

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 383 949**

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: **10188683 .6**
96 Fecha de presentación: **31.08.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **2287162**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **23.02.2011**

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

30 Prioridad:
31.08.2005 JP 2005251055

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
27.06.2012

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

73 Titular/es:
Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.
2-9 Kanda-Tsukasa-machi Chiyoda-ku
Tokyo 101-8535, JP

72 Inventor/es:
Yamashita, Hiroshi;
Kuroda, Hideaki;
Takahashi, Haruka y
Fukushima, Tae

74 Agente/Representante:
Ungría López, Javier

ES 2 383 949 T3

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

DESCRIPCIÓN

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

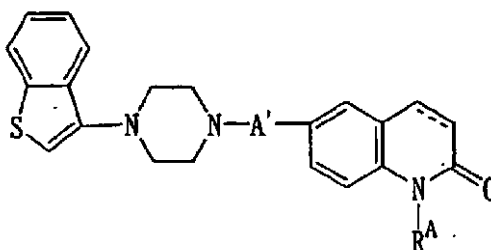
Campo técnico

La presente invención se refiere a un nuevo compuesto heterocíclico.

5 Técnica anterior

Dado que el factor causal de la esquizofrenia, así como del trastorno bipolar, trastornos anímicos y trastornos emocionales, es heterogéneo, es deseable que un fármaco tenga efectos farmacológicos múltiples para desarrollar un amplio espectro de tratamiento.

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

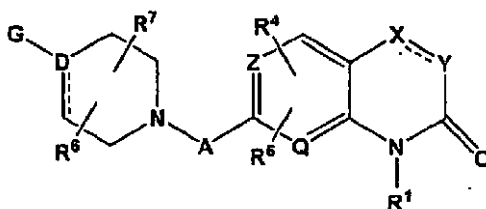


10

(en la que A' representa $(\text{CH}_2)_m\text{CH}_2-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$, etc.; m representa un número entero de 1 a 4; y R^A representa un átomo de hidrógeno, un grupo C_{1-4} alquilo que puede sustituirse con 1 a 3 átomos de flúor, etc.) tiene actividad antagonista para el receptor D_2 y actividad antagonista para el receptor de serotonina 2A ($5\text{-HT}_{2\text{A}}$) y es eficaz para el tratamiento de la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central).

15 Sin embargo, en el documento WO2004/026864A1, no existe ninguna descripción de que los derivados de carbostirilo descritos en el documento tengan conjuntamente actividad agonista parcial del receptor D_2 , actividad antagonista del receptor $5\text{-HT}_{2\text{A}}$, actividad antagonista del receptor α_1 y actividad inhibidora de la captación de serotonina y tienen un amplio espectro de tratamiento.

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



20

(en la que A es $-(\text{CH}_2)_m\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$ o similar; m es un número entero de 2 a 5; D es N, C o similar; Z y Q son independientemente N, C o CH, siempre que al menos uno de Z y Q sea N; X e Y son independientemente C, N o similar, y el enlace entre X e Y es un enlace simple o doble; R^1 es hidrógeno, grupo alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_3$) o similar; cada R^4 , R^5 , R^6 y R^7 representa hidrógeno, grupo alquilo o similar y G representa un grupo de compuestos monocíclicos o bicíclicos), que se unen a receptores de dopamina D_2 . El documento WO 2005/019215 A1 instruye sobre que algunos compuestos desvelados en su interior poseen una actividad como agonistas parciales de receptores D_2 o una actividad como antagonistas de receptores D_2 , y que pueden ser eficaces para el tratamiento de la esquizofrenia y de otras enfermedades del sistema nervioso central.

25

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

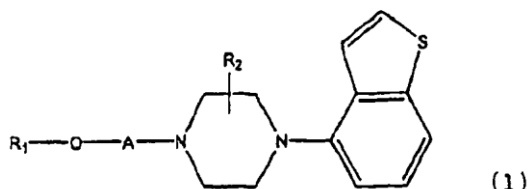
Descripción de la invención

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

35 Los autores de la presente invención han realizado estudios intensivos sobre el problema descrito anteriormente y por consiguiente han tenido éxito sintetizando un compuesto novedoso que tiene actividad agonista parcial del receptor de dopamina D_2 (actividad agonista parcial del receptor D_2), actividad antagonista del receptor de

serotonina 5-HT_{2A} (actividad antagonista del receptor 5-HT_{2A}) y actividad antagonista del receptor de adrenalina α_1 (actividad antagonista del receptor α_1) y adicionalmente, junto con la adición de estos efectos, tiene un efecto inhibitor de la captación de serotonina (o un efecto inhibitor de la recaptación de serotonina). La presente invención se ha completado basándose en este hallazgo.

5 Se proporciona un compuesto heterocíclico o una sal del mismo representada por la fórmula (1):



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

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

R¹ representa un grupo cicloalquilo C3-C8;

10 en la que al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en los grupos (1) a (66) que se muestran a continuación puede estar presente como un sustituyente en el grupo cicloalquilo C3-C8 representado por R¹:

- (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alquenilo inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,

- 15 (4) un grupo alcoxi inferior,
- (5) un grupo ariloxi,
- (6) un grupo alquiltio inferior,
- (7) un grupo alcoxi inferior sustituido halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,

- 20 (9) un grupo protegido con hidroxilo,
- (10) un grupo hidroxilo alquilo inferior,
- (11) un grupo alquilo inferior protegido con hidroxilo,
- (12) un átomo de halógeno,

- (13) un grupo ciano,
- 25 (14) un grupo arilo,
- (15) un grupo nitro,
- (16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcocarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo carbamoilo inferior, un grupo amino alcanoilo inferior, un grupo alcanoilamino inferior-alcanoilo inferior y un grupo alcoxi carbonilamino inferior-alcanoilo inferior como un sustituyente,

- (18) un grupo alcanoilo inferior,
- (19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior en el grupo arilo,
- 35 (20) un grupo carboxi,
- (21) un grupo alcocarbonilo inferior,

- (22) un grupo carboxi alquilo inferior,
- (23) un grupo alcoxicarbonil inferior-alquilo inferior,
- (24) un grupo alcanoilamino inferior-alcanoílo inferior,
- (25) un grupo carboxi alquenilo inferior,
- 5 (26) un grupo alcoxicarbonil inferior-alquenilo inferior,
- (27) un grupo carbamoil alquenilo inferior que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como un sustituyente,
- 10 (28) un grupo carbamoílo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) que se muestran a continuación como un sustituyente:
- (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcoxi inferior,
- (iii) un grupo hidroxil alquilo inferior,
- (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- 15 (v) un grupo ariloxil alquilo inferior,
- (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (vii) un grupo amino alquilo inferior que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoil inferior, un grupo aroílo y un grupo carbamoílo,
- 20 (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxil, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo fenil alcoxi inferior como un sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
- (x) un grupo alquenilo inferior,
- 25 (xi) un grupo carbamoil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior y uno o más grupos fenilo que pueden tener uno o más grupos alcoxi inferior como un sustituyente,
- (xii) un grupo alcoxicarbonil inferior-alquilo inferior,
- 30 (xiii) un grupo furil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente) en el grupo furilo,
- (xiv) un grupo tetrahidrofuril alquilo inferior,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranil alquilo inferior,
- 35 (xvii) un grupo pirrolil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (xix) un grupo pirazolil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo pirazolilo),
- 40 (xx) un grupo imidazolil alquilo inferior,
- (xxi) un grupo piridil alquilo inferior,
- (xxii) un grupo pirazinil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo pirazinilo),

