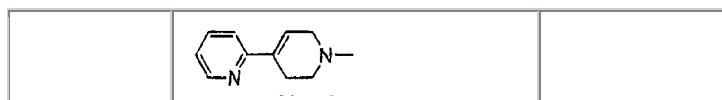
[Tabla 84]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
864		557
865		591
866		591
867		571
868		571
869		575
870		510
871		508

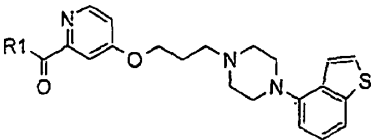
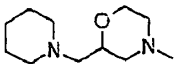
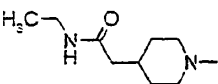
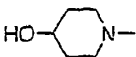
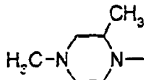
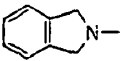
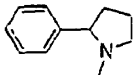
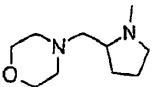
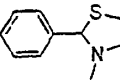
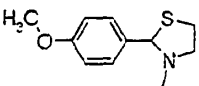
		
872		479
873		479

[Tabla 85]

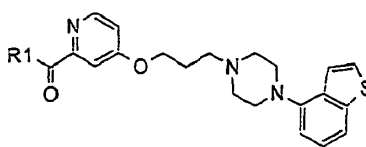
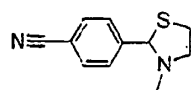
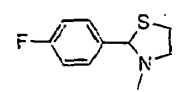
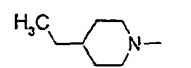
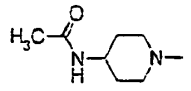
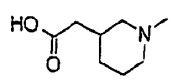
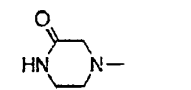
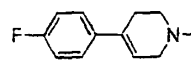
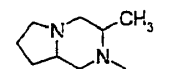
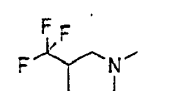
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
874		481
875		508
876		495
877		509
878		495
879		557
880		508
881		495
882		540



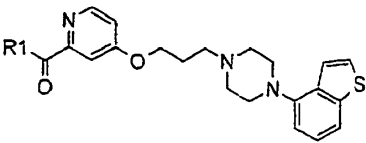
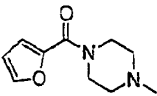
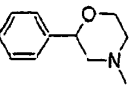
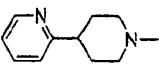
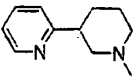
[Tabla 86]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
883		564
884		550
885		481
886		494
887		499
888		527
889		550
890		545
891		575

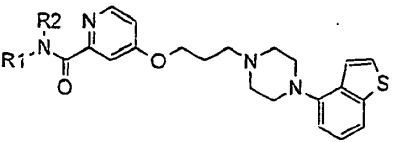
[Tabla 87]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
892		570
893		563
894		493
895		522
896		523
897		480
898		557
899		520
900		533

[Tabla 88]

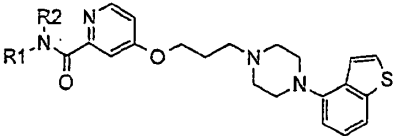
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
901		560
902		481
903		543
904		542
905		542

[Tabla 89]

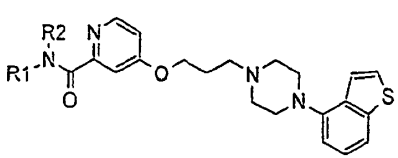
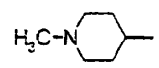
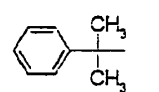
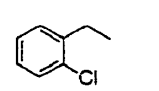
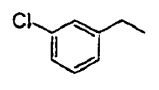
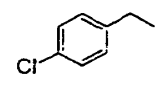
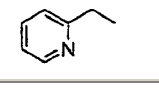
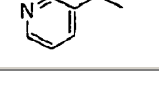
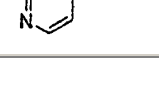
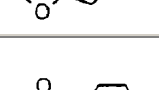
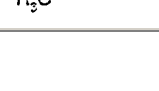
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
906	-CH ₃	-ciclo-C ₆ H ₁₁	493
907	-H	-ciclo-C ₆ H ₁₁	479
908	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	485
909	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	482
910	-H	-C ₄ H ₉	453
911	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	437
912	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	487
913	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	501
914	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	467
915	-H	-CH ₃	411
916	-H	-C ₂ H ₅	425

917	-H	-C ₂ H ₇	439
918	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	453
919	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	455
920	-H	-CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₅	469
921	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	517
922	-H	-ciclo-C ₅ H ₈	465
923	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₆ H ₁₁	493
924	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	501
925	-H	-CH ₂ CONH ₂	454

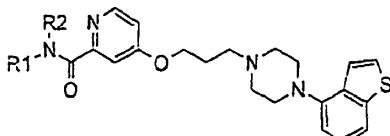
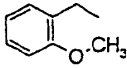
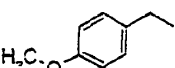
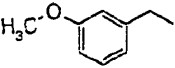
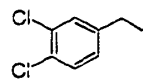
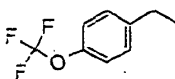
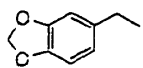
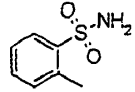
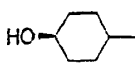
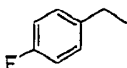
[Tabla 90]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
926	-H	-CH(CH ₃) ₂	439
927	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	453
928	-H	-(CH ₂) ₅ OH	483
929	-H	-CH ₂ CCH	435
930	-CH ₂	-CH(CH ₃) ₂	453
931	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	467
932	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	468
933	-H	-CH(CONH ₂) ₂	497
934	-CH ₃	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	465
935	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	510
936	-H	-CH ₂ CF ₃	479
937	-H	-NHCH ₂ CF ₃	494
938	-CH ₃	-CH ₂	425
939	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	485
940	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	497
941	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	467
942	-H	-CH ₂ CN	436
943	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	483
944	-H	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	483
945	-H	-CH ₂ CH ₂ F	443
946	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
947	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	471
948	-H	-CH ₂ CHF ₂	461
949	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ NHCH ₃	512

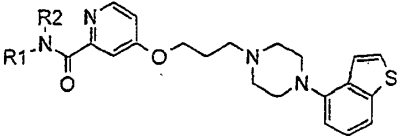
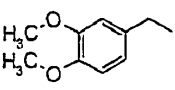
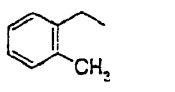
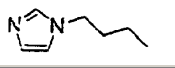
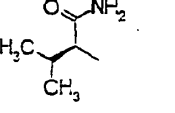
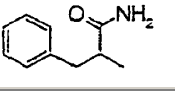
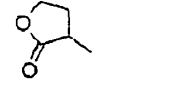
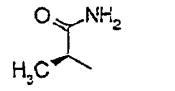
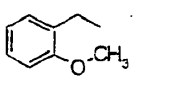
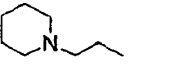
[Tabla 91]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
950	-CH ₃		508
951	-H		515
952	-H		521
953	-H		521
954	-H		521
955	-H		488
956	-H		488
957	-H		488
958	-H		477
959	-CH ₃		536

[Tabla 92]

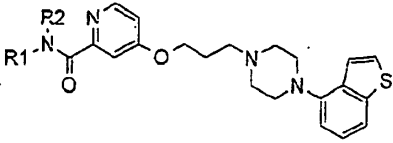
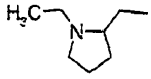
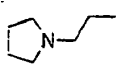
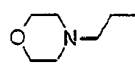
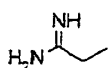
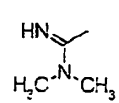
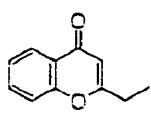
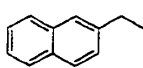
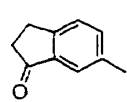
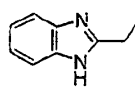
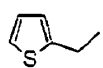
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
960	-CH ₃		531
961	-H		451
962	-H		517
963	-H		517
964	-H		555
965	-H		571
966	-H		531
967	-H		552
968	-H		495
969	-H		505

[Tabla 93]

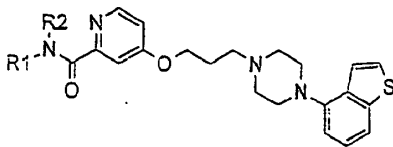
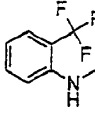
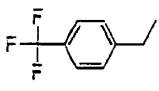
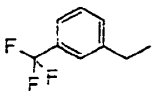
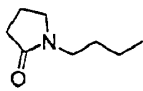
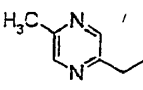
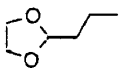
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
970	-H		547
971	-H		501
972	-H		505
973	-H		496
974	-H		544
975	-H		481
976	-H		468
977	-H		517
978	-H		508

[

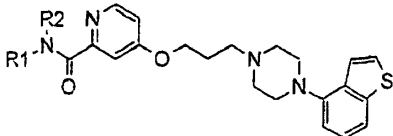
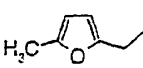
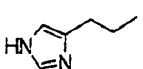
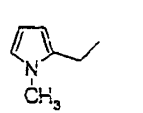
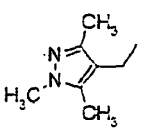
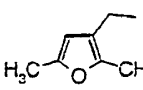
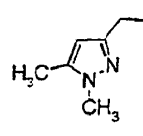
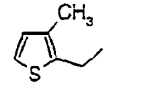
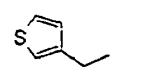
Tabla 94]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
979	-H		508
980	-H		494
981	-H		510
982	-H		453
983	-H		467
984	-H		555
985	-H		537
986	-H		527
987	-H		527
988	-H		493

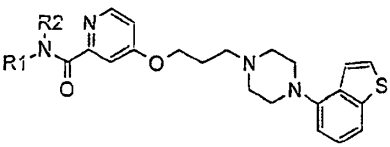
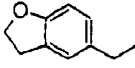
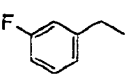
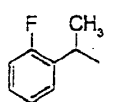
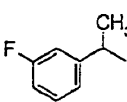
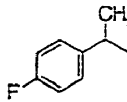
[Tabla 95]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
989	-H		556
990	-H		555
991	-H		555
992	-C ₂ H ₅		479
993	-H		522
994	-H		481
995	-H		503
996	-H		483
997	-H		497

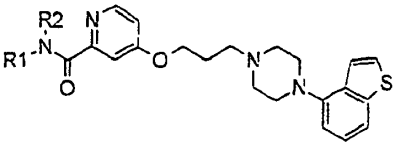
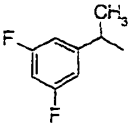
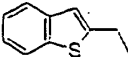
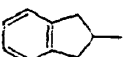
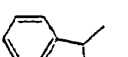
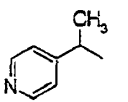
[Tabla 96]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
998	-H		491
999	-H		491
1000	-H		490
1001	-H		519
1002	-H		505
1003	-H		505
1004	-H		507
1005	-H		493

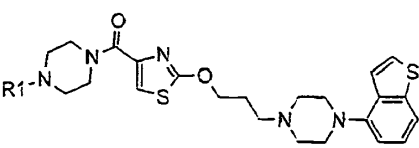
[Tabla 97]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1006	-H		477
1007	-H		494
1008	-H		529
1009	-H		451
1010	-H		495
1011	-H		505
1012	-H		519
1013	-H		519
1014	-H		515

[Tabla 98]

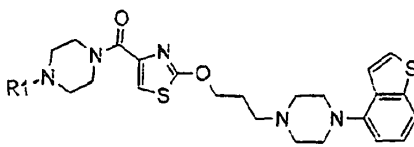
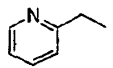
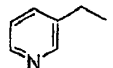
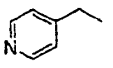
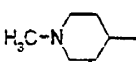
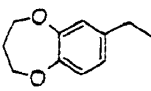
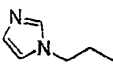
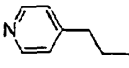
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1015	-H		537
1016	-H		543
1017	-H		513
1018	-H		513
1019	-H		502
1020	-H		506

[Tabla 99]

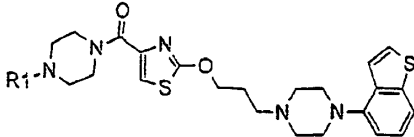
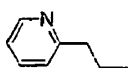
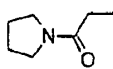
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1021	-2-PIRIDILO	549
1022	-C ₄ H ₉	528
1023	-CH(CH ₃) ₂	514
1024	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	543
1025	-4-PIRIDILO	549
1026	-C ₆ H ₅	548
1027	-C ₃ H ₇	514
1028	-CH ₃	486

1029	-3-PIRIDILO	549
1030	-C ₈ H ₁₃	556
1031	-C ₂ H ₅	500
1032	-CH ₂ CH ₂ OH	516
1033	-COCH ₃	514
1034	-ciclo-C ₆ H ₁₁	554
1035	-SO ₂ C ₂ H ₅	564

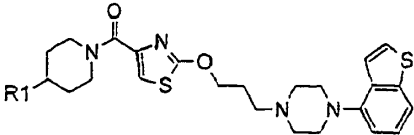
[Tabla 100]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1036		563
1037		563
1038		563
1039		550
1040		569
1041		634
1042		550
1043		566
1044		577

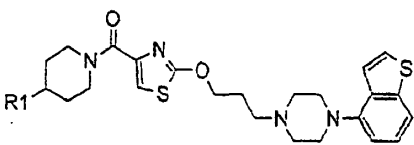
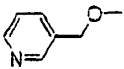
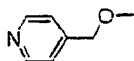
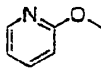
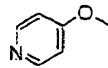
[Tabla 101]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1045		577
1046		583
1047		555
1048		540

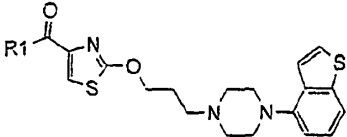
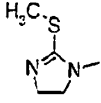
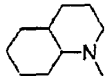
[Tabla 102]

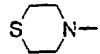
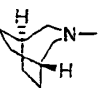
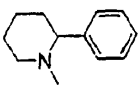
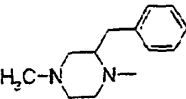
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1049	-OCH ₃	501
1050	-ciclo-C ₆ H ₁₁	553
1051	-C ₆ H ₅	547
1052	-OCH ₂ C ₆ H ₅	577
1053	-OC ₆ H ₅	553
1054	-OH	487
1055	-CONH ₂	514
1056	-CH ₂ OH	501
1057	-C ₂ H ₅	499
1058	-NHCOCH ₃	528
1059	-COC ₆ H ₅	575
1060	-2-PIRIDILO	548

[Tabla 103]

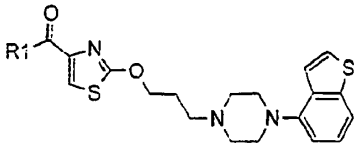
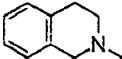
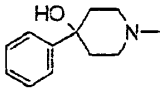
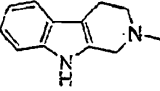
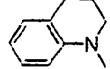
		
Ejemplo	Ri	EM (M+1)
1061		554
1062		578
1063		578
1064		556
1065		564
1066		564

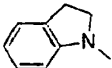
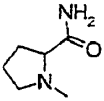
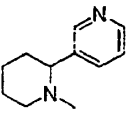
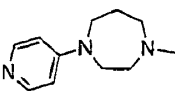
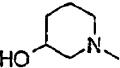
[Tabla 104]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1067		485
1068		502
1069		525

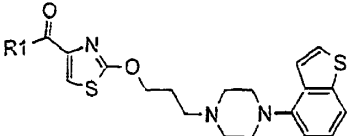
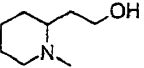
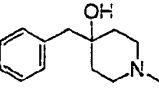
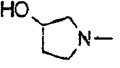
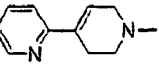
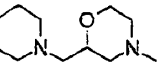
1070		489
1071		475
1072		511
1073		539
1074		547
1075		576

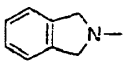
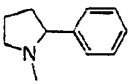
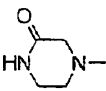
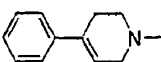
[Tabla 105]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1076		519
1077		563
1078		558
1079		519
1080		505

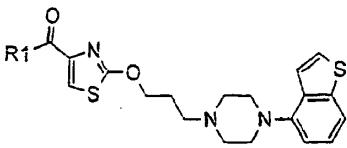
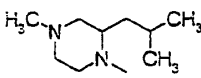
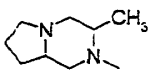
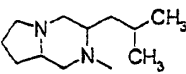
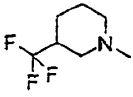
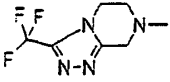
		
1081		500
1082		548
1083		563
1084		487

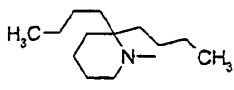
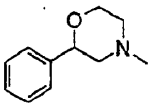
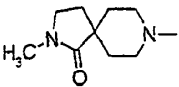
[Tabla 106]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1085		515
1086		577
1087		473
1088		546
1089		570
1090		505

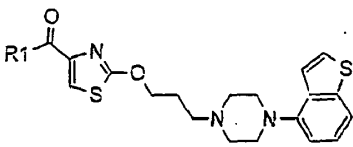
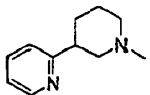
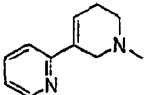
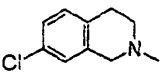
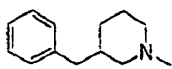
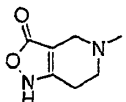
		
1091		533
1092		486
1093		545

[Tabla 107]

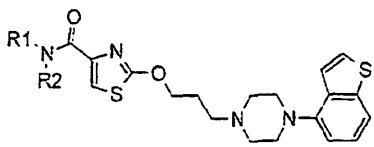
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1094		542
1095		526
1096		568
1097		539
1098		576
1099		487
1100		585

		
1101		549
1102		554

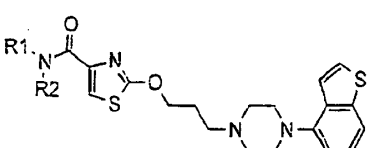
[Tabla 108]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1103		548
1104		546
1105		553
1106		561
1107		526
1108		443

[Tabla 109]

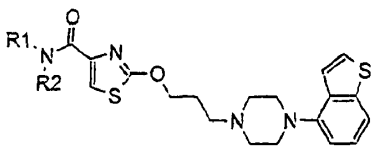
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1109	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-OH ₃	499
1110	-H	-ciclo-C ₆ H ₁₁	485
1111	-H	-CH(CH ₃) ₂	445
1112	-C ₄ H ₆	-C ₄ H ₉	515
1113	-GH ₂ OH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(OH) ₂	515
1114	-OH ₂ CH ₂ OK	-CH ₂ OH ₂ OH	491
1115	-OH ₂ OH ₂ OH	-O ₂ H ₅	475
1116	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	571
1117	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	488
1118	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	529
1119	-OH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	519
1120	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃),	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	573
1121	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	-OH ₃	530
1122	-OH ₂ OH=OH ₂	ciclo-C ₅ H ₉	511
1123	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	459
1124	-H	-C(OH ₃) ₃	459
1125	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	443
1126	-H	-ciclo-C ₇ H ₁₃	499
1127	-H	-OH ₂ C ₆ H ₅	493
1128	-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	563
1129	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	564
1130	-CH ₂ C ₆ H ₅	-ciclo-C ₆ H ₁₁	575
1131	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	521
1132	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	507
1133	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	534
1134	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	563

[Tabla 110]

			
Ejemplos	R1	R2	EM (M+1)
1135	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	583

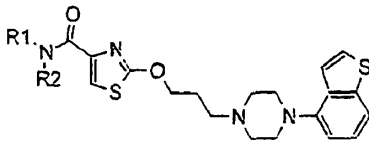
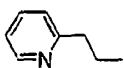
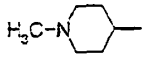
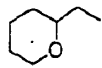
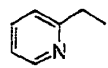
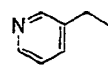
1136	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	521
1137	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	535
1138	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₆ H ₅	546
1139	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₂	537
1140	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	513
1141	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	473
1142	-H	-C ₂ H ₅	431
1143	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	459
1144	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	461
1145	-C ₂ H ₆	-C ₄ H ₈	487
1146	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	475
1147	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	489
1148	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	569
1149	-C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	507
1150	-C ₆ H ₅	-ciclo-C ₆ H ₁₁	561
1151	-CH ₂ CH ₂ CN	-C ₆ H ₅	532
1152	-2-PIRIDILO	-C ₂ H ₃	508
1153	-H	-C ₆ H ₅	479
1154	-H	-3-PIRIDILO	480
1155	-H	-2-PIRIDILO	480
1156	-H	-4-PIRIDILO	480
1157	-C ₆ H ₆	-CH ₃	493
1158	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₆ H ₁₁	499
1159	-H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	521
1160	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	488
1161	-H	-(CH ₂) ₅ OH	489

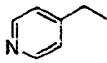
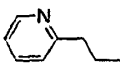
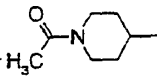
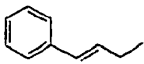
[Tabla 111]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1162	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	507
1163	-H	-CH ₂ CONH ₂	460
1164	-H	-CH ₂ CCH	441
1165	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	487
1166	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	473
1167	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	473
1168	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	474

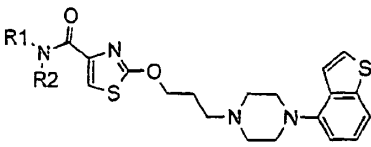
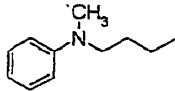
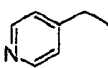
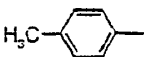
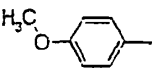
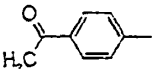
1169	-CH ₂ C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₃ OH	551
1170	-CH ₃	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	471
1171	-H	-CH ₂ CF ₃	485
1172	-H	-NHCH ₂ CF ₃	500
1173	-CH ₃	-CH ₃	434
1174	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	503
1175	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	487
1176	-H	-CH ₂ CN	442
1177	-H	-(CH ₂) ₂ OCH ₃	475
1178	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	489
1179	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	456
1180	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	474
1181	-H	-(CH ₂)SCH ₃	477
1182	-H	-CH ₂ CHF ₂	467
1183	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	447
1184	-H	-C ₆ H ₁₃	487
1185	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	502
1186	-CH ₂ C ₈ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	551
1187	-H	-(CH ₂) ₂ NHCONH ₂	489

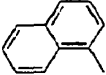
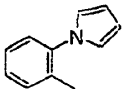
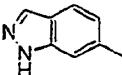
[Tabla 112]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1188		-CH ₃	522
1189		-CH ₃	514
1190		-C ₂ H ₅	529
1191		-H	494
1192		-H	494
1193		-H	494

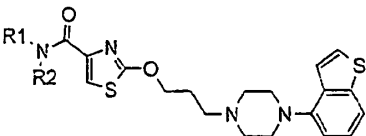
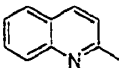
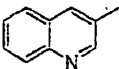
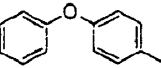
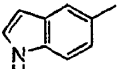
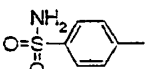
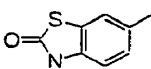
			
1194		-H	483
1195		-C ₂ H ₅	536
1196		-CH ₃	542
1197		-C ₂ H ₅	547

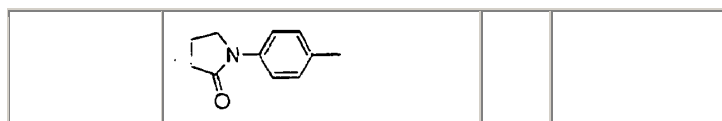
[Tabla 113]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1198		-CH ₃	564
1199		-C ₂ H ₅	522
1200		-H	457
1201		-H	485
1202		-CH ₃	507
1203		-H	509
1204		-H	521
1205		-H	529

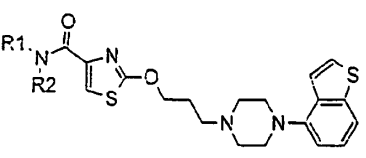
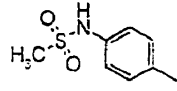
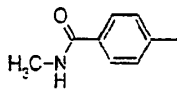
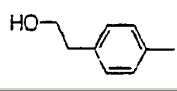
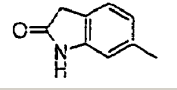
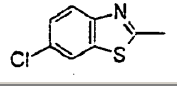
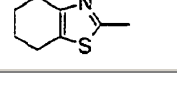
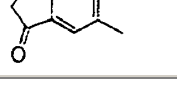
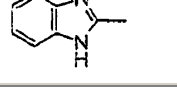
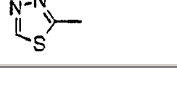
			
1206		-H	544
1207		-H	519

[Tabla 114]

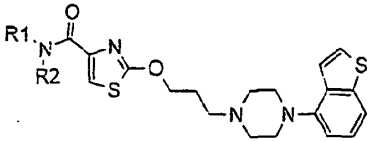
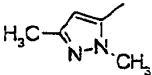
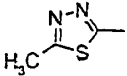
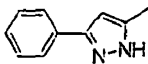
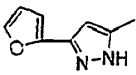
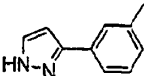
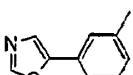
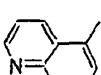
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1208		-H	530
1209		-H	530
1210		-H	571
1211		-H	518
1212		-H	558
1213		-H	486
1214		-H	552
1215		-H	471
1216		-H	562



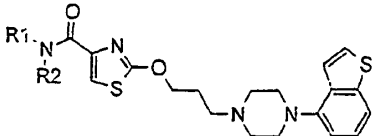
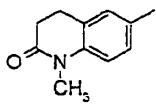
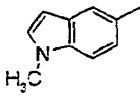
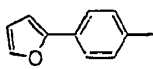
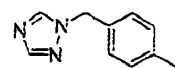
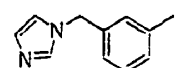
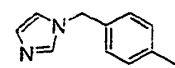
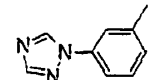
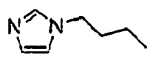
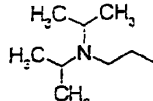
[Tabla 115]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1217		-H	572
1218		-H	536
1219		-H	523
1220		-H	534
1221		-H	570
1222		-H	540
1223		-H	533
1224		-H	519
1225		-H	487

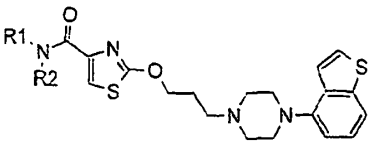
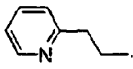
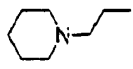
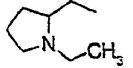
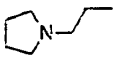
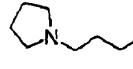
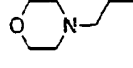
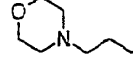
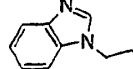
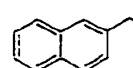
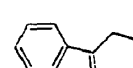
[Tabla 116]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1226		-H	497
1227		-H	501
1228		-H	545
1229		-H	535
1230		-H	545
1231		-H	546
1232		-H	530
1233		-H	483

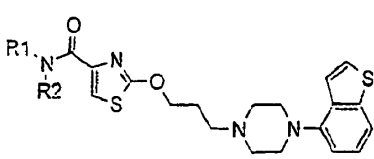
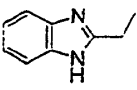
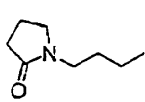
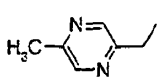
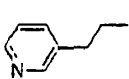
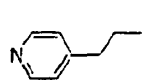
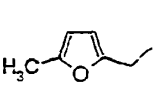
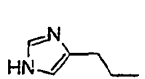
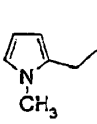
[Tabla 117]

			
Ejemplos	R1	R2	EM (M+1)
1234		-H	562
1235		-H	532
1236		-H	545
1237		-H	560
1238		-H	559
1239		-H	559
1240		-H	546
1241		-H	511
1242		-H	530

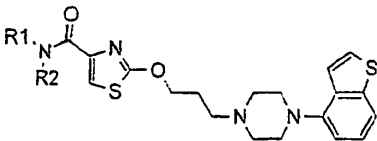
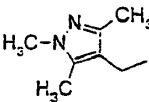
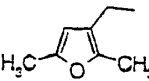
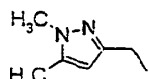
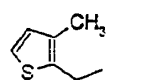
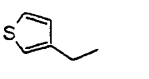
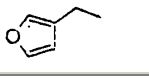
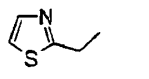
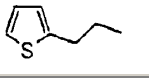
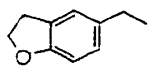
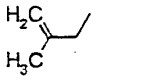
[Tabla 118]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1243		-H	508
1244		-H	514
1245		-H	514
1246		-H	500
1247		-H	514
1248		-H	516
1249		-H	530
1250		-H	551
1251		-H	543
1252		-H	546