- (xxiii) un grupo pirrolidinil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en uno o más grupos oxo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el grupo pirrolidinilo),
- 5 (xxiv) un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanóilo inferior como un sustituyente en el grupo piperidilo),
- (xxv) un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinil alquilo inferior,
- 10 (xxvii) un grupo tienil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolil alquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofuril alquilo inferior,
- 15 (xxx) un grupo benzopiranyl alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos oxo como un sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- (xxxi) un grupo benzoimidazolil alquilo inferior,
- (xxxii) un grupo indolil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
- 20 (xxxiii) un grupo imidazolil alquilo inferior que tiene uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior,
- (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como un sustituyente,
- 25 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroilo como un sustituyente,
- (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como un sustituyente,
- 30 (xxxvii) un grupo tetrahydrofurilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahydroazepinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo arilo y un grupo furilo como un sustituyente,
- 35 (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- (xliv) un grupo indolilo,
- 40 (xlv) un grupo tetrahydrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahydroquinolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como un sustituyente,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- 45 (xlviii) un grupo benzodioxolil alquilo inferior,

(xlix) un grupo arilo que puede tener uno o más grupos como un sustituyente, seleccionados entre el grupo que consiste en

- 5 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 más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilo sulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcoxycarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo aril alcoxi inferior; un grupo hidroxil; un grupo hidroxil alquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo tiazolidinil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo imidazolil alcanóilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 15 (I) un grupo ciano alquilo inferior,
- (II) un grupo dihidroquinolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- (III) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
- (IIII) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
- 20 (IV) un grupo amidino que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (V) un grupo amidino alquilo inferior,
- (VI) un grupo alqueniloxi inferior-alquilo inferior,
- (VII) un grupo arilamino que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el 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 halógeno, en el grupo arilo,
- 25 (VIII) un grupo aril alqueno inferior,
- (IX) un grupo piridilamino que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (X) un grupo aril alquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior como un sustituyente),
- 30 (XI) un grupo alquinilo inferior,
- (XII) un grupo ariloxi alquilo inferior (que puede tener como un sustituyente en el grupo arilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior; un grupo carbamoilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo),
- 35 (XIII) un grupo isoxazolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (XIV) un grupo dihidroindenilo,
- (XV) un grupo aril alcoxi inferior-alquilo inferior,
- 40 (XVI) un grupo tetrahidropiranilo,
- (XVII) un grupo azetidínilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroilo,
- (XVIII) un grupo azetidínil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroilo,
- 45 (XIX) un grupo tetrazolilo,
- (XX) un grupo indolinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (XXI) un grupo triazolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en

- un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior,
- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener uno o más grupos carbamoilo,
- (lxxiii) un grupo oxazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- 5 (lxxv) un grupo benzoimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o más grupos alcoxicarbonilo inferior, y
- (lxxviii) un grupo oxazolil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos alquilo inferior
- 10 (29) un grupo amino alquilo inferior que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo arilo, un grupo aril alquilo inferior, un grupo aroílo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino) en el grupo amino,
- 15 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el 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 más grupos alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- 20 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- 25 (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo alcanoilamino inferior-alcanóilo inferior,
- 30 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxilo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo carboxi alquilo inferior, un grupo alquil carbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo aroílo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo aroílo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente), 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 más grupos alquilo inferior como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridil alcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo aril alcoxi inferior (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el 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 arilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el 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 más grupos seleccionados entre el 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 aril alquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de
- 35
- 40
- 45
- 50

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 más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi inferior),

- 5 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un grupo como un sustituyente, seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxil, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior, un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo amino alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino), un grupo ariloxi (que puede tener uno o más grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo), un grupo ariloxi alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo arilo) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos oxo),
- 10 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos como un sustituyente, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanoilo inferior, un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino), un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperidilo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior, un grupo tetrahydrofuril alquilo inferior, un grupo piridil alquilo inferior (que puede tener uno o más grupos fenilo como un sustituyente en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolil alquilo inferior, un grupo furil alquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonil alquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior como un sustituyente, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como un sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo, un grupo furil carbonilo, un grupo aril alcoxycarbonilo inferior y un grupo oxo,
- 15 (43) un grupo hexahydroazepinilcarbonilo,
- 20 (44) un grupo hexahydro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo piridilo,
- 25 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o más grupos alquilo inferior,
- (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
- 30 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior y un grupo arilo,
- 35 (48) un grupo tiazolidinil carbonilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,
- (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
- 40 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o más grupos ariloxi sustituido con halógeno o sin sustituir,
- (51) un grupo indolinilcarbonilo,
- (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
- (53) un grupo tetrahydropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
- (54) un grupo morfolinil alquilo inferior,
- 45 (55) un grupo piperazinil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- (56) un grupo morfolinilcarbonil alquilo inferior,
- (57) un grupo piperazinilcarbonil alquilo inferior que puede tener uno o más grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,
- 50 (58) un grupo oxo,

(59) un grupo amino alcoxi inferior (que puede tener uno o más grupos alquilo inferior en el grupo amino),

(60) un grupo alcoxi inferior-alcoxi inferior,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior,

5 (62) un grupo morfolinilo,

(63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,

(64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener uno o más grupos piridilo,

(65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos tioxo, y

10 (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que R¹ representa un grupo ciclo alquilo C5-C6, en la que en el grupo ciclo C5-C6 representado por R¹, pueden estar presentes 1 a 5 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (1) a (66) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:

15 (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,

20 (6) un grupo alquiltio inferior,

(7) un grupo alcoxi inferior sustituido halógeno,

(8) un grupo hidroxilo,

(9) un grupo fenil alcoxi inferior,

(10) un grupo hidroxilo alquilo inferior,

25 (11) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,

(12) un átomo de halógeno,

(13) un grupo ciano,

(14) un grupo fenilo,

(15) un grupo nitro,

30 (16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo carbamoilo inferior, un grupo amino alcanóilo inferior, un grupo alcanoilamino inferior-alcanoílo inferior y un grupo alcoxycarbonilamino inferior-alcanoílo inferior como uno o más sustituyentes,