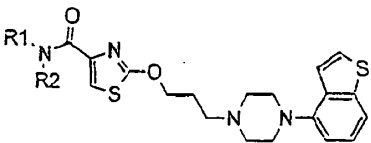
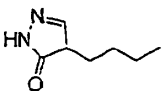
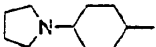
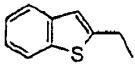
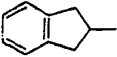
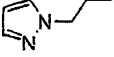
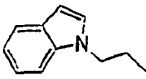
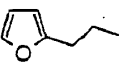
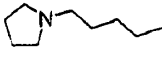
[Tabla 119]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1253		-H	533
1254		-H	499
1255		-H	528
1256		-H	487
1257		-H	509
1258		-H	508
1259		-H	508
1260		-H	497
1261		-H	497
1262		-H	496

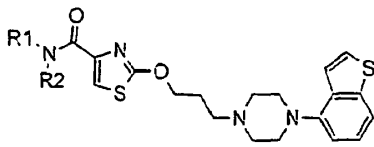
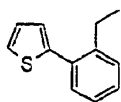
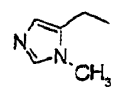
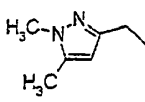
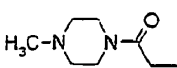
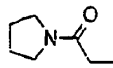
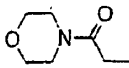
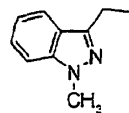
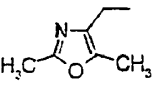
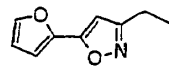
[Tabla 120]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1263		-H	525
1264		-H	511
1265		-H	511
1266		-H	513
1267		-H	499
1268		-H	483
1269		-H	500
1270		-H	513
1271		-H	535
1272		-H	457

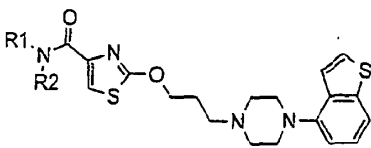
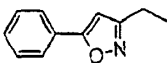
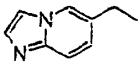
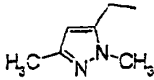
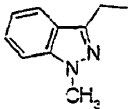
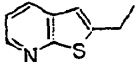
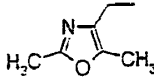
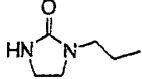
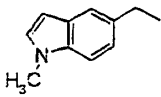
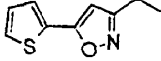
[Tabla 121]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1273		-H	527
1274		-H	554
1275		-H	549
1276		-H	519
1277		-H	519
1278		-H	497
1279		-H	546
1280		-H	497
1281		-H	528
1282		-H	487

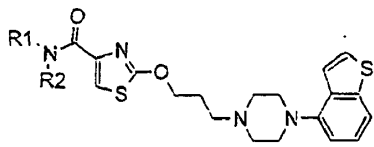
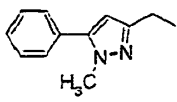
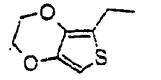
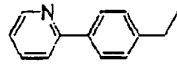
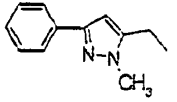
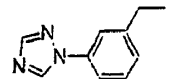
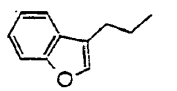
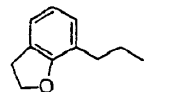
[Tabla 122]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1283		-H	575
1284		-CH ₃	511
1285		-CH ₃	525
1286		-CH ₃	557
1287		-CH ₃	528
1288		-CH ₃	544
1289		-H	547
1290		-CH ₃	526
1291		-CH ₃	564

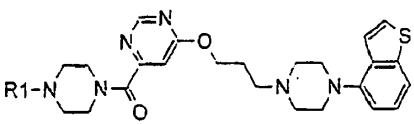
[Tabla 123]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1292		-CH ₃	574
1293		-CH ₃	547
1294		-H	511
1295		-CH ₃	561
1296		-CH ₃	564
1297		-H	512
1298		-H	515
1299		-CH ₃	560
1300		-H	566

[Tabla 124]

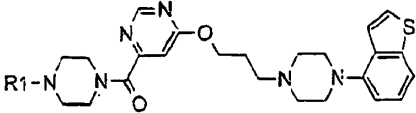
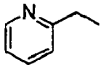
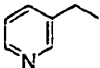
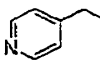
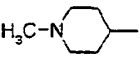
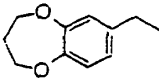
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1301		-H	573
1302		-CH ₃	571
1303		-CH ₃	584
1304		-CH ₂	587
1305		-H	560
1306		-H	547
1307		-H	549

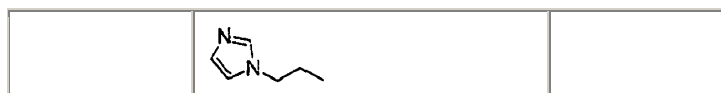
[Tabla 125]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1308	-2-PIRIDILO	544
1309	-C ₄ H ₅	523
1310	-CH(CH ₃) ₂	509
1311	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	538
1312	-4-PIRIDILO	544

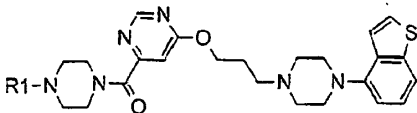
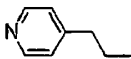
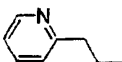
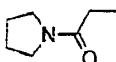
1313	-C ₆ H ₅	543
1314	-C ₂ H ₇	509
1315	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	525
1316	-CH ₃	481
1317	-3-PIRIDILO	544
1318	-C ₂ H ₁₃	551
1319	-C ₂ H ₅	495
1320	-CH ₂ CH ₂ OH	511
1321	-COCH ₃	509
1322	-ciclo-C ₆ H ₁₁	549
1323	-SO ₂ C ₂ H ₅	559

[Tabla 126]

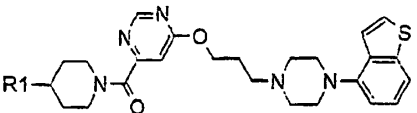
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1324		558
1325		558
1326		558
1327		545
1328		564
1329		629
1330		545
1331		551
1332		561



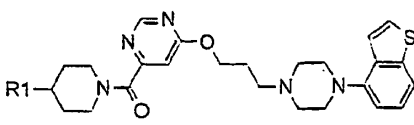
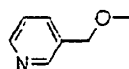
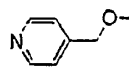
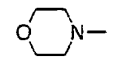
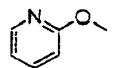
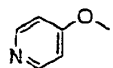
[Tabla 127]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1333		572
1334		572
1335		578
1336		550
1337		535

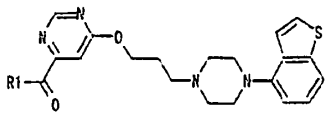
[Tabla 128]

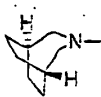
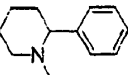
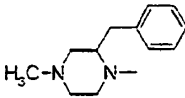
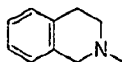
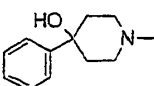
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1338	-OCH ₃	496
1339	-ciclo-C ₆ H ₁₁	548
1340	-C ₆ H ₅	542
1341	-OCH ₂ C ₈ H ₅	572
1342	-OC ₈ H ₅	558
1343	-OH	482
1344	-CONH ₂	509
1345	-C ₂ H ₅	494
1346	-NHCOCH ₃	523
1347	-COC ₆ H ₅	570
1348	-2-PIRIDILO	543

[Tabla 129]

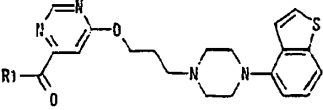
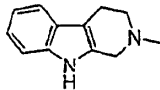
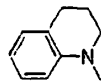
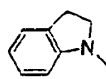
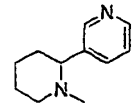
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1349		549
1350		573
1351		573
1352		551
1353		559
1354		559

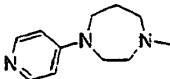
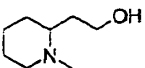
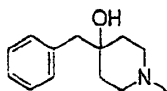
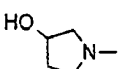
[Tabla 130]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1355		480
1356		520
1357		484
1358		470
1359		506

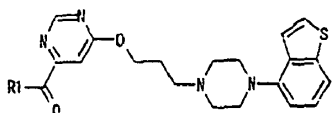
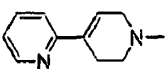
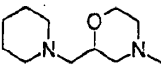
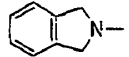
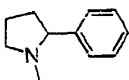
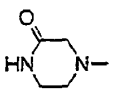
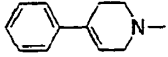
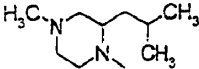
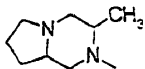
		
1360		534
1361		542
1362		571
1363		514
1364		558

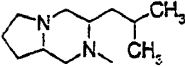
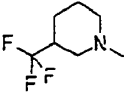
[Tabla 131]

		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1365		553
1366		514
1367		500
1368		495
1369		543
1370		558

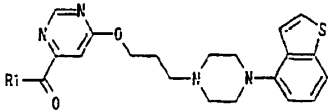
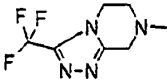
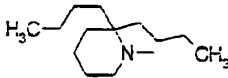
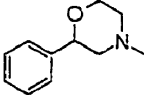
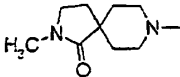
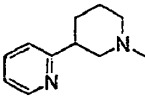
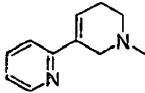
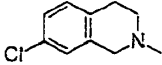
		
1371		510
1372		572
1373		468

[Tabla 132]

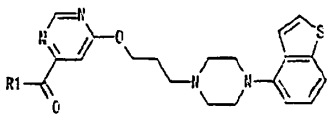
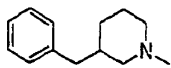
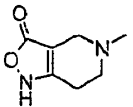
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1374		541
1375		565
1376		500
1377		528
1378		481
1379		540
1380		537
1381		521

1382		563
1383		534

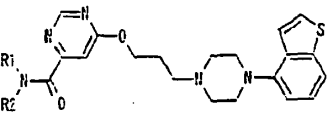
[Tabla 133]

[Tabla 133]		
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1384		573
1385		482
1386		578
1387		544
1388		549
1389		543
1390		541
1391		548

[Tabla 134]

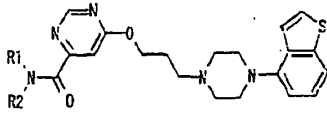
		
Ejemplo	R1	EM (M+1)
1392		556
1393		521
1394		438

[Tabla 135]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1395	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	494
1396	-H	-CH(CH ₃) ₂	440
1397	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	510
1398	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	510
1399	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	486
1400	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	566
1401	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	483
1402	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	514
1403	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	568
1404	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-CH ₂	525
1405	-CH ₂ CH=CH ₂	-ciclo-C ₅ H ₉	506
1406	-H	-C ₄ H ₉	454
1407	-H	-ciclo-C ₃ H ₅	438
1408	-H	-ciclo-C ₇ H ₁₃	494
1409	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	488
1410	-C ₂ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	558
1411	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
1412	-CH ₂ C ₈ H ₅	-ciclo-C ₆ H ₁₁	570
1413	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	516

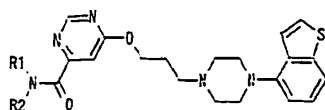
1414	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	502
1415	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
1416	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	558
1417	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	578
1418	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	516
1419	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	530
1420	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₅ H ₅	541
1421	-(CH ₂) ₂ OC ₅ H ₅	-CH ₃	532
1422	-ciclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	508

[Tabla 136]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1423	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	468
1424	-H	-C ₂ H ₅	426
1425	-H	-C ₃ H ₇	440
1426	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	456
1427	-CH ₃ -ciclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	522
1428	-C ₂ H ₅	-C ₄ H ₂	482
1429	-H	-1-CH ₂ -CYCLOHEXYL	494
1430	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	518
1431	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	564
1432	-C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	518
1433	-C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	502
1434	-CH ₂ CH ₂ CN	-C ₆ H ₅	527
1435	-2-PIRIDILO	-C ₂ H ₅	503
1436	-H	-C ₆ H ₅	474
1437	-H	-3-PIRIDILO	475
1438	-H	-2-PIRIDILO	475
1439	-H	-4-PIRIDILO	475
1440	-C ₆ H ₅	-CH ₃	488
1441	-H	-CH ₂ -ciclo-C ₈ H ₁₁	494
1442	-H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	516
1443	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	502
1444	-H	-CH ₂ CONH ₂	455
1445	-H	-CH ₂ CCH	436
1446	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	482
1447	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	454

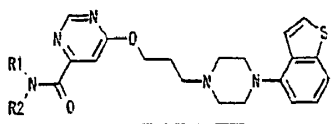
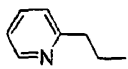
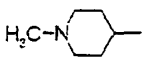
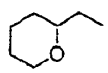
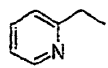
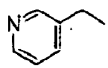
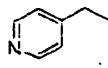
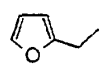
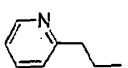
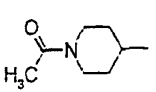
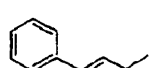
1448	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	468
1449	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	468
1450	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	469

[Tabla 137]

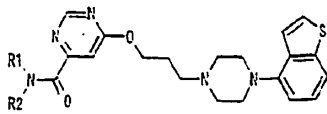
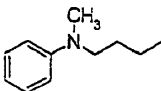
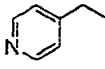
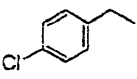
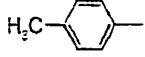
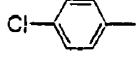
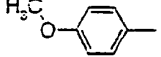
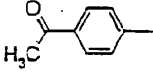
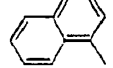
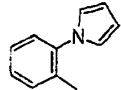


Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1451	-CH ₂ C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₃ OH	546
1452	-CH ₃	-CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	466
1453	-H	-CH ₂ CF ₃	480
1454	-H	-NHCH ₂ CF ₃	495
1455	-CH ₃	-CH ₃	426
1456	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	498
1457	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	482
1458	-H	-CH ₂ CN	437
1459	-H	-(CH ₂) ₂ OCH ₃	470
1460	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	484
1461	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	451
1462	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	469
1463	-H	-(CH ₂)SCH ₃	472
1464	-H	-CH ₂ CHF ₂	462
1465	-H	-C ₆ H ₁₃	482
1466	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	497
1467	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	546
1468	-H	-(CH ₂) ₂ NHCONH ₂	484