35

(18) un grupo alcanóilo inferior,

(19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un único grupo alquilo inferior en el grupo fenilo,

(20) un grupo carboxi,

(21) un grupo alcoxycarbonilo inferior,

40 (22) un grupo carboxi alquilo inferior,

(23) un grupo alcoxycarbonil inferior-alquilo inferior,

- (24) un grupo alcanoilamino inferior-alcanoílo inferior,
- (25) un grupo carboxi alquenilo inferior,
- (26) un grupo alcoxicarbonil inferior-alquenilo inferior,
- 5 (27) un grupo carbamoil alquenilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno como uno o más sustituyentes,
- (28) un grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:
- (i) un grupo alquilo inferior,
- 10 (ii) un grupo alcoxi inferior,
- (iii) un grupo hidroxil alquilo inferior,
- (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (v) un grupo fenoxil alquilo inferior,
- (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- 15 (vii) un grupo amino alquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoílo inferior, un grupo benzoílo y un grupo carbamoílo,
- (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxil, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo fenil alcoxi inferior como uno o más sustituyentes,
- 20 (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
- (x) un grupo alquenilo inferior,
- (xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoílo que pueden tener de 1 a 2 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un único grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un único grupo alcoxi inferior,
- 25 (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi carbonilo inferior,
- (xiii) un grupo furil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo furilo),
- 30 (xiv) un grupo tetrahidrofuril alquilo inferior,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranil alquilo inferior,
- (xvii) un grupo pirrolil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior en el grupo pirrolilo como uno o más sustituyentes),
- 35 (xviii) un grupo alquilo inferior sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un único grupo oxo,
- (xix) un grupo pirazolil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolil alquilo inferior,
- 40 (xxi) un grupo piridil alquilo inferior,
- (xxii) un grupo pirazinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo pirazinilo),
- (xxiii) un grupo pirrolidinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como uno o más sustituyentes el grupo

- pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo),
- 5 (xxv) un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinil alquilo inferior,
- (xxvii) un grupo tienil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo tienilo),
- 10 (xxviii) un grupo tiazolil alquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofuril alquilo inferior,
- (xxx) un grupo benzopiranyl alquilo inferior (que puede tener un único grupo oxo como un sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- (xxxi) un grupo benzoimidazolil alquilo inferior,
- 15 (xxxii) un grupo indolil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
- (xxxiii) un grupo imidazolil alquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo inferior, en el grupo alquilo inferior,
- 20 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como uno o más sustituyentes,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior,
- 25 un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo como uno o más sustituyentes,
- (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo),
- 30 (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un único grupo oxo
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como uno o más sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- 35 (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,
- (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- 40 (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como uno o más sustituyentes,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (xlviii) un grupo benzodioxolil alquilo inferior,

(xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes, seleccionados entre el grupo que consiste en

- 5 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 entre el grupo que consiste en un grupo alcanoílo inferior, un grupo alquilo sulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanoílo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxi; un grupo fenil alcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxilo alquilo inferior; un grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un único 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 único grupo oxo; un grupo tiazolidinil alquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolil alcanoílo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 10 (l) un grupo ciano alquilo inferior,
- 15 (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- (lii) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
- (liv) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior,
- 20 (lv) un grupo amidino alquilo inferior,
- (lvi) un grupo alqueniloxi inferior-alquilo inferior,
- (lvii) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el 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,
- 25 (lviii) un grupo fenil alquenilo inferior,
- (lix) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (lx) un grupo fenil alquilo inferior (que puede tener como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior de 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 carbamoílo y un grupo alcoxicarbonilo inferior),
- 30 (lxi) un grupo alquinilo inferior,
- (lxii) un grupo feniloxi alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior, un grupo N-alcoxi inferior-N-alquilcarbamoílo inferior y un grupo oxopirrolidinilo como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo),
- 35 (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- (lxv) un grupo fenil alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- 40 (lxvii) un grupo azetidínilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un alcanoílo inferior y un grupo benzoílo,
- (lxviii) un grupo azetidínil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanoílo inferior y un grupo benzoílo,
- (lxix) un grupo tetrazolilo,
- 45 (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior,

- (lxxii) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos 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 benzoimidazolilo,
- 5 (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un único grupo oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupo alcoxicarbonilo inferior, y
- (lxxviii) un grupo oxazolil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior,
- (29) un grupo amino alquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que
 10 consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo
 alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo inferior, un grupo
 benzoílo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más
 sustituyentes en el grupo amino), en el grupo amino,
- (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un único grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos
 15 seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con
 halógeno,
- (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que
 20 consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- 25 (39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en
 un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un
 grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste
 en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo
 alcanóilamino inferior-alcanóilo inferior,
- 30 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que
 consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxilo alquilo inferior, un grupo alcanóilo
 inferior, un grupo carboxi alquilo inferior, un grupo alquilo carbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo
 carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxi, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo amino (en el
 35 que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo
 inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperidilo
 (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo
 alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior y un grupo benzoílo), un grupo piperazinilo (en el que
 pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes), un grupo 1,4-dioxa-8-
 40 azaespiro[4,5]decilo, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente
 un único grupo alquilo inferior como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridil
 alcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un único grupo oxo), un grupo
 benzodioxolilo, un grupo fenil alcoxi inferior (que puede tener en el grupo fenilo 1 a 3 grupos seleccionados
 entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un
 grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno), un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3
 45 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior y un
 grupo hidroxilo), un grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 fenil alquilo inferior (en el grupo fenilo, pueden estar
 50 presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 benzoílo
 (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un

grupo alcoxi inferior en el grupo fenilo),

5 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxil, un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoilo en el grupo amino), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior, un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener un único grupo alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo amino alquilo inferior (que puede tener presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino), un grupo feniloxi (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxi alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo),

15 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanóilo inferior, un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo 1,3-dioxoranil alquilo inferior, un grupo tetrahidrofuril alquilo inferior, un grupo piridil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como uno o más sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolil alquilo inferior, un grupo furil alquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonil alquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes), un grupo piridilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como uno o más 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 entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo benzoilo, un grupo furil carbonilo, un grupo fenil alcoxycarbonilo inferior y un grupo oxo,

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

30 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior y un grupo fenilo,

35 (48) un grupo tiazolidinil carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,

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

(50) un grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxi sustituidos con halógeno o sin sustituir,

40 (51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahidroquinolilcarbonilo,

(53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,

(54) un grupo morfolinil alquilo inferior,

45 (55) un grupo piperazinil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior en el grupo piperazinilo,

(56) un grupo morfolinilcarbonil alquilo inferior,

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

(58) un grupo oxo,

50 (59) un grupo amino alcoxi 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 entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior,
- (62) un grupo morfolinilo,
- 5 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
- (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,
- (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un único grupo tioxo, y
- (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.
- 10 La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que A es un grupo alquileo inferior.
- La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que R¹ representa un grupo ciclo alquilo C5-C6 y en el grupo cicloalquilo C5-C6 representado por R¹, pueden estar presentes de 1 a 5 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35),
- 15 (36), (39), (61) y (62) mostrados a continuación como uno o más sustituyentes:
- (1) un grupo alquilo inferior,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- (10) un grupo hidroxilo inferior,
- 20 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo carbamoilo inferior, un grupo amino alcanóilo inferior, un grupo alcanoilamino inferior-alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilamino inferior-alcanóilo inferior, como uno o más sustituyentes,
- (18) un grupo alcanóilo inferior,
- 25 (21) un grupo alcoxycarbonilo inferior,
- (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:
- (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcoxi inferior,
- 30 (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi carbonilo inferior,
- (xxi) un grupo piridil alquilo inferior,
- (29) un grupo amino alquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo inferior amino sustituido (que puede tener presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo amino),
- 35 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un único grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- 40 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- 45 (36) un grupo imidazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alquilo fenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo alcanilamino inferior-alcanilo inferior,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior, y

(62) un grupo morfolinilo.

La presente invención proporciona un compuesto representado por la fórmula general (1), en la que R^1 representa (I) un grupo ciclohexilo, y, en el grupo cicloalquilo C5-C6 representado por R^1 , pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) definidos en la reivindicación 4 como uno o más sustituyentes.

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

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

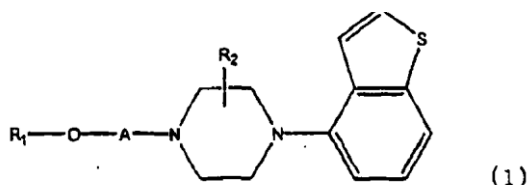
La composición farmacéutica de acuerdo con la presente invención puede usarse como una composición farmacéutica para el tratamiento o prevención de trastornos del sistema nervioso central seleccionados del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; perturbación emocional; trastorno psicótico; trastorno anímico; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo compulsivo; trastorno por estrés postraumático; trastorno por ansiedad generalizada; trastorno por estrés agudo; histeria; trastorno por somatización; trastorno por 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; trastornos del sueño; trastorno de adaptación; alcoholismo; intoxicación alcohólica; drogadicción; intoxicación por estimulantes; narcotismo; anhedonía; anhedonía iatrogénica; anhedonía de una causa psicótica o mental; anhedonía asociada con depresión; anhedonía asociada con esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos, cinetosis; obesidad; migraña; dolor (dolencia); retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastornos por tics; trastorno de hiperactividad/déficit de atención; trastorno conductual y síndrome de Down.

La presente invención proporciona un proceso para producir una composición farmacéutica que comprende mezclar un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una sal del mismo con un vehículo farmacéuticamente aceptable.

La presente invención proporciona el uso de un compuesto heterocíclico, representado por la fórmula (1), o una sal del mismo como un fármaco.

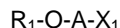
Específicamente se proporciona un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1) o una sal del mismo, como un agonista parcial del receptor de dopamina D_2 y/o un antagonista del receptor de serotonina $5-HT_{2A}$ y/o un antagonista del receptor de adrenalina α_1 y/o un inhibidor de la captación de serotonina (o un inhibidor de la recaptación de serotonina).

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

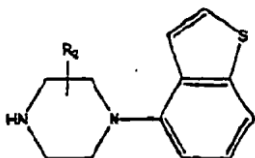


[en la que R_1 , R_2 y A son los mismos que se definen en la reivindicación 1] o una sal del mismo, caracterizado

porque comprende una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



- 5 [en la que R_1 y A son los mismos que se han definido anteriormente, y X_1 representa un átomo de halógeno o un grupo que provoca una reacción de sustitución igual que en un átomo de halógeno] o una sal del mismo con un compuesto representado por la fórmula:



[en la que R_2 es el mismo que se ha definido anteriormente] o una sal del mismo.

Mejor modo de realizar la invención

- 10 Los ejemplos específicos de cada uno de los grupos mostrados en la fórmula general (1) son como se indican a continuación.

Los ejemplos específicos de cada uno de los grupos mostrados en la fórmula general son como se indican a continuación.

- 15 El grupo alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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 secbutilo, un grupo n-pentilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo isopentilo, un grupo neo-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo 1,2,2-trimetil-propilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo, un grupo 2-etilbutilo, un grupo isohexilo y un grupo 3-metilpentilo.

- 20 El grupo alquileo inferior es un grupo alquileo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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.

- 25 El grupo alqueniilo inferior es un grupo alqueniilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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.

- 30 El grupo alqueniilo inferior es un grupo alqueniilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono, incluyendo tanto una configuración trans como cis. Los ejemplos específicos del mismo 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.

- 40 Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente sustituido con 1 a 7, más preferiblemente, 1 a 3 átomos de halógeno. Los ejemplos específicos de los mismos 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. Los ejemplos específicos del mismo 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.

- 5 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 anteriormente (un grupo alquilo inferior lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente, 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- ó 4-)bifenilo, un grupo (1- ó 2-)naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, o 4-)terc-butilfenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-4-bifenilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-2-bifenilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-3-bifenilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-4-bifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)aminofenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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 3,4-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 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente, 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- ó 4-)bifeniloxi, un grupo (1- ó 2-)naftiloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)etilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butilfeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)metil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)etil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-propil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-butil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-pentil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)n-hexil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)isobutil-4-bifeniloxi, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-2-bifeniloxi, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-3-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6'-)terc-butil-4-bifeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-

naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorofeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofeniloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)bromofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) bromo-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftiloxi, un grupo (2-, 3- ó 4-)aminofeniloxi, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftiloxi, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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 2,4,6-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 2,3,4,3,7-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 alquiltio inferior es un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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 anteriormente sustituido con 1 a 7, preferiblemente, 1 a 3 átomos de halógeno. Los ejemplos específicos del mismo 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 9-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 fenil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

Los ejemplos del grupo 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 alcanilo inferior y un grupo fenil alcoxi 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 hidroxil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3 grupos hidroxil un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo hidroxietilo, 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.

El ejemplo de un grupo protector de un grupo hidroxil alquilo 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 fenil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

Los ejemplos del grupo hidroxil alquilo inferior protegido incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 hidroxil protegidos como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alcoxi inferior, un grupo alcanilo inferior o un grupo fenil alcoxi inferior). Los ejemplos específicos del mismo 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-feniletoksi)etilo, un grupo 2-(1-feniletoksi) etilo, un grupo 2-(3-fenilpropoxi)etilo, un grupo 2-(4-fenilbutoxi)etilo, un grupo 2-(5-fenilpentiloxi)etilo, un grupo 2-(5-fenilhexiloxi)etilo, un grupo 2-(1,1-dimetil-2-feniletoksi)etilo, un grupo 2-

5 (2-metil-3-fenilpropoxi)etilo, un grupo 3- etoxipropilo, un grupo 2,3-dietoxipropilo, un grupo 9-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 alcanóilo inferior es un alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butirilo, un grupo isobutililo, un grupo pentanoílo, un grupo terc-butil carbonilo y un grupo hexanoílo.