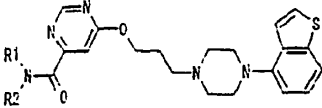
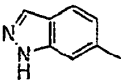
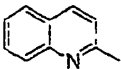
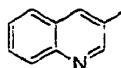
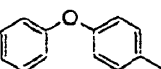
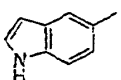
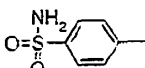
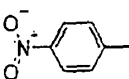
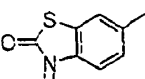
[Tabla 138]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1469		-CH ₃	517
1470		-CH ₃	509
1471		-C ₂ H ₅	524
1472		-H	489
1473		-H	489
1474		-H	489
1475		-H	478
1476		-C ₂ H ₅	531
1477		-CH ₃	537
1478		-C ₂ H ₅	542

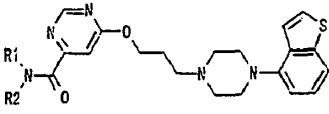
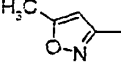
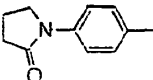
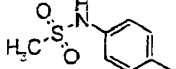
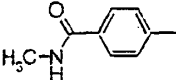
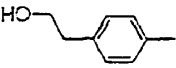
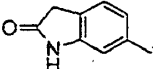
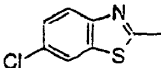
[Tabla 139]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1479		-CH ₃	559
1480		-C ₂ H ₅	517
1481		-H	452
1482		-H	480
1483		-CH ₃	536
1484		-CH ₂	502
1485		-H	508
1486		-H	504
1487		-H	516
1488		-H	524
1489		-H	539

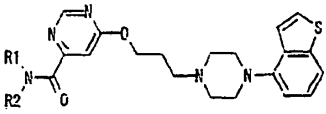
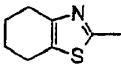
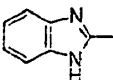
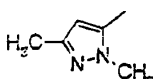
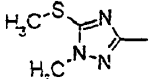
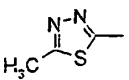
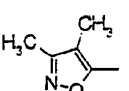
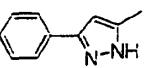
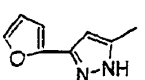
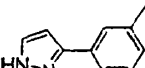
[Tabla 140]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1490		-H	514
1491		-H	525
1492		-H	525
1493		-H	566
1494		-H	513
1495		-H	553
1496		-H	481
1497		-H	476
1498		-H	519
1499		-H	547

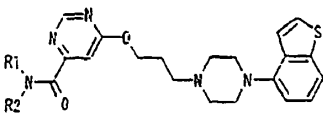
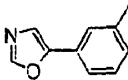
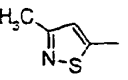
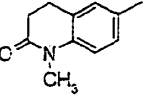
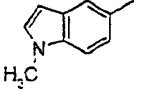
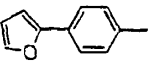
[Tabla 141]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1500		-H	465
1501		-H	466
1502		-H	479
1503		-H	557
1504		-H	567
1505		-H	531
1506		-H	518
1507		-H	529
1508		-H	565

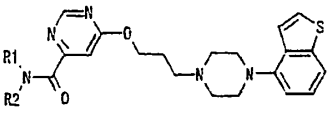
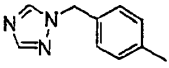
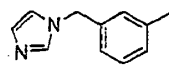
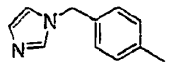
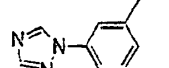
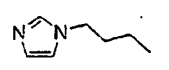
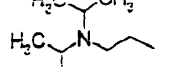
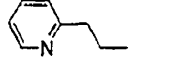
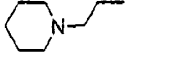
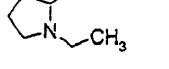
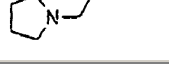
[Tabla 142]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1509		-H	535
1510		-H	514
1511		-H	492
1512		-H	525
1513		-H	496
1514		-H	493
1515		-H	540
1516		-H	530
1517		-H	540

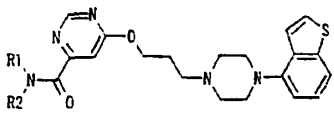
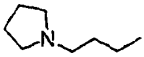
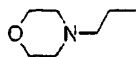
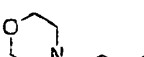
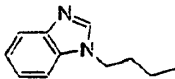
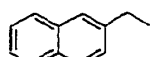
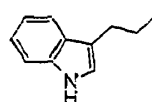
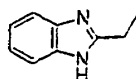
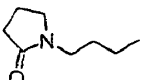
[Tabla 143]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1518		-H	541
1519		-H	525
1520		-H	478
1521		-H	476
1522		-H	495
1523		-H	465
1524		-H	557
1525		-H	527
1526		-H	540

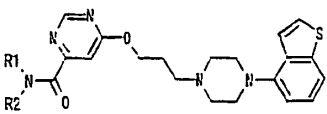
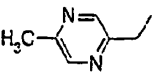
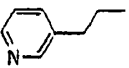
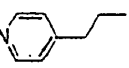
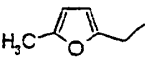
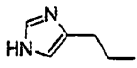
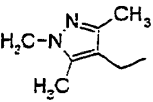
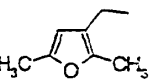
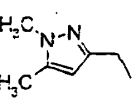
[Tabla 144]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1527		-H	555
1528		-H	554
1529		-H	554
1530		-H	541
1531		-H	506
1532		-H	525
1533		-H	503
1534		-H	509
1535		-H	509
1536		-H	495

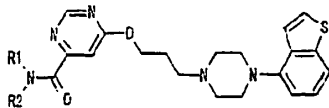
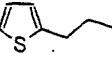
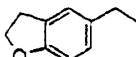
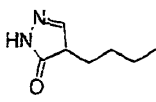
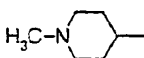
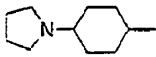
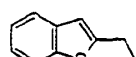
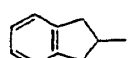
[Tabla 145]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1537		-H	509
1538		-H	511
1539		-H	525
1540		-H	556
1541		-H	538
1542		-H	541
1543		-H	528
1544		-H	494
1545		-H	523
1546		-H	482

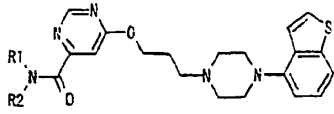
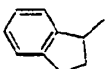
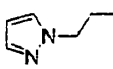
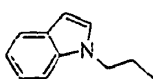
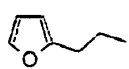
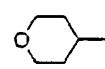
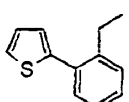
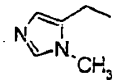
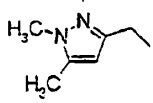
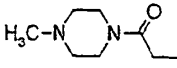
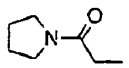
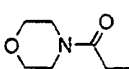
[Tabla 146]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1547		-H	504
1548		-H	503
1549		-H	503
1550		-H	492
1551		-H	492
1552		-H	491
1553		-H	520
1554		-H	506
1555		-H	506
1556		-H	508

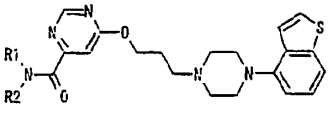
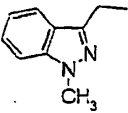
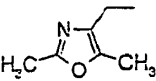
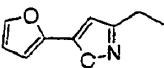
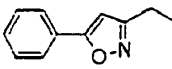
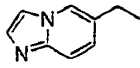
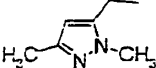
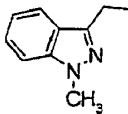
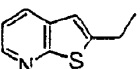
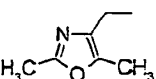
[Tabla 147]

			
Ejemplos	R1	R2	EM (M+1)
1557		-H	494
1558		-H	478
1559		-H	495
1560		-H	508
1561		-H	530
1562		-H	452
1563		-H	522
1564		-H	495
1565		-H	549
1566		-H	544
1567		-H	514

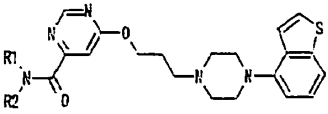
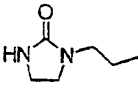
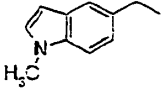
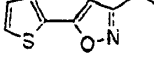
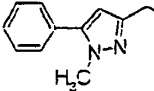
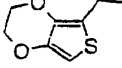
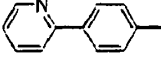
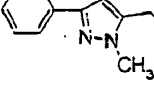
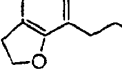
[Tabla 148]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1568		-H	514
1569		-H	492
1570		-H	541
1571		-H	492
1572		-H	482
1573		-H	570
1574		-CH ₃	506
1575		-CH ₃	520
1576		-CH ₃	552
1577		-CH ₃	523
1578		-CH ₃	539

[Tabla 149]

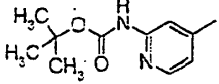
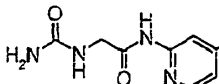
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1579		-H	542
1580		-CH ₃	521
1581		-CH ₃	559
1582		-CH ₃	569
1583		-CH ₃	542
1584		-H	506
1585		-CH ₃	556
1586		-CH ₃	559
1587		-H	507

[Tabla 150]

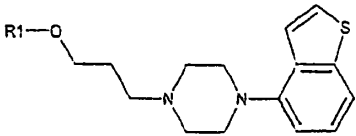
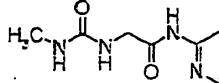
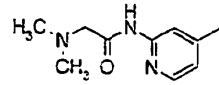
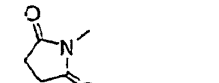
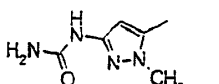
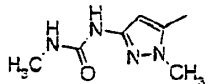
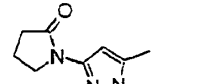
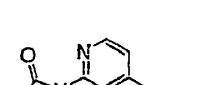
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1588		-H	510
1589		-CH ₃	555
1590		-H	561
1591		-H	568
1592		-CH ₃	566
1593		-CH ₃	579
1594		-CH ₃	582
1595		-H	544

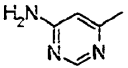
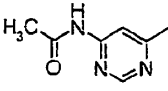
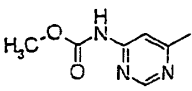
[Tabla 151]

Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1596		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ Metanol)	214- 217	Hidrocloreuro
1597		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ Metanol)	218- 222	1/2 fumarato
1598		Cristales en forma de agujas incoloras (Etanol)	195- 196	-
1599		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	145- 146	-
1600		Polvo de color blanco (Etanol/ acetato de etilo)	219- 221	Dihidrocloreuro
1601		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	162- 164	-
1602		Polvo de color blanco (Etanol/éter)	208.5- 209.5	Dihidrocloreuro
1603		Polvo de color blanco (n- hexano/ acetato de etilo)	137- 139	-
1604		Polvo de color blanco (Etanol)	137- 139	-
1605		Polvo de color	163-	-

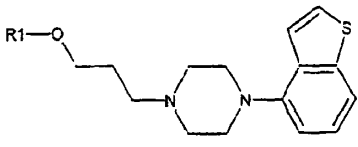
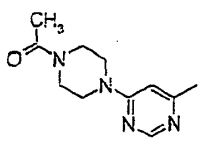
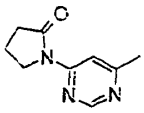
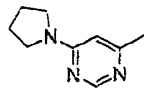
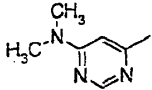
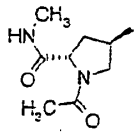
		blanco (Acetato de etilo)	165	
1606		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	196-199	-

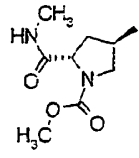
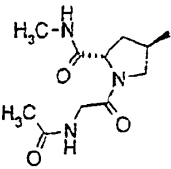
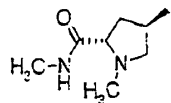
[Tabla 152]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1607		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	197-199	-
1608		Polvo de color blanco (Etanol)	232-233	Dihidrocloruro
1609		Polvo de color blanco (Etanol/éter)	255-257	Hidrocloruro
1610		Polvo de color blanco (Etanol)	169.5-172.5	-
1611		Polvo de color blanco (Etanol)	195.0-196.5	-
1612		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	151.5-153.5	-
1613		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	235.0 (desc.)	Hidrocloruro
1614				

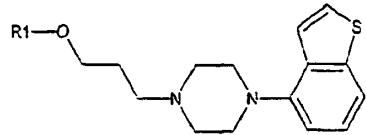
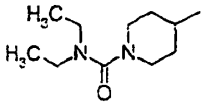
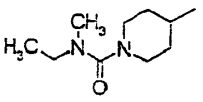
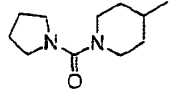
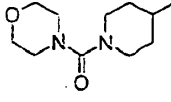
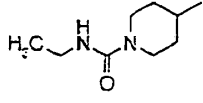
				
1615		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	224.0-227.5	Hidrocloreuro
1616		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	175.0-178.5	-

[Tabla 153]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1617		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	169.0-173.0	- Trihidrocloreuro
1618				
1619		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	210.0-217.0	Dihidrocloreuro
1620		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	181.0-188.0	Dihidrocloreuro
1621		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	163.5-167.0	Hidrocloreuro
1622		Polvo de color blanco (acetato de etilo)	172.5-176.5	Hidrocloreuro

		etilo/éter)		
1623		Polvo de color blanco (Ethyl acetate/éter)	145.0-151.0	Dihidrocloruro
1624		Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo)	144.0-150.0	Dihidrocloruro

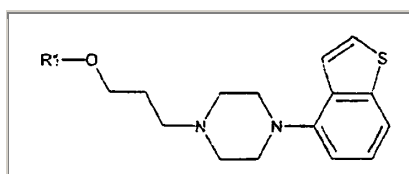
[Tabla 154]

				
Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1625		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	177-182	Dihidrocloruro
1626		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	198-201	Hidrocloruro
1627		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	195-200	Hidrocloruro
1628		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	215-218	Hidrocloruro
1629		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	152-157	Hidrocloruro
1630		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	158-161	Hidrocloruro

1631		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	168-172	Hidrocloruro
1632		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	178.5-181.5	-
1633		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	228.0 (desc.)	Hidrocloruro

[Tabla 155]