10

El grupo alcoxicarbonilo inferior es un grupo alcoxicarbonilo lineal o ramificado cuyo resto alcoxi inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente, y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, un grupo isobutoxi carbonilo, un grupo terc-butoxicarbonilo, un grupo sec-butoxicarbonilo, un grupo n-pentiloxicarbonilo, un grupo neopentiloxi, un grupo n-hexiloxicarbonilo, un grupo isohexiloxicarbonilo y un grupo 3-metilpentiloxicarbonilo.

15

El grupo alquil sulfonilo inferior es un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente, y tiene de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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.

20

El grupo alquilcarbamoílo inferior es un grupo carbamoílo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo N-metilcarbamoílo, un grupo N,N-dimetilcarbamoílo, un grupo N-etilcarbamoílo, un grupo N,N-dietilcarbamoílo, un grupo N-n-propilcarbamoílo, un grupo N-n-butilcarbamoílo, un grupo N-n-pentilcarbamoílo, un grupo N-n-hexilcarbamoílo, un grupo N-isobutilcarbamoílo, un grupo N-terc-butilcarbamoílo y un grupo N,N-di-n-propilcarbamoílo.

25

Los ejemplos del grupo aminoalcanoílo incluyen un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupo amino. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo aminoacetilo, un grupo 3-aminopropionilo, un grupo 4-aminobutililo, un grupo 3,4-diaminobutililo, un grupo 3,3-dimetil-3-amino-propionilo, un grupo 4-aminobutililo y un grupo 5-aminovalerilo.

30

Los ejemplos del grupo alcanóilo amino inferior-alcanoílo inferior incluyen un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) cuyo resto alcanóilo inferior tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcanóilamino inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo 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.

35

Los ejemplos del grupo alcoxi carbonilamino inferior-alcanoílo inferior incluyen un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) cuyo resto alcoxicarbonilo inferior tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi carbonilamino inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo 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 3,9-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 un sustituyente, un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, alcanóilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carbamoílo, un grupo alquilcarbamoílo inferior, un grupo amino alcanóilo inferior, un grupo alcanóilamino inferior-alcanoílo inferior y un grupo alcoxicarbonilamino inferior-alcanoílo inferior incluyen un grupo amino que tiene, como un sustituyente, de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcoxicarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilsulfonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo carbamoílo; un grupo alquilcarbamoílo inferior como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo carbamoílo que tiene, como un sustituyente, de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono)); un grupo amino alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo alcanóilamino inferior-alcanoílo inferior como se ha

45

50

55

60

ilustrado anteriormente; y un grupo alcoxicarbonilamino inferior-alcanoílo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo amina, un grupo 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 h-metil-N-metoxicarbonilamino, un grupo N-[N, N-dimetilcarbamoil]amino, un grupo N-carbamoilamino, un grupo N-[N-metilcarbamoil]amino, un grupo N-[N,N-dietilcarbamoil]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 resto arilo es fenilo, bifenilo, naftilo o similares, y en el que de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del grupo arilsulfonilo que pueden tener un grupo alquilo inferior en un grupo arilo incluyen un grupo fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilsulfonilo, un grupo (1- ó 2-) naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 9', 5' ó 6'-)metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)etil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-propil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-pentil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) isobutil-2-bifenil-sulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-)terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' ó 6'-) terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) isobutil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-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 2,4-dimetil-1-naftil-sulfonilo, 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 de un grupo carboxil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos de los mismos 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 de un grupo alcoxicarbonil inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 alcoxicarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos de los mismos un grupo metoxicarbonilmetilo, un grupo etoxicarbonilmetilo, un grupo 1-metoxicarboniletilo, un grupo 2-metoxicarboniletilo, un grupo 2-etoxicarboniletilo, un grupo 1-etoxicarboniletilo, un grupo 3-metoxicarbonilpropilo, un grupo 3-etoxicarbonilpropilo, un grupo 4-etoxicarbonilbutilo, un grupo 5-isopropoxicarbonilpentilo, un grupo 6-n-propoxicarbonilhexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxicarboniletilo, un grupo 1-metil-1-metoxicarboniletilo, un grupo 2-metil-1-metoxicarbonilpropilo, un grupo 2-metil-3-terc-butoxicarbonilpropilo, un grupo 3-metil-1-metoxicarbonilbutilo, un grupo dietoxicarbonilmetilo, un grupo 1,2-dietoxicarboniletilo, un grupo 2-n-pentiloxicarboniletilo y un grupo n-hexiloxicarbonilmetilo.

Los ejemplos del grupo carbamoil alquilo inferior que pueden tener un grupo, como un sustituyente, seleccionado

entre el 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 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tienen de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos carbamoilo. El resto carbamoilo puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene 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 anteriormente (grupos alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del grupo carbamoil alquilo inferior incluyen un grupo carbamoilmetilo, un grupo dicarbamoilmetilo, un grupo 2-carbamoiletilo, un grupo 1-carbamoiletilo, 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 carboxil alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos carboxilo e incluyendo tanto una configuración trans como cis (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-carboxietenilo, un grupo 3-carboxi-2-propenilo, 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 alcoxycarbonil alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alcoxycarbonil inferior como se ha ilustrado anteriormente e incluyendo tanto una configuración trans como cis. El ejemplo específico del grupo alcoxycarbonil inferior-alcano inferior incluye un grupo 2-metoxycarbonietenilo, un grupo 2-etoxycarbonietenilo, un grupo 1-etoxycarbonietenilo, 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-butoxycarbonietenilo, un grupo 2-metil-3-terc-butoxycarbonil-2-propenilo y un grupo 2-n-pentiloxycarbonietenilo.

Los ejemplos del grupo carbamoil alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 dobles enlaces) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos carbamoilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-carbamoiletlenilo, 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 carbamoil alqueno inferior que pueden tener, como un sustituyente, un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo carbamoilo que puede tener, en el grupo carbamoilo, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo alquilo inferior sustituido (con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (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 átomos de halógeno). Los ejemplos específicos del mismo 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 anteriormente (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 anteriormente (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo 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 arilo inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo arilo cuyo resto 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 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente, y un grupo amino.

Pueden estar presentes de uno a siete sustituyentes de al menos un tipo de estos en un anillo arilo. Los ejemplos específicos del arilo inferior incluyen un grupo fenoximetilo, un grupo 2-fenoxietilo, un grupo 2-[(1- ó 2-)naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)metilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)etilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)n-propilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)n-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)n-pentilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)n-hexilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)isobutilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)terc-butilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftiloxi] etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftiloxi] etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) n-hexil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)clorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-) fluorofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)bromofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftiloxi] etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1- naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) bromo-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)aminofenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftiloxi]etilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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-(2,3,4,5,7-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 y grupo 2,3,4-trifenoxibutilo, un grupo 3-[(1- ó 2-) naftiloxi]propilo, un grupo 2,3-di[(1- ó 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 4-[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 3,4-di[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- ó 2-)naftiloxi]etilo, un grupo 5-[(1- ó 2-)naftiloxi]pentilo, un grupo 6-[(1- ó 2-)naftiloxi]hexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-[(1- ó 2-)naftiloxi]propilo, un grupo 2-metil-3-[(1- ó 2-)naftiloxi]propilo y un grupo 2,3,4-tri[(1- ó 2-)naftiloxi]butilo.

Los ejemplos del grupo amino alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo aroilo y un grupo carbamoilo incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo aroilo como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo benzoilo) como se ha ilustrado anteriormente y un grupo carbamoilo. Los ejemplos específicos del grupo amino alquilo inferior incluyen un grupo aminometilo, un grupo 2-aminoetilo, un grupo 1-aminoetilo, un grupo 3-aminopropilo, un grupo 4-aminobutilo, un grupo 3-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-butirilamino) etilo, un grupo 2-(N-metil-N-benzoilamino)etilo y un grupo 2-(N-carbamoilamino)etilo.

Los ejemplos del grupo ciclo alquilo 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 ciclo alquilo C3-C8 que pueden tener un grupo, como un sustituyente, seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi carbonilo inferior y un grupo fenilo alcoxi inferior incluyen un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos, como uno o más sustituyentes, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo hidroxilo; un grupo alcoxi inferior carbonilo como se ha ilustrado anteriormente ; 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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo ciclooctilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 2-metilciclohexilo, un grupo 4-hidroxiciclohexilo, un grupo 4-metoxicarbonilciclohexilo, un grupo 2-benciloxipentilo y un grupo 2-benciloxihexilo.

El ejemplo del grupo alquilo inferior sustituido con ciclo alquilo C3-C8 incluye un grupo alquilo inferior como se ha

ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 un grupo ciclo alquilo C3-C8 como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo ciclopropilmetilo, un grupo ciclohexilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo 1-ciclobutiletilo, un grupo ciclopentil metilo, 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 furil alquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo furilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como un sustituyente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo [(2- ó 3-)furil]metilo, un grupo 2-[(2- ó 3-)furil]etilo, un grupo 1-[(2- ó 3-)furil]etilo, un grupo 3-[(2- ó 3-)furil]propilo, un grupo 4-[(2- ó 3-)furil]butilo, un grupo 5-[(2- ó 3-)furil]pentilo, un grupo 6-[(2- ó 3-)furil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- ó 3-)furil] etilo, un grupo 2-metil-3-[(2- ó 3-)furil]propilo, un grupo [5-etil-(2-, 3- ó 4-)furil]metilo, un grupo [5-metil-(2-, 3- ó 4-) furil]metilo, un grupo [2-n-propil-(3-, 4- ó 5-)furil]metilo, un grupo [3-terc-butil-(2-, 4- ó 5-)furil]metilo, un grupo [4-n-pentil-(2-, 3- ó 5-)furil]metilo, un grupo [2-n-hexil-(3-, 4- ó 5-)furil]metilo, un grupo [2,5-dimetil-(3- ó 4-)furil]metilo, un grupo [2,5-dietil-(3- ó 4-)furil]metilo y un grupo [2,4,5-trietil-3-furil]metilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidrofuril alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)metilo, un grupo 2-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]etilo, un grupo 1-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]etilo, un grupo 3-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]propilo, un grupo 2,3-di[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]propilo, un grupo 4-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]butilo, un grupo 3,4-di[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)] butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]etilo, un grupo 5-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]pentilo, un grupo 6-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]hexilo, un grupo 3,3-dimetil-3-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]propilo, un grupo 2-metil-3-[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]propilo y un grupo 2,3,4-tri[(2- ó 3-)(2,3,4,5-tetrahidrofuril)]butilo.

Los ejemplos de un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo [(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]metilo, un grupo 2-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]etilo, un grupo 1-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil] etilo, un grupo 3-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]propilo, un grupo 4-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]etilo, un grupo 5-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]pentilo, un grupo 6-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]hexilo, un grupo 1-[(2- ó 4-)1,3-dioxolanil]isopropilo y un grupo 2-metil-3-[(1-, 2- ó 4-)imidazolil]propilo.

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

Los ejemplos del grupo pirrolilo alquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirrolilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo [(1-, 2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo 2-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil] etilo, un grupo 5-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]hexilo, un grupo 1-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]isopropilo, un grupo 2-metil-3-[(1-, 2- ó 3-)pirrolil]propilo, un grupo [1-metil-(2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-etil-etil-(2- ó 3-) pirrolil]metilo, un grupo [1-n-propil-(2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-butil-(2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-pentil-(2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo [1-n-hexil-(2- ó 3-)pirrolil]metilo, un grupo 2-[5-metil-(1-, 2-, 3- ó 4-)pirrolil]etilo, un grupo 1-[1-etil-(2- ó 3-)pirrolil]etilo, un grupo 3-[1-etil-(2- ó 3-)pirrolil]propilo, un grupo 4-[1-n-propil-(2- ó 3-)pirrolil]butilo, un grupo 5-[1-n-butil-(2- ó 3-)pirrolil]pentilo, un grupo 6-[1-n-pentil-(2- ó 3-)pirrolil]hexilo, un grupo [1,5-dimetil-(2-, 3- ó 4-)pirrolil]metilo, un grupo [1,3,5-trimetil-2-pirrolil]metilo y un grupo [1,2,4-trimetil-3-pirrolil]metilo.

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 anteriormente (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 un dihidropirazolilo, un grupo en el que puede estar presente un grupo oxo. Los ejemplos específicos del mismo

incluyen un grupo 3-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolilmetilo, un grupo 2-[4-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]etilo, un grupo 1-[5-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]etilo, un grupo 3-[3-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]propilo, un grupo 4-[4-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]butilo, un grupo 5-[1-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]pentilo, un grupo 6-[5-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]hexilo, un grupo 2-metil-3-[1-(2,3- ó 4,5-)dihidropirazolil]propilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[3-(2,3- ó 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.