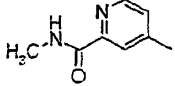
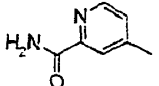
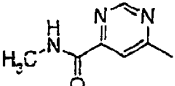
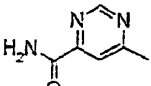
Ejemplo	R1	RMN Sal
1634		RMN H1 (DMSO-d6) δ ppm: 1,95-210 (2H, m), 2,85-2,95 (2H, m), 3,00-3,15 (4H, m), 3,15-3,30 (4H, m), 4,41 (2H, t, J = 5,8 Hz), 6,89 (1H, d, J = 5,0 Hz), 7,15 (1H, s), 7,26 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,43 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,63 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,71 (1H, d, J = 5,5 Hz), 8,73 (1H, s),
1635		RMN H1 (CDCl ₃) δ ppm: 1,72-1,98 (4H, m), 2,30-2,46 (1H, m), 2,46-2,58 (2H, m), 2,62-2,77 (5H, m), 2,80 (3H, d, J = 5,1 Hz), 3,04-3,29 (5H, m), 3,38-3,55 (2H, m), 3,83-4,04 (2H, m), 6,90 (1H, dd, J = 0,5 Hz, 7,6 Hz), 7,22-7,34 (1H, m), 7,34-7,47 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,63 (1H, ancho),
1636		RMN H1 (CDCl ₃) δ ppm: 1,46 (9H, s), 1,70-1,89 (2H, m), 1,90-2,17 (1H, m), 2,44-2,60 (2H, m), 2,62-2,75 (4H, m), 2,81 (3H, d, J = 4,7 Hz), 3,09-3,26 (4H, m), 3,39-3,57 (4H, m), 3,93-4,21 (1H, m), 4,21-4,46 (1H, m), 6,65-6,95 (1H, ancho), 6,90 (1H, d, J = 7,0 Hz), 7,20-7,34 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz),



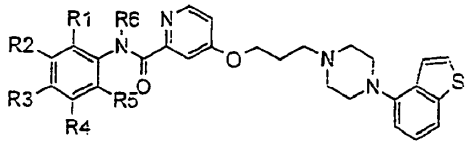
Ejemplo	R1	EM (M+1)	Sal
1637		440	Hidrocloruro
1638		360	Maleate

[Tabla 156]

Ejemplo	R1	Forma Cristalina (Disolvente de recristalización)	Punto de Fusión (°C)	Sal
1639		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter)	215.5-216.5	Hidrocloruro
1640				
1641		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	132.5-135.0	-
1642		Polvo de color blanco (2-propanol/agua)	180.0-182.0	-
1643		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	216.0-220.2	Hidrocloruro
1644		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	203.0-207.0	Hidrocloruro

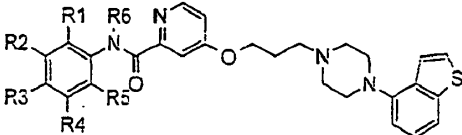
				
1645		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/ éter isopropílico)	146.5-148.0	-
1646		Polvo de color blanco (Acetato de etilo)	197.0-201.0	Hidrocloruro
1647		Polvo de color blanco (Acetato de etilo/éter isopropílico)	133.0-134.5	-

[Tabla 157]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
1648	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	517
1649	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	501
1650	-H	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	521
1651	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	519
1652	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	519
1653	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	541
1654	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	557
1655	-H	-H	-H	-H	-H	-H	473
1656	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	507
1657	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	503
1658	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	503
1659	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	503
1660	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	507
1661	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	507
1662	-H	-H	-CH ₂	-H	-H	-H	487
1663	-OCH ₂	-H	-OCH ₂	-H	-H	-H	533
1664	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	516
1665	-1-PIRIDILO	-H	-H	-H	-H	-H	538
1666	-H	-Cl	-H	-H	-DCH ₃	-H	537

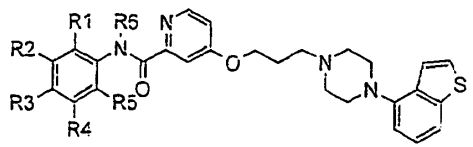
1667	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	533
1668	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	533
1669	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	517
1670	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	533
1671	-C(CH ₃)=CH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	513
1672	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	557
1673	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	487
1674	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	487
1675	-F	-H	-H	-H	-H	-H	491

[Tabla 158]

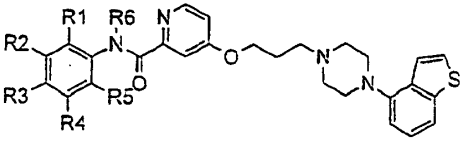
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
1676	-H	-H	-F	-H	-H	-H	491
1677	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	516
1678	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	516
1679	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	541
1680	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	541
1681	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	530
1682	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	530
1683	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	498
1684	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	498
1685	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	501
1686	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	501
1687	-H	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	521
1688	-H	-H	-OH	-H	-H	-CH ₃	503
1689	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	501
1690	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	501
1691	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	501
1692	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	501
1693	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	501
1694	-F	-F	-H	-H	-H	-H	509
1695	-H	-F	-F	-H	-H	-H	509
1696	-H	-F	-H	-F	-H	-H	509
1697	-H	-F	-OCH ₃	-H	-H	-H	521
1698	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	517
1699	-H	-Cl	-OCH ₃	-H	-H	-H	537

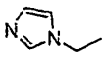
1700	-H	-Cl	-CH ₃	-H	-H	-H	521
1701	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	533
1702	-H	-Cl	-OH	-H	-H	-H	523
1703	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	521

[Tabla 159]

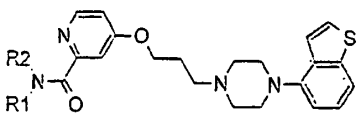
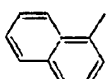
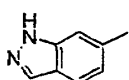
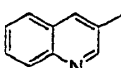
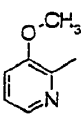
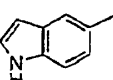
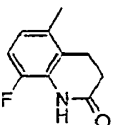
							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
1704	-H	-CONH ₂	-H	-H	-Cl	-H	550
1705	-CH ₃	-H	-Br	-H	-CH ₃	-H	579
1706	-H	-H	-CN	-H	-H	-H	498
1707	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	519
1708	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	515
1709	-H	-H	-2-FURILO	-H	-H	-H	539

[Tabla 160]

							
Ejemplo	R1	R2	R3	R4	R5	R6	EM (M+1)
1710	-H		-H	-H	-H	-H	539
1711	-H		-H	-H	-H	-H	540
1712	-H		-H	-H	-H	-H	542
1713	-H	-H		-H	-H	-H	554
1714	-H		-H	-H	-H	-H	553
1715	-H	-H		-H	-H	-H	553

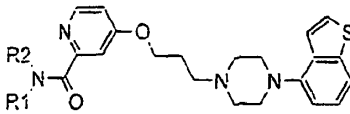
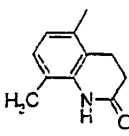
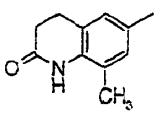
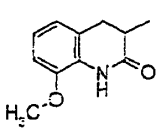
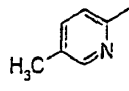
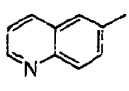
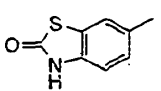
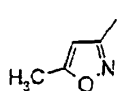
							
1716	-H		-H	-H	-H	-H	540

[Tabla 161]

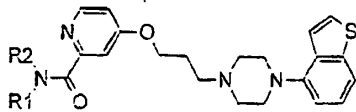
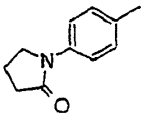
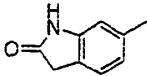
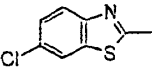
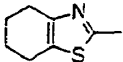
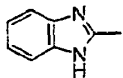
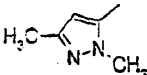
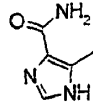
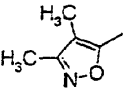
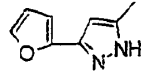
			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1717		-H	474
1718		-H	523
1719		-H	513
1720		-H	474
1721		-H	474
1722		-H	524
1723		-H	504
1724		-H	512
1725		-H	560

[

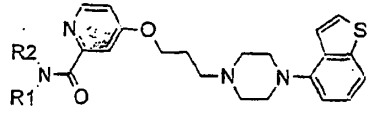
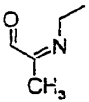
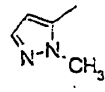
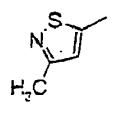
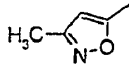
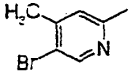
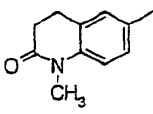
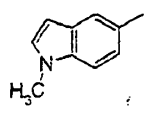
Tabla 162]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1726		-H	556
1727		-H	556
1728		-H	572
1729		-H	488
1730		-H	480
1731		-H	524
1732		-H	546
1733		-H	478

[Tabla 163]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1734		-H	556
1735		-H	528
1736		-H	564
1737		-H	534
1738		-H	513
1739		-H	491
1740		-H	506
1741		-H	492
1742		-H	529

[Tabla 164]

			
Ejemplo	R1	R2	EM (M+1)
1743		-H	480
1744		-H	477
1745		-H	494
1746		-H	464
1747		-H	478
1748		-H	566
1749		-H	556
1750		-H	526

Ejemplo 1751 (Referencia)**Síntesis de 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-benzamida**

- 5 Se añadió paladio sobre carbono al 5% (0,8 g) a una disolución etanólica (30 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-3-nitrobenzamida (1,0 g, 2,1 mmoles) y la mezcla se sometió a la reducción catalítica a temperatura ambiente a presión normal. El catalizador se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió agua al residuo y la disolución se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : Metanol = 30:1 → 20:1). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-benzamida (0,78 g, rendimiento 83%) en forma de un sólido amorfo de color amarillo.
- 10 RMN ^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, s ancho), 3,21 (4H, s ancho), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, ancho), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 5,99 (1H, s ancho), 6,80 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 2,1, 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).
- 15

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

- 20 Se añadió trietilamina (0,28 ml, 2,0 mmoles) a una disolución en diclorometano (15 ml) de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(piperidin-4-iloxi)-propil]-piperazina (0,45 g, 1,25 mmoles) y la mezcla se enfrió en un baño de hielo. A esto, se le añadió cloruro de acetilo (0,1 ml, 1,4 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con diclorometano. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 30:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Al residuo, se le añadió una disolución 0,5 N de hidrocloreto-metanol (3 ml). Los cristales producidos se obtuvieron mediante filtración y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetilpiperidin-4-iloxi)propil]piperazina en forma de polvo de color blanco (0,36 g, rendimiento 66%).
- 25
- 30 Punto de fusión: 208-210°C

Ejemplo 1753**Síntesis de Hidrocloreto de 1-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]pirrolidino-2,5-diona**

- 35 Se añadieron PS-trifenilfosfina (3 mmoles/g, 1,80 g), azodicarboxilato de di-terc-butilo (1,27 g, 5,4 mmoles) y N-hidroxisuccinimida (510 mg, 4,3 mmoles) a una disolución en THF (50 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (1,00 g, 3,6 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La resina se eliminó mediante filtración y el producto filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 1:2). El producto purificado se concentró a presión reducida para obtener un sólido amorfo de color blanco (762 mg, rendimiento 47%). Se disolvieron 157 mg del sólido amorfo de color blanco en etanol. A la disolución, se le añadió una disolución 1N de ácido clorhídrico-etanol (0,42 ml) y se añadió éter adicionalmente. La disolución se dejó estar en un refrigerador. Los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-pirrolidino-2,5-diona (158 mg) en forma de polvo de color blanco.
- 40
- 45 Punto de fusión: 255,0-257,0°C

Ejemplo 1754 (Referencia)**Síntesis de amiduro de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]naftalen-1-carboxílico**

- 50 Se añadieron trietilamina (0,24 ml, 1,7 mmoles) y cloroformiato de isobutilo (0,19 ml, 1,4 mmoles) a una disolución en acetonitrilo (10 ml) de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-naftalen-1-carboxílico (0,52 g; 1,2 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó durante 20 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió agua amoniacal al 28% (0,5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. A la disolución de reacción, se le añadió acetato de etilo y la disolución se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recristalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo-éter diisopropílico para obtener amiduro de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-naftalen-1-carboxílico (0,27 g, rendimiento 53%) en forma de polvo de color blanco.
- 55
- 60 Punto de fusión 167,0-169,0°C

Ejemplo 1755**Síntesis de metilamina de ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico**

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

Punto de fusión 138,5-140,5°C

Ejemplo 1756 (Referencia)**Síntesis de amido de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanocarboxílico**

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

Punto de fusión 107,5-108,5°C

Ejemplo 1757 (Referencia)**Síntesis de hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil}amido de ácido etanosulfónico**

Una disolución en diclorometano (4 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenilamina (0,2 g, 0,49 mmoles) se enfrió sobre hielo. A esto, se le añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmoles) y cloruro de etanosulfonilo (0,07 ml, 0,73 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Nuevamente, se añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmoles) y cloruro de etanosulfonilo (0,07 ml, 0,73 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 19 horas. A esto, se añadieron una disolución de hidróxido de sodio 6N (0,5 ml) y etanol (2 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió diclorometano a la disolución de reacción, que después se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano : acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadió al residuo una disolución de hidrocloreto 4N/acetato de etilo. Los cristales generados se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil}amido de ácido etanosulfónico (222 mg, rendimiento 85%) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 235,5-237,5°C

Ejemplo 1758**Síntesis de éster metílico de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-carbámico**

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

en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 162,5-165,0°C.

Ejemplo 1759

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

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

Ejemplo 1760

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

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

Ejemplo 1761

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

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

Ejemplo 1762

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

En primer lugar, se añadió hidrocloreto de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (1,28 g, 2,4 mmoles) a una disolución acuosa de hidrocloreto de potasio. La mezcla se extrajo con diclorometano. La disolución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (15 ml). A la disolución, se le añadió borohidruro de sodio (0,05 g, 1,2 mmoles) enfriando con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. A continuación, se añadió ácido clorhídrico al 10% a la mezcla enfriando con hielo para descomponer el reactivo presente en exceso. Después se añadió una disolución acuosa 6N de hidróxido de sodio a la disolución para convertirla en una disolución alcalina, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El

residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : acetato de etilo = 3:7 → diclorometano : Metanol = 100:3). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en etanol. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol. Los cristales producidos se recrystalizaron en etanol para obtener hidrocloreto de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-3-hidroximetil-5-metoxifenil}oxazolidin-2-ona (0,52 g, rendimiento 41%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 224,0-226,5°C (descomp.)