Los ejemplos del grupo pirazolil alquilo inferior (que puede tener un sustituyente de un grupo alquilo inferior en el grupo pirazolilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupo pirazolilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo 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-2-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 imidazolil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo [(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]metilo, un grupo 2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, un grupo 3-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]propilo, un grupo 4-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]butilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]etilo, un grupo 5-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]pentilo, un grupo 6-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]hexilo, un grupo 1-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]isopropilo y un grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo piridil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 3- ó 4-)piridilmetilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)piridil]metilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)piridil]etilo, un grupo 3-[(2-, 3- ó 4-)piridil]propilo, 4-[(2-, 3- ó 4-)piridil]butilo, un grupo 1,2-dimetil-2-[(2-, 3- ó 4-)piridil]etilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4-)piridil]pentilo, un grupo 6-[(2-, 3- ó 4-)piridil]hexilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)piridil]isopropilo y un grupo 2-metil-3-[(2-, 3- ó 4-)piridil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirazinil alquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente como un sustituyente en el grupo pirazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 el que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo 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.

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

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

- Los ejemplos del grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperazinilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos piperazinilo, en los que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (lineal o ramificado grupos alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo 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-2-piperazinil)hexilo, 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 morfolinil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente

(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. Los ejemplos específicos del mismo 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 2-(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.

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

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

Los ejemplos del grupo tiazolil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 4- ó 5-)tiazolilmetilo, un grupo 2-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]etilo, un grupo 1-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]etilo, un grupo 3-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]propilo, un grupo 4-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]butilo, un grupo 5-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]pentilo, un grupo 6-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]etilo y un grupo [2-metil-3-[(2-, 4- ó 5-)tiazolil]propilo.

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

Los ejemplos del grupo dihidrobenzofuril alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo 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 benzopiraniil alquilo inferior (que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el grupo benzopiraniilo) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzopiraniilo en el que puede estar presente un grupo oxo como un sustituyente. Los ejemplos específicos del mismo 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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-benzo-piran-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-(1 H-2-benzo-piran-1-il)propilo, un grupo 4-(1H-2-benzopiran-1-il)butilo, un grupo 5-(1H-2-benzopiran-1-il)pentilo, un grupo 6-(1 H-2-benzo-piran-1-

il)hexilo, un grupo (1H-2-benzopiran-3-il)-metilo, un grupo 2-(1H-2-benzopiran-3-il)etilo, un grupo 3-(1 H-2-benzopiran-3-il)propilo, un grupo 4-(1 H-2-benzopiran-3-il)butilo, un grupo 5-(1 H-2-benzopiran-3-il)pentilo, un grupo 6-(1 H-2-benzopiran-3-il)hexilo, un grupo (1 H-2-benzopiran-3-il)metilo, un grupo 2-(1 H-2-benzopiran-4-il)etilo, un grupo 3-(1 H-2-benzopiran-4-il)propilo, un grupo 4-(1 H-2-benzopiran-4-il)butilo, un grupo 5-(1 H-2-benzopiran-4-il)pentilo, un grupo 6-(1 H-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 (4-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-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-2-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 benzoimidazolil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos benzoimidazolilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 1-benzoimidazolilmetilo, un grupo 2-(1-benzoimidazolil)etilo, un grupo 3-(1-benzoimidazolil)propilo, un grupo 4-(1-benzoimidazolil)butilo, un grupo 5-(1-benzoimidazolil)pentilo, un grupo 6-(1-benzoimidazolil)hexilo, un grupo 2-benzoimidazolilmetilo, un grupo 2-(2-benzoimidazolil)etilo, un grupo 3-(2-benzoimidazolil)propilo, un grupo 4-(2-benzoimidazolil)butilo, un grupo 5-(2-benzoimidazolil)pentilo y un grupo 6-(2-benzoimidazolil)hexilo.

Los ejemplos del grupo indolil alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxicarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos indolilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-)ilmetilo, un grupo 2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)iletilo, un grupo 3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)ilpropilo, un grupo 4-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)ilbutilo, un grupo 5-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)ilpentilo, un grupo 6-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)ilhexilo, un grupo 3-metil-3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)ilpropilo, un grupo 1,1-dimetil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- ó -7-)iletilo y un grupo 1-metoxicarbonil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-)iletilo.

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

Los ejemplos del grupo piridilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior, como un sustituyente incluyen un grupo piridilo que puede tener de 1 a 4 (preferiblemente 1) grupos, como uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior en el que cada uno de los dos restos alquilo inferior está compuesto por un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de

- carbono). Los ejemplos específicos del mismo 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.
- 10 Los ejemplos del grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo aroilo como un sustituyente incluyen un grupo pirrolidinilo que tiene de 1 a 3, preferiblemente 1 grupo, como uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo alcoxicarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente un grupo alcanoilo inferior como se ha descrito anteriormente (un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), y un grupo aroilo (preferiblemente un grupo benzoilo). Los ejemplos específicos del mismo 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-metoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 3-etoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1-terc-butoxicarbonilpirrolidin-3-ilo, un grupo 4-propoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 5-butoxicarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1-pentoxicarbonil-2-ilo, un grupo 2-hexiloxicarbonilpirrolidin-2-ilo, un grupo 1,3-dimetoxicarbonilpirrolidin-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-trietoxi-carbonilpirrolidin-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.
- 15
- 20
- 25
- Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un grupo como un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, y un grupo aroilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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 uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 30
- un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); y un grupo aroilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo benzoilo). Los ejemplos específicos del mismo 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- ó 4-clorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3- ó 4-fluorobenzoil)-4-piperidilo, un grupo 1-(2-, 3- ó 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.
- 35
- 40
- 45
- 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.
- 50
- 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.
- 55
- Los ejemplos del grupo pirazolilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo arilo y un grupo furilo como un sustituyente incluyen un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos, como uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);
- 60
- un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente; y un grupo furilo. Los ejemplos específicos del mismo 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 (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-clorooheñil)-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.

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.

Los ejemplos del grupo tiadiazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo tiadiazolilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3, preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 4- ó 5-(1, 2, 3-tiadiazolilo), un grupo 3- ó 5-(1, 2, 4-tiadiazolilo), un grupo 3-(1, 2, 5-tiadiazolilo), un grupo 2-(1, 3, 4-tiadiazolilo), 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 de un 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 anteriormente (grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos de los mismos 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- ó 7-)indazolilo.

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

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

Los ejemplos de un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como un sustituyente incluyen un grupo tetrahidroquinolilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos, como uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un átomo de halógeno; y un grupo oxo. Los ejemplos específicos del mismo 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- ó 8-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-8-metil-(3-, 4-, 5-, 6- ó 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- ó 8-)-(1,2,3,4-tetrahidroquinolilo), un grupo 2-oxo-8-fluoro-(3-, 4-, 5-, 6- ó 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 grupo quinolilo 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 anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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 benzodioxolil alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado

anteriormente (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. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-, 4- ó 5-(1,3-benzodioxolil)metilo, un grupo 2-(2-, 4- ó 5-)(1,3-benzodioxolil)etilo y un grupo 3-(2-, 4- ó 5-)(1,3-benzodioxolil)propilo.