Ejemplo 1763 (Referencia)

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

Se añadieron hidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-bromo-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]piperazina (0,5 g, 0,98 mmoles), 1-acetilpiperazina (0,15 g, 1,2 mmoles), acetato de paladio (11 mg, 0,048 mmoles), 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) (63 mg, 0,098 mmoles) y t-butoxido de sodio (0,23 g, 2,3 mmoles) a tolueno (10 ml) y la mezcla se agitó en atmósfera de argón a 90°C durante 22 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró con cerite. La torta del filtro se lavó con acetato de etilo. El producto filtrado y el líquido de lavado se combinaron y después de eso se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 11:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener hidrocloreto de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}piperazina (75 mg, rendimiento 14%) en forma de polvo de color blanco.
Punto de fusión: 257,0-261,0 °C (descomp.)

25 Ejemplo 1764 (Referencia)

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

Se añadieron 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-iodo-2-metoxi-6-metil-fenoxi)-propil]-piperazina (0,6 g, 0,69 mmoles), imidazol (0,07 g, 1,03 mmoles), yoduro de cobre (I) (15 mg, 0,069 mmoles), trans-N,N'-dimetil-1,2-ciclohexanodiamina (0,02 ml, 0,14 mmoles) y carbonato de cesio (0,47 g, 1,38 mmoles) a 1,4-dioxano (6 ml) y la mezcla se sometió a reflujo calentando en atmósfera de argón durante 50 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción resultante a temperatura ambiente, se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 5:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se filtraron y se secaron para obtener dihidrocloreto de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]-piperazina (60 mg, rendimiento 17%) en forma de polvo de color amarillo claro.
Punto de fusión: 234,0-240,0°C (descomp.).

45 Ejemplo 1765 (Referencia)

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

Se añadieron carbonato de cesio (0,34 g, 0,99 mmoles) y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,05 ml, 0,47 mmoles) a una disolución en DMF (2 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroxi-5,N-dimetilbenzamida (188 mg, 0,39 mmoles), y la mezcla se agitó a 40°C durante 2 horas. A continuación, se añadió nuevamente 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,1 ml, 0,94 mmoles) y la mezcla se agitó a 40°C durante 5 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente, se añadió agua a la disolución de reacción, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice alcalina (n-hexano: acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en alcohol isopropílico. Se añadió a esto una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de alcohol isopropílico/acetato de etilo para obtener hidrocloreto de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)benzamida (88 mg, rendimiento 40%) en forma de polvo de color amarillo claro.
Punto de fusión: 156,0-157,5°C

Ejemplo 1766**Síntesis de hidrocloreto de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-etanona**

Se añadió hidrocloreto de metoximetilamido de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,61 g, 1,3 mmoles) a una disolución acuosa de hidróxido de sodio y la mezcla disolvente se extrajo con diclorometano. La disolución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (12 ml). La disolución se enfrió a -78°C y a esto se añadió una disolución de metil litio 1N-éter (1,2 ml) y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 2 horas. A la disolución de reacción, se le añadió una disolución acuosa de cloruro de amonio y la disolución se calentó a temperatura ambiente. Se añadió cloruro de potasio a la disolución, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en etanol. A esto se añadió una disolución de ácido clorhídrico 1N/etanol y los cristales producidos se recrystalizaron en etanol que contenía agua para obtener hidrocloreto de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}etanona (0,22 g, rendimiento 40%) en forma de polvo de color blanco.

Punto de fusión: 245,0°C (descomp.)

Ejemplo 1767**Síntesis de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol**

Una disolución en THF (8 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-(terc-butil-dimetilsilaniloximetil)-1-metil-1H-pirazol (0,75 g, 1,5 mmoles) se enfrió sobre hielo y a esto se añadió una disolución 1M en THF de fluoruro de tetrabutilamonio (1,7 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió acetato de etilo a la disolución de reacción, que se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de eso se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (diclorometano : metanol = 1:0 → 30:1 → 15:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en una mezcla disolvente de acetato de etilo y éter diisopropílico para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol (0,46 g, rendimiento 79%) en forma de polvo de color blanco.

Temperatura de fusión: 123,5-126,0°C

Ensayo Farmacológico 1**1) Análisis de unión al receptor D₂ de dopamina**

El análisis se realizó de acuerdo con el método de Kohler et al. (Kohler C, Hall H, Ogren SO y Gawell L, Specific in vitro and in vivo binding of 3H-racloprida. A potent substituted benzamida drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259).

Se decapitaron ratas macho Wistar, los cerebros se retiraron inmediatamente y se recogió el cuerpo estriado. Éste se homogeneizó en tampón tris(hidroximetil)-aminometano (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) de un volumen de 50 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 48.000 × g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón anteriormente descrito de un volumen de 50 veces el peso del tejido y después de incubar a 37°C durante 10 minutos, se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl₂ 2 mM, MgCl₂ 1 mM, pH 7,4) de un volumen de 25 veces el peso del tejido y se conservó congelando a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

El análisis de unión se realizó utilizando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de racloprida-[H³] (concentración final 1 a 2 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl₂ 2 mM, MgCl₂ 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total fue 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido 1%). La reacción se realizó a temperatura ambiente durante 1 hora y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio. La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radiactividad en presencia de (+)-hidrocloreto de butaclamol 10 µM se adoptó como la unión no específica.

El valor de CI₅₀ se calculó a partir de la reacción dependiente de la concentración utilizando un programa de análisis

no lineal. El valor de K_i se calculó a partir del valor de CI_{50} utilizando la fórmula de Cheng-Prusoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 132.

[Tabla 165]

Ensayo de unión al receptor D2 de Dopamina	
Compuesto de ensayo	K_i (nM)
Compuesto del Ejemplo 3	1,5
Compuesto del Ejemplo 4	1,9
Compuesto del Ejemplo 6	0,7
Compuesto del Ejemplo 7	0,8
Compuesto del Ejemplo 21	2,6
Compuesto del Ejemplo 22	1,5
Compuesto del Ejemplo 27	2,5
Compuesto del Ejemplo 35	3,1
Compuesto del Ejemplo 43	2,3
Compuesto del Ejemplo 53	2,0
Compuesto del Ejemplo 56	5,0
Compuesto del Ejemplo 57	1,6
Compuesto del Ejemplo 67	3,4
Compuesto del Ejemplo 68	1,3
Compuesto del Ejemplo 71	2,5
Compuesto del Ejemplo 75	1,6
Compuesto del Ejemplo 105	1,0
Compuesto del Ejemplo 109	1,2
Compuesto del Ejemplo 112	0,7
Compuesto del Ejemplo 123	1,4

5

2) Análisis de unión al receptor 5-HT_{2A} de serotonina

El análisis se realizó de acuerdo con el método de Leysen JE et al. (Leysen JE, Niemegeers CJE, Van Nueten JM y Laduron PM. [3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982, 21: 301-314).

Se decapitaron ratas Wistar macho, el cerebro se retiró inmediatamente y se recogió el córtex frontal. Éste se homogeneizó en sacarosa 0,25 M de un volumen 10 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador de vidrio y Teflón, y se centrifugó a 4°C, 1.000 × g durante 10 minutos. El sobrenadante obtenido se transfirió a otro tubo de centrífuga y se suspendió en sacarosa 0,25 M de un volumen 5 veces el peso del tejido y el precipitado se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El sobrenadante obtenido se combinó con el sobrenadante obtenido antes y se ajustó a un volumen de 40 veces el peso del tejido con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y se centrifugó a 4°C, 35.000 × g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 40 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se conservó congelando a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

El análisis de unión se realizó utilizando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de Cetanserina-[H³] (concentración final 1 a 3 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) de manera que la cantidad final fue 200 µl (concentración final en dimetilsulfóxido al 1%). La reacción se realizó a 37°C durante 20 minutos y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radioactividad en presencia de espiperona 10 μ M se adoptó como la unión no específica.

5 El valor de CI_{50} se calculó a partir de una reacción dependiente de la concentración utilizando un programa de análisis no lineal. El valor de K_i se calculó a partir del valor de CI_{50} utilizando la fórmula de Cheng-Prusoff. Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 166.

10 [Tabla 166]

Ensayo de unión al receptor 5-HT _{2A} de serotonina	
Compuesto de ensayo	K_i (nM)
Compuesto del Ejemplo 3	6,0
Compuesto del Ejemplo 4	7,7
Compuesto del Ejemplo 6	3,3
Compuesto del Ejemplo 7	2,9
Compuesto del Ejemplo 21	0,8
Compuesto del Ejemplo 22	1,0
Compuesto del Ejemplo 27	1,4
Compuesto del Ejemplo 35	0,6
Compuesto del Ejemplo 43	3,8
Compuesto del Ejemplo 53	4,9
Compuesto del Ejemplo 56	4,9
Compuesto del Ejemplo 57	4,7
Compuesto del Ejemplo 67	3,4
Compuesto del Ejemplo 68	5,6
Compuesto del Ejemplo 71	1,7
Compuesto del Ejemplo 75	3,3
Compuesto del Ejemplo 105	7,1
Compuesto del Ejemplo 109	4,9
Compuesto del Ejemplo 112	5,0
Compuesto del Ejemplo 123	19,7

3) Análisis de unión al receptor α_1 de adrenalina

15 El análisis se realizó de acuerdo con el método de Groß G et al. (Groß G, Hanft G y Kolassa N. Urapidil and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hydroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT_{1A} subtype and for α_1 -adrenoceptor binding sites. Naunin-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 1987, 336: 597-601).

20 Se decapitaron ratas Wistar macho, el cerebro se retiró inmediatamente y se recogió el córtex cerebral. Éste se homogeneizó en tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (NaCl 100 mM, que contenía dihidrogeno-etilendiaminotetraacetato disódico 2 mM, pH 7,4) de un volumen de 20 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador con una cuchilla giratoria de alta velocidad, y se centrifugó a 4°C, 80.000 $\times$ g durante 20 minutos. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y después de incubarlo a 37°C durante 10 minutos, se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas.

25 El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se centrifugó en las condiciones anteriormente descritas. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo dihidrogeno etilendiaminotetraacetato disódico 1 mM, pH 7,4) de un volumen de 20 veces el peso del tejido y se conservó congelándolo a -85°C hasta que se utilizó para el análisis de unión como espécimen de membrana.

El análisis de unión se realizó utilizando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de prazosina- $[H^3]$ (concentración final 0,2 a 0,5 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (conteniendo EDTA 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total fue 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido 1%). La reacción se realizó a 30°C durante 45 minutos y se terminó llevando a cabo la filtración mediante succión con una cosechadora celular sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

La placa del filtro elaborada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después de secarla, se añadió un cóctel de centelleo líquido para microplacas y la radiactividad se midió con un contador de centelleo de microplacas. La radioactividad en presencia de hidrocloreuro de fentolamina 10 µM se adoptó como la unión no específica.

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

Ensayo Farmacológico 2

Actividad agonística parcial sobre el receptor D_2 de dopamina utilizando células que expresan el receptor D_2

La actividad agonística parcial sobre el receptor D_2 de dopamina se evaluó determinando cuantitativamente el efecto inhibidor de la producción de AMP cíclico de un compuesto de ensayo en células que expresan el receptor D_2 de dopamina en las que se indujo la producción de monofosfato de adenosina 3',5'-cíclico (AMP cíclico) mediante estimulación con forskolina.

Se cultivaron células de ovario de hámster Chino/DHFR(-) que expresan el receptor D_2 de dopamina recombinante humano en un medio de cultivo (Medio de Dulbecco Modificado por Iscove (medio de cultivo IMDM), suero bovino fetal al 10%, penicilina de 50 U.I./ml, estreptomycin de 50 µg/ml, geneticina de 200 µg/ml, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 µM) a 37°C y en condiciones de dióxido de carbono al 5%. Las células se sembraron a 10^4 células/pocillo en una placa de microtitulación de 96 pocillos revestida con poli-L-lisina y se desarrollaron en las mismas condiciones durante 2 días. Cada pocillo se lavó con 100 µl de un medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 µM). El medio de cultivo se reemplazó por 50 µl de medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, ascorbato sódico al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 µM) que tenía disueltos 3 µM de un compuesto de ensayo. Después de dejar incubando a 37°C, en condiciones de dióxido de carbono al 5% durante 20 minutos, el medio de cultivo se reemplazó por 100 µl de medio de cultivo estimulante con forskolina (medio de cultivo IMDM, ascorbato de sodio al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 µM, forskolina 10 µM, 3-isobutil-1-metilxantina 500 µM) que tenía disueltos 3 µM del compuesto de ensayo y se dejó incubando a 37°C, condiciones de dióxido de carbono al 5% durante 10 minutos. Después de retirar el medio de cultivo, se dispensaron 200 µl de solución acuosa Lysis 1B (Amersham Bioscience, reactivo vinculado a un sistema de inmunoanálisis enzimático para AMP cíclico Biotrack) y se sacudieron durante 10 minutos. La solución acuosa de cada pocillo se utilizó como muestra para la medición. Las muestras para la medición por cuadruplicado diluidas se sometieron a medición de la cantidad de AMP cíclico utilizando el sistema de inmunoanálisis enzimático anteriormente descrito. La razón de inhibición del compuesto de ensayo respectivo se calculó suponiendo que la cantidad de AMP cíclico del pocillo al que no se había añadido compuesto de ensayo fue el 100%. En este sistema de ensayo empírico, la dopamina que se utilizó como fármaco de control suprimió la cantidad de AMP cíclico a aproximadamente 10% de la actividad máxima.

Se confirmó que los compuestos de ensayo tenían actividad agonística parcial para el receptor D_2 de dopamina en el ensayo anteriormente descrito.

Puesto que los compuestos de ensayo tienen actividad agonística parcial para el receptor de dopamina D_2 , estos pueden estabilizar la neurotransmisión de dopamina a unas condiciones normales en un paciente de esquizofrenia y como resultado, muestran, por ejemplo, un efecto mejorador de las condiciones positivas y negativas, un efecto mejorador del deterioro cognitivo y otros efectos mejoradores de los síntomas sin causar efectos secundarios.

Ensayo Farmacológico 3

Efecto inhibidor sobre el comportamiento estereotipado inducido por apomorfina en ratas

Como animales de ensayo se utilizaron ratas Wistar (macho, seis-siete semanas de edad, Japan SLC, Inc.). Se suspendió un compuesto de ensayo en goma arábiga al 5%/(solución salina fisiológica o agua) utilizando un mortero de ágata y se diluyó con el mismo disolvente cuando fue necesario.

Los animales de ensayo se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior. Se administró subcutáneamente apomorfina (0,7 mg/kg) (1 ml/kg) 1 hora después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). El comportamiento estereotipado se observó durante 1 minuto respectivamente 20, 30 y 40

minutos después de la inyección de apomorfina.

El comportamiento estereotipado de cada animal se cuantificó de acuerdo con las siguientes condiciones y las puntuaciones realizadas en tres momentos se sumaron y se evaluó el efecto anti-apomorfina. Para cada grupo se utilizaron seis animales de ensayo.

0: La apariencia de los animales es la misma que la de las ratas tratadas con solución salina;

1: Olisqueo discontinuo, actividad exploratoria constante;

2: Olisqueo continuo, actividad exploratoria periódica;

3: Olisqueo continuo, mosdisqueo, roedura o lameteo discontinuos. Períodos muy breves de actividad locomotora;

4: Mosdisqueo, roedura o lameteo continuos; sin actividad exploratoria.

Se utilizó un sistema de análisis estadístico no clínico para todo el tratamiento estadístico. Cuando el valor de la probabilidad de significación fue inferior a 0,05, se consideró que existía una diferencia significativa. La diferencia de la puntuación entre el grupo de administración de disolvente y cada grupo de administración de compuesto de ensayo se analizó utilizando la prueba de la suma de rangos de Wilcoxon o la prueba de Steel. Además, se utilizó un análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz del 50% (intervalo de confianza de 95%).

Puesto que los compuestos de ensayo mostraron un efecto inhibitor del comportamiento estereotipado inducido por apomorfina, se confirmó que los compuestos de ensayo tienen un efecto antagónico del receptor D₂.

Ensayo Farmacológico 4

Efecto inhibitor de contracciones en la cabeza inducidas por (±)D-2,5-dimetoxi-4-yodoanfetamina (DOI) en ratas

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

Los animales de ensayo se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior. Se administró subcutáneamente DOI (5,0 mg/kg) (1 ml/kg) 1 hora después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). Se contó el número de contracciones en la cabeza durante 10 minutos inmediatamente después de la inyección de DOI. Se utilizaron seis animales de ensayo para cada grupo.

Se utilizó un sistema de análisis estadístico no clínico para todo el tratamiento estadístico. Cuando el valor de la probabilidad de significación fue inferior a 0,05, se consideró que existía una diferencia significativa. La diferencia del número de contracciones de la cabeza entre el grupo de administración de disolvente y cada grupo de administración de compuesto de ensayo se analizó utilizando la prueba de la t o la prueba de Dunnett. Además, se utilizó un análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz del 50% (intervalo de confianza de 95%).

Puesto que los compuestos de ensayo mostraron un efecto inhibitor de las contracciones de la cabeza inducidas por DOI, se confirmó que los compuestos de ensayo tenían un efecto antagónico del receptor 5HT_{2A} de serotonina.

Ensayo Farmacológico 5

Efecto inductor de catalepsia en ratas

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

Los animales se mantuvieron en ayunas durante la noche desde el día anterior a la observación de la catalepsia y se realizó la ptosis 1, 2, 4, 6 y 8 horas después de administrar oralmente cada compuesto de ensayo (5 ml/kg). Para cada grupo se utilizaron seis animales de ensayo.

Una pata trasera de una rata se colocó en un borde de una pequeña caja de acero (anchura: 6,5 cm, profundidad: 4,0 cm, altura: 7,2 cm) (una postura no natural) y cuando la rata mantuvo la postura durante más de 30 segundos, se consideró que el caso era positivo para la catalepsia. Esta observación se realizó tres veces en cada momento, y si hubo al menos un caso positivo, se consideró que se producía catalepsia en el individuo.

Como resultado, el efecto de inducción de catalepsia de un compuesto de ensayo se disoció del efecto inhibitor sobre el comportamiento estereotipado inducido por apomorfina, por lo tanto se sugirió que la percepción del efecto secundario extrapiramidal en pruebas clínicas sería baja.

Ensayo Farmacológico 6**Medición de la actividad inhibidora de la absorción de serotonina (5-HT) de un compuesto de ensayo por el sinaptosoma cerebral en ratas**

Se decapitaron ratas Wistar macho, se retiró el cerebro y se extirpó el córtex frontal, y se homogeneizó en una solución de sacarosa 0,32 M de un peso de 20 veces el peso del tejido utilizando un homogeneizador de tipo Potter. El producto homogeneizado se centrifugó a 4°C, 1.000 × g durante 10 minutos, el sobrenadante obtenido se centrifugó adicionalmente a 4°C, 20.000 × g durante 20 minutos, y el sedimento se suspendió en un tampón de incubación (tampón Hepes 20 mM (pH 7,4) que contenía glucosa 10 mM, cloruro de sodio 145 mM, cloruro potasio 4,5 mM, cloruro de magnesio 1,2 mM, cloruro de calcio 1,5 mM), que se utilizó como fracción de sinaptosoma bruta.

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

A cada pocillo se añadieron tampón de incubación (recuento total), 5-HT no marcada (concentración final 10 µM, recuento no específico) y el compuesto de ensayo diluido (concentración final 300 nM). Se añadió una décima parte de la cantidad de volumen final de la fracción de sinaptosoma y después de preincubar a 37°C durante 10 minutos, se añadió una solución de 5-HT marcada con tritio (concentración final 8 nM) y la reacción de absorción comenzó a 37°C. El tiempo de absorción fue de 10 minutos y la reacción se terminó mediante filtración a vacío a través de una placa de papel de filtro de fibra de vidrio de 96 pocillos, y después de lavar el papel de filtro con solución salina normal fría, se secó lo suficiente y se añadió al filtro Microscint0 (Perkin-Elmer) y se midió la radiactividad que quedaba en el filtro.

La actividad inhibidora de la absorción de serotonina (%) se calculó a partir de la radiactividad del recuento total como el 100%, del recuento no específico como 0%, y del recuento obtenido con el compuesto de ensayo.

$$\% \text{ de inhibición de 5-HT (\%)} = 100 - \left[\frac{\text{Recuento obtenido con el compuesto de ensayo} - \text{Recuento no específico (Absorción 0\%)}}{\text{Recuento total (Absorción 100\%) - Recuento no específico (Absorción 0\%)}} \right] \times 100$$

Los resultados se muestran en la siguiente Tabla 167.

[Tabla 167]

Compuesto de ensayo	Razón de inhibición de la absorción de serotonina (%) (300 nM)
Compuesto del Ejemplo 105	69,9
Compuesto del Ejemplo 123	67,2
Compuesto del Ejemplo 109	38,5
Compuesto del Ejemplo 112	59,3

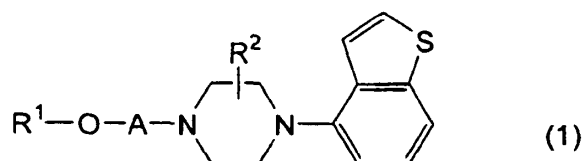
Ejemplos de Preparación

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

El comprimido obtenido se revistió con una película utilizando un agente de revestimiento pelicular elaborado con 10 g de TC-5 (nombre de fábrica, producto de Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., hidroxipropilmetilcelulosa), 3 g de polietilenglicol 6000, 40 g de aceite de ricino y una cantidad apropiada de etanol para producir un comprimido con revestimiento pelicular de la composición anterior.

REIVINDICACIONES

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



donde R^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_1-C_6 ;

A representa un grupo alquileo C_1-C_6 o un grupo alquenileo C_2-C_6 ; y

R^1 representa un grupo heterocíclico seleccionado entre un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre;

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

(1) un grupo alquilo C_1-C_6 ,

(2) un grupo alquenilo C_2-C_6 ,

(3) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(4) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,

(5) un grupo ariloxi,

(6) un grupo alquil(C_1-C_6)tio,

(7) un grupo alcoxi C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(8) un grupo hidroxilo,

(9) un grupo hidroxilo protegido,

(10) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ,

(11) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 protegido,

(12) un átomo de halógeno,

(13) un grupo ciano,

(14) un grupo arilo,

(15) un grupo nitro,

(16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alquil(C_1-C_6)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C_1-C_6)carbamoilo, un grupo aminoalcanilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanilo C_1-C_6 y un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilaminoalcanilo C_1-C_6 como sustituyentes,

(18) un grupo alcanilo C_1-C_6 ,

(19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 en el grupo arilo,

(20) un grupo carboxilo,

(21) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo,

(22) un grupo carboxialquilo C_1-C_6 ,

(23) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquilo C_1-C_6 ,

(24) un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanilo C_1-C_6 ,

(25) un grupo carboxialquenilo C_2-C_6 ,

(26) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquenilo C_2-C_6 ,

(27) un grupo carbamoilalquenilo C_2-C_6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 y un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno como sustituyente,

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

(i) un grupo alquilo C_1-C_6 ,

(ii) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,

(iii) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ,

(iv) un grupo alcoxi(C_1-C_6)alquilo C_1-C_6 ,

(v) un grupo ariloxialquilo C_1-C_6 ,

(vi) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno,

(vii) un grupo aminoalquilo C_1-C_6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo aroilo y un grupo carbamoilo,

(viii) un grupo cicloalquilo C_3-C_8 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo y un grupo fenilalcoxi C_1-C_6 como sustituyente,

(ix) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con cicloalquilo C_3-C_8 ,

- (x) un grupo alqueno C_2-C_6 ,
 (xi) un grupo carbamoilalquilo C_1-C_6 que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo fenilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 y uno o varios grupos fenilo que pueden tener uno o varios grupos alcoxi C_1-C_6 como sustituyente,
 5 (xii) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquilo C_1-C_6 ,
 (xiii) un grupo furilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo furilo).
 (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C_1-C_6 ,
 10 (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C_1-C_6 ,
 (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo C_1-C_6 ,
 (xvii) un grupo pirrolilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo pirrolilo),
 (xviii) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 15 (xix) un grupo pirazolilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo pirazolilo),
 (xx) un grupo imidazolilalquilo C_1-C_6 ,
 (xxi) un grupo piridilalquilo C_1-C_6 ,
 20 (xxii) un grupo pirazinilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo pirazinilo),
 (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en uno o varios grupos oxo y un grupo alquilo C_1-C_6 como sustituyente en el grupo pirrolidinilo),
 25 (xxiv) un grupo piperidilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo piperidilo),
 (xxv) un grupo piperazinilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo piperazinilo),
 (xxvi) un grupo morfolinilalquilo C_1-C_6 ,
 30 (xxvii) un grupo tienilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 como sustituyentes en el grupo tienilo), grupo tienilo),
 (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C_1-C_6 ,
 (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C_1-C_6 ,
 35 (xxx) un grupo benzopiranilalquilo C_1-C_6 (que puede tener uno o varios grupos oxo como sustituyentes en el grupo benzopiranilo),
 (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo C_1-C_6 ,
 (xxxii) un grupo indolilalquilo C_1-C_6 que puede tener uno o varios grupos alcoxi(C_1-C_6)carbonilo en el grupo alquilo C_1-C_6 ,
 40 (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C_1-C_6 que tiene uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo en el grupo alquilo C_1-C_6 ,
 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 y un grupo alquil(C_1-C_6)tioalquilo C_1-C_6 como sustituyente,
 45 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alcanilo C_1-C_6 y un grupo aroilo como sustituyentes,
 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alcanilo C_1-C_6 y un grupo aroilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 y un átomo de halógeno como sustituyente,
 50 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo arilo y un grupo furilo como sustituyentes,
 55 (xl) un grupo tiazolilo,
 (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 ,
 (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 ,
 (xliii) un grupo indazolilo,
 60 (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 C_1-C_6 , un grupo alcoxi C_1-C_6 , un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyentes,
 (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C_1-C_6 ,

- (xlvi) un grupo benzodioxolilalquilo C₁-C₆,
 (xlvii) un grupo arilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alqueno C₂-C₆; un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(C₁-C₆)tio; un grupo alcanoilo C₁-C₆; un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquino C₂-C₆; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo arilo; un grupo arilalcoxi C₁-C₆; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo tiazolidinilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo C₁-C₆ y un grupo piperidinilcarbonilo,
 (i) un grupo cianoalquilo C₁-C₆,
 (ii) un grupo dihidroquinolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo oxo,
 (iii) un grupo alquil(C₁-C₆)amino sustituido con halógeno,
 (iiii) un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆,
 (lv) un grupo amidino que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 (lvi) un grupo amidinoalquilo C₁-C₆,
 (lvii) un grupo alqueno(C₁-C₆)oxialquilo C₁-C₆,
 (lviii) un grupo arilamino que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, en el grupo arilo,
 (lix) un grupo piridilamino que puede tener uno o varios grupos C₁-C₆,
 (lx) un grupo arilalquilo C₁-C₆ (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo C₁-C₆ uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo como sustituyente),
 (lxi) un grupo alquino C₂-C₆,
 (lxii) un grupo ariloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener como sustituyente en el grupo arilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo),
 (lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
 (lxv) un grupo arilalcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
 (lxvii) un grupo azetidino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo aroilo
 (lxviii) un grupo azetidinalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo aroilo,
 (lix) y un grupo tetrazolilo,
 (lxx) y un grupo indolinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
 (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener uno o varios grupos carbamoilo,
 (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 (lxxv) un grupo benzimidazolilo,
 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o varios grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, y
 (lxxviii) un grupo oxazolilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆
- (29) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo arilo, un grupo arilalquilo C₁-C₆, un grupo aroilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
 (30) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,

- (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 (32) un grupo sulfamoilo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆,
 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o varios grupos oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 (39) un grupo piperidilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanilo C₁-C₆,
 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo carboxialquilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilalquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo carboxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo C₁-C₆), un grupo 1,4-dioxo-8-azaspiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,9-diazepinilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos alquilo C₁-C₆) un grupo piridilo, un grupo piridiloxilo, un grupo piridilalcoxi C₁-C₆, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo arilalcoxi C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno en el grupo aroilo), un grupo aroilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo hidroxilo), un grupo ariloxilo (que puede tener en el grupo aroilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), un grupo arilalquilo C₁-C₆ (que puede tener en el grupo aroilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo aroilo uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆),
 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un grupo como sustituyente, seleccionado del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo aroilo), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆, un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino), un grupo ariloxilo (que puede tener uno o varios grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo aroilo), un grupo ariloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo aroilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos oxo),
 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos como sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyentes 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 un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo ciano y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno como sustituyentes), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo aroilo (en el que pueden estar presentes uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C₁-C₆), un grupo aroilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo arilalcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo oxo,
 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo piridilo,

- (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆,
 (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ y un grupo arilo,
 (48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos arilo que pueden tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo ciano,
 (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos ariloxi sustituidos con halógeno o insustituidos,
 (51) un grupo indolinilcarbonilo,
 (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
 (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,
 (56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C₁-C₆,
 (57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,
 (58) un grupo oxo,
 (59) un grupo aminoalcoxi C₁-C₆ (que puede tener uno o varios grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo amino),
 (60) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi C₁-C₆,
 (61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (62) un grupo morfolinilo,
 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-carbonilo que puede tener uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,
 (64) un grupo tetrahidropiranilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos piridilo,
 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o varios grupos tioxi, y
 (66) un grupo 1,4-dioxo-8-azaespiro[4,5]decanilo.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado entre un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene 1 o 2 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 un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo piranilo, y un grupo tienilo; donde, en el grupo heterocíclico representado por R¹, de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (1) a (66) de más abajo pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes:

- (1) un grupo alquilo C₁-C₆,
 (2) un grupo alqueno C₂-C₆,
 (3) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 (4) un grupo alcoxi C₁-C₆,
 (5) un grupo fenoxi,
 (6) un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
 (7) un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 (8) un grupo hidroxilo,
 (9) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆,
 (10) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
 (11) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
 (12) un átomo de halógeno,
 (13) un grupo ciano,
 (14) un grupo fenilo,
 (15) un grupo nitro,
 (16) un grupo amino,
 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilo, un grupo aminoalcanoilo C₁-C₆, un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalcanoilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes,
 (18) un grupo alcanilo C₁-C₆,
 (19) a fenilsulfonilo grupo que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ en el grupo fenilo,
 (20) un grupo carboxi,
 (21) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
 (22) un grupo carboxialquilo C₁-C₆,

(23) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquilo C₁-C₆,
 (24) un grupo alcanilo(C₁-C₆)aminoalcanilo C₁-C₆,
 (25) un grupo carboxialqueno C₁-C₆,
 (26) un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilalqueno C₁-C₆,
 (27) un grupo carbamoilalqueno C₁-C₆ 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 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyente o sustituyentes,
 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:

- (i) un grupo alquilo C₁-C₆,
- (ii) un grupo alcoxi C₁-C₆,
- (iii) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆,
- (iv) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
- (v) un grupo fenoxialquilo C₁-C₆,
- (vi) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
- (vii) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanilo C₁-C₆, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo,
- (viii) un grupo cicloalquilo C₃-C₈ que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes,
- (ix) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con cicloalquilo C₃-C₈,
- (x) un grupo alqueno C₂-C₆,
- (xi) un grupo alquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que pueden tener de 1 a 2 grupos como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo que puede tener un solo grupo alcoxi C₁-C₆,
- (xii) un grupo alquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,
- (xiii) un grupo furilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo furilo),
- (xiv) un grupo tetrahidrofurilalquilo C₁-C₆,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanilalquilo C₁-C₆,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranilalquilo C₁-C₆,
- (xvii) un grupo pirrolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo pirrolilo como sustituyente o sustituyentes),
- (xviii) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xix) un grupo pirazolilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆,
- (xxi) un grupo piridilalquilo C₁-C₆,
- (xxii) un grupo pirazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirazinilo),
- (xxiii) un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo),
- (xxv) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,
- (xxvii) un grupo tienilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolilalquilo C₁-C₆,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofurilalquilo C₁-C₆,
- (xxx) un grupo benzopiranilalquilo C₁-C₆ (que puede tener un solo grupo oxo como sustituyente en el grupo benzopiranilo),
- (xxxi) un grupo benzimidazolilalquilo C₁-C₆,
- (xxxii) un grupo indolilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo en el grupo alquilo C₁-C₆,
- (xxxiii) un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, en el grupo alquilo C₁-C₆,
- (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un

- grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un átomo de halógeno como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un átomo de halógeno como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo fenilo y un grupo furilo como sustituyente o sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) tiadiazolilo grupo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un átomo de halógeno y un grupo oxo como sustituyente o sustituyentes,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (xlviii) un grupo benzodioxolilalquilo C₁-C₆,
- (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que pueden tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₆; un grupo alcoxi C₁-C₆; un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno; un grupo alquenilo C₂-C₆; un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)sulfonilo, un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquil(C₁-C₆)tio; un grupo alcanoilo C₁-C₆; un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo C₂-C₆; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo fenilo; un grupo fenilalcoxi C₁-C₆; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxialquilo C₁-C₆; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆; un grupo dihidrofurilo que puede tener un solo grupo oxo; un grupo tiazolidinilo C₁-C₆ que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolilalcanoilo C₁-C₆ y un grupo piperidinilcarbonilo,
- (l) un grupo cianoalquilo C₁-C₆,
- (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo oxo,
- (lii) un grupo alquil(C₁-C₆)amino sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquil(C₁-C₆)tioalquilo C₁-C₆,
- (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo C₁-C₆,
- (lv) un grupo amidinoalquilo C₁-C₆,
- (lvi) un grupo alquenil(C₂-C₆)oxialquilo C₁-C₆,
- (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno en el grupo fenilo,
- (lviii) un grupo fenilalquenilo 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 o sustituyentes en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo C₁-C₆ de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo),
- (lxi) un grupo alquinilo C₂-C₆,
- (lxii) un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo N-alcoxi(C₁-C₆)-N-alquil(C₁-C₆)carbamoilo y un grupo oxopirrolidinilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo fenilo),
- (lxiii) un grupo isoxazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenilalcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,

- (Ixxvii) un grupo azetidínilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo,
 (Ixxviii) un grupo azetidínalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo,
 5 (Ixxix) y un grupo tetrazolilo,
 (Ixx) y un grupo indolinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (Ixxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquil(C₁-C₆)tio,
 (Ixxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoilo,
 10 (Ixxiii) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
 (Ixxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
 (Ixxv) un grupo benzimidazolilo,
 (Ixxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (Ixxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, y
 15 (Ixxviii) un grupo oxazolilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,
- (29) un grupo aminoalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo C₁-C₆, un grupo benzoilo y un grupo alquilo sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino), en el grupo amino,
 20 (30) un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno,
 25 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆,
 (32) un grupo sulfamoilo,
 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C₁-C₆,
 30 (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
 (36) un grupo imidazolilo,
 (37) un grupo triazolilo,
 (38) un grupo isoxazolilo,
 35 (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo alcanoil(C₁-C₆)aminoalcanoilo C₁-C₆,
 40 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo carboxialquilo C₁-C₆, un grupo alquil(C₁-C₆)carbamoilalquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo carboxi, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo amino (en el que pueden estar presentes 1 ó 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆), un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente como sustituyente un solo grupo alquilo C₁-C₆), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridilalcoxi C₁-C₆, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un solo grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alcoxi C₁-C₆ sustituido con halógeno), un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo hidroxilo), un grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), un grupo fenilalquilo C₁-C₆ (en el grupo fenilo, pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno), y un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C₁-C₆ en el grupo fenilo),
 50 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo

C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo benzoilo en el grupo amino), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆, un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ (que puede tener un solo grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ que pueden estar presentes como sustituyentes en el grupo amino), un grupo feniloxi (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxialquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi C₁-C₆ sustituidos con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),

(42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como sustituyente o sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo cicloalquilo C₃-C₈, un grupo alcanoilo C₁-C₆, un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo C₁-C₆, un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, un grupo aminoalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilalquilo C₁-C₆, un grupo 1,3-dioxoranilalquilo C₁-C₆, un grupo tetrahydrofuralalquilo C₁-C₆, un grupo piridilo C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como sustituyente o sustituyentes en el grupo alquilo C₁-C₆), un grupo imidazolilalquilo C₁-C₆, un grupo furilalquilo C₁-C₆, un grupo pirrolidinilcarbonilo C₁-C₆, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ como sustituyente o sustituyentes), un grupo piridilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo ciano y un grupo alquilo C₁-C₆ sustituido con halógeno como sustituyente o sustituyentes en el grupo piridilo), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes como sustituyentes de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C₁-C₆), un grupo benzoilo, un grupo furilcarbonilo, un grupo fenilalcoxi(C₁-C₆)carbonilo y un grupo oxo,

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

(44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyente seleccionado del grupo que consiste en un grupo C₁-C₆ y un grupo piridilo,

(45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆,

(46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,

(47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo piperidilalquilo C₁-C₆ y un grupo fenilo,

(48) un grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que pueden tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alcoxi C₁-C₆ y un grupo ciano,

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

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

(51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,

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

(54) un grupo morfolinilalquilo C₁-C₆,

(55) un grupo piperazinilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,

(56) un grupo morfolinilcarbonilalquilo C₁-C₆,

(57) un grupo piperazinilcarbonilalquilo C₁-C₆ que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo piperazinilo,

(58) un grupo oxo,

(59) un grupo aminoalcoxi C₁-C₆ (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C₁-C₆ en el grupo amino),

(60) un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi C₁-C₆,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo alcanoilo C₁-C₆ y un grupo alcoxi(C₁-C₆)carbonilo,

(62) un grupo morfolinilo,

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

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

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

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

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde A es un grupo alquileo C₁-C₆.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado entre un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene 1 o 2 átomos de nitrógeno seleccionado del grupo que consiste en un grupo pirrolidino, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidino y un grupo tiazolilo, y en el grupo heterocíclico representado por R¹, de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1) a (66) definidos en la reivindicación 2 pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde R¹ representa un grupo heterocíclico seleccionado entre

un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene 1 o 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo y un grupo tiazolilo, y en el grupo heterocíclico representado por R^1 , de 1 a 5 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) mostrados más abajo pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes:

- (1) un grupo alquilo C_1-C_6 ,
- (4) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,
- (10) un grupo hidroxialquilo C_1-C_6 ,
- (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alquil(C_1-C_6)sulfonilo, un grupo carbamoilo, un grupo alquil(C_1-C_6)carbamoilo, un grupo aminoalcanoilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanoilo C_1-C_6 y un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilaminoalcanoilo C_1-C_6 , como sustituyente o sustituyentes,
- (18) un grupo alcanilo C_1-C_6 ,
- (21) un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo,
- (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) de más abajo como sustituyente o sustituyentes:

- (i) un grupo alquilo C_1-C_6 ,
- (ii) un grupo alcoxi C_1-C_6 ,
- (iv) un grupo alcoxi(C_1-C_6)alquilo C_1-C_6 ,
- (xii) un grupo alquilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi(C_1-C_6)carbonilo,
- (xxi) un grupo piridilalquilo C_1-C_6 ,

- (29) un grupo aminoalquilo C_1-C_6 que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo fenilo, un grupo fenilalquilo C_1-C_6 , un grupo benzoilo y un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con amino (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C_1-C_6 que pueden estar presente como sustituyente o sustituyentes en el grupo amino),
- (30) un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con un solo grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 y un grupo alquilo C_1-C_6 sustituido con halógeno, (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 C_1-C_6 ,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un solo grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo alquil(C_1-C_6)fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 , un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo y un grupo alcanilo(C_1-C_6)aminoalcanoilo C_1-C_6 ,
- (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo alcanilo C_1-C_6 y un grupo alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, y
- (62) un grupo morfolinilo.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, donde R^1 representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene 1 o 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo y un grupo tiazolilo, y en el grupo heterocíclico representado por R^1 , de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) definidos en la reivindicación 5 pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, donde R^1 representa un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene 1 o 2 átomos de nitrógeno seleccionado entre un grupo piperidilo, un grupo pirazolilo y un grupo tiazolilo, y en el grupo heterocíclico representado por R^1 , de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste en los apartados (1), (17) y (28) mostrados más abajo pueden estar presentes como sustituyente o sustituyentes.

- (1) un grupo alquilo C_1-C_6 ,
- (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados del grupo que consiste en un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo aminoalcanoilo C_1-C_6 como sustituyente o sustituyentes,
- (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C_1-C_6 ,

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, donde R^1 representa

un grupo pirazolilo que tiene un solo grupo alquilo C₁-C₆ y un solo grupo alcanoil(C₁-C₆)amino
 un grupo pirazolilo que tiene un solo grupo alquilo C₁-C₆ inferior y un solo grupo N,N-dialquil(C₁-C₆)amino;
 un grupo piperidilo que tiene un solo grupo N,N-dialquil(C₁-C₆)carbamoilo; o
 un grupo tiazolilo que tiene un solo grupo N,N-dialquil(C₁-C₆)carbamoilo.

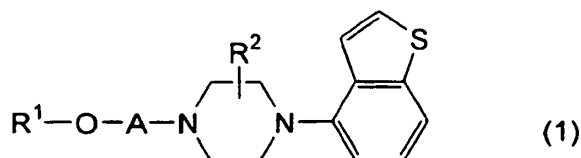
9. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, como ingrediente activo y un portador farmacéuticamente aceptable.

10. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 para su uso como fármaco.

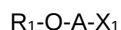
11. Un compuesto heterocíclico de fórmula (1) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 para su uso en el tratamiento o la prevención de un trastorno del sistema nervioso central.

12. El compuesto para su uso de acuerdo con la reivindicación 8, donde el trastorno del sistema nervioso central se selecciona del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; trastornos emocionales; trastornos psicóticos; trastornos del estado de ánimo; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión mayor; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo-compulsivo; trastorno por estrés post-traumático; trastorno de ansiedad generalizado; trastorno de estrés agudo; histeria; trastorno de somatización; trastorno de conversión; trastorno por dolor; hipocondriasis; trastorno facticio; trastorno disociativo; disfunción sexual; trastorno del deseo sexual; trastorno de la excitación sexual; disfunción eréctil; anorexia nerviosa; bulimia nerviosa; trastorno del sueño; trastorno de adaptación; abuso de alcohol; intoxicación alcohólica; adicción a fármacos; intoxicación con estimulantes; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogénica; anhedonia de causa psíquica o mental; anhedonia asociada a depresión; anhedonia asociada a esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado a la enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de la esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómito; mareo por movimiento; obesidad; migraña; dolor; retraso mental; trastorno de autismo (autismo); síndrome de Tourette; trastornos de tics; trastorno por déficit de atención con hiperactividad; trastorno de la conducta; y síndrome de Down.

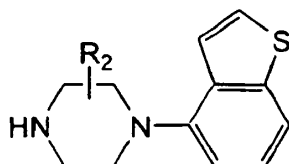
13. Un procedimiento para producir un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



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



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



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