- 5 Los ejemplos del grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcoxycarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano, un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo aril alcoxi inferior; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxilo alquilo inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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 tiazolidinil alquilo inferior que puede tener un grupo oxo; un grupo imidazolil alcanóilo inferior; y un grupo piperidinilcarbonilo incluyen un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 grupos, como uno o más sustituyentes, que se seleccionan entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente;

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

- 25 un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (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 anteriormente (un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono (incluyendo tanto una configuración trans como cis));

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

- 30 un grupo alquiltio inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanóilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alcoxycarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo como se ilustra a continuación; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxi cuyo resto arilo es como se ha ilustrado anteriormente; un grupo arilo alcoxi inferior cuyo resto arilo y cuyo resto alcoxi son como se han ilustrado anteriormente; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxilo alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es como se ha ilustrado anteriormente; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente; 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 anteriormente; 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 resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo imidazolil alcanóilo inferior cuyo resto alcanóilo es como se ha ilustrado anteriormente y un grupo piperidinilcarbonilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bifenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) fluorofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bromofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isopropoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butoxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutoxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)sec-butoxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isopentiloxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)neopentiloxifenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexiloxi-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isohexiloxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(3-metilpentiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorometilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoroetil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-bromopropil)fenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(4-clorobutil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(5-fluoropentil)fenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(6-bromohexil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-metil-3-fluoropropil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorometoxifenilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-fluoroetoxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-bromopropoxi)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(4-clorobutoxi)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(5-fluoropentiloxi)fenilo, un

grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometoxifenilo, un grupo 4-(6-bromohexiloxi)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetoxi)fenilo, un grupo 7-(2-metil-3-fluoro- propoxi)-2-naftilo, un grupo 2-vinilfenilo, un grupo 2-(1-metilvinil)fenilo, un grupo 2-(1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-metil-1-propenil)fenilo, un grupo 3-(2-metil-1-propenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-propenil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-propenil)fenilo, un grupo 4-(2-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-butenil)fenilo, un grupo 5-(3-butenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-pentenil)fenilo, un grupo 6-(1-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-pentenil)fenilo, un grupo 7-(4-pentenil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1,3-butadienil)fenilo, un grupo 8-(1,3-pentadienil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-penten-4-inil)fenilo, un grupo 1-(2-hexenil)-2-naftilo, un grupo 4-(1-hexenil)fenilo, un grupo 3-(5-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-hexenilo), un grupo 4-(4-hexenil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3,3-dimetil-1-propenil)fenilo, un grupo 5-(2-etil-1-propenil)-2-naftilo, un grupo 4-(1,3,5-hexatrienil)fenilo, un grupo 6-(1,3-hexadienil)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1,4-hexadienil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-formilamino)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-acetilamino)fenilo, un grupo 7-(N-acetilamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-propionilamino) fenilo, un grupo 8-(N-butililamino)-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-isobutililamino)fenilo, un grupo 2-(N-pentanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-terc-butilcarbonilamino)fenilo, un grupo 3-(N-hexanoilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N,N-diformilamino)fenilo, un grupo 4-(N,N-diacetilamino)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N,N-dimetilamino)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-fenilamino)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)sulfamoilfenilo, un grupo 5-sulfamoil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metiltiofenilo, un grupo 6-etiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propiltiofenilo, un grupo 7-isopropiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butiltiofenilo, un grupo 8-terc-butiltio-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentiltiofenilo, un grupo 1-n-hexiltio-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-metil(sulfonilamino)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)formilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)acetilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)butirilfenilo, un grupo 3-acetil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)propionilfenilo, un grupo 4-butil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutililfenilo, un grupo 5-pentanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)cianofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butilcarbonilfenilo, un grupo 6-hexanoil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonilfenilo, un grupo 7-etoxicarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propoxicarbonilfenilo, un grupo 8-isopropoxicarbonil-2-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butoxicarbonilfenilo, un grupo 2-isobutoxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butoxicarbonilfenilo, un grupo 3-sec-butoxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentiloxicarbonilfenilo, un grupo 4-neopentiloxi-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexiloxicarbonilfenilo, un grupo 5-isohexiloxicarbonil-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-metilpentiloxi-carbonil)fenilo, un grupo 6-(1-pirrolil)-1-naftilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-pirrolil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etnilfenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-metilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-fenilcarbamoil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-hidroxi-etil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)fenoxifenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)nitrofenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)benciloxi-fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)hidroxifenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-oxo-2,5-dihidrofuran-4-il)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-imidazolilacetil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2,4-dioxotiazolidin-5-ilmetil)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilcarbonil]fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 3-, 4- ó 5-)pirazolil]fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-oxo-(1- o 3-)piperidilnitil]fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 4- ó 5-)oxazolil]fenilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-etil-4-metilimidazol-1-il)fenilo, un grupo (2-, 3- ó 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 3,4,5-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 ciano alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene un único grupo ciano. Los ejemplos específicos del mismo 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 alcanoilamino inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 alcanoil inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcanoil lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo 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 de un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno incluyen un grupo amino que tiene de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alquilo sustituido con halógeno lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono

con 1 a 7 (preferiblemente 1 a 3) átomos de halógeno). Los ejemplos específicos del mismo 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, un grupo 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 y N,N-di(fluorometil)amino.

Los ejemplos del grupo alquiltio inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alquiltio inferior cuyo resto alquilo es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo 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 anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo 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 amidino alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene 1 a 3 grupos amidino. Los ejemplos específicos del mismo 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 alqueniilo inferior incluyen un grupo alqueniilo inferior cuyo resto alqueniilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alqueniilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 dobles enlaces y de 2 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo viniloxi, un grupo 1-propeniilo, un grupo 1-metil-1-propeniilo, un grupo 2-metil-1-propeniilo, un grupo 2-propeniilo, un grupo 2-buteniilo, un grupo 1-buteniilo, un grupo 3-buteniilo, un grupo 2-penteniilo, un grupo 1-penteniilo, un grupo 3-penteniilo, un grupo 4-penteniilo, un grupo 1,3-butadieniilo, un grupo 1,3-pentadieniilo, un grupo 2-penten-4-iniilo, un grupo 2-hexeniilo, un grupo 1-hexeniilo, un grupo 5-hexeniilo, un grupo 3-hexeniilo, un grupo 4-hexeniilo, un grupo 3,3-dimetil-1-propeniilo, un grupo 2-etil-1-propeniilo, un grupo 1,3,5-hexatrieniilo, un grupo 1,3-hexadieniilo y un grupo 1,4-hexadieniilo.

Los ejemplos del grupo alqueniilo inferior-alquilo inferior incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 grupos alqueniilo inferior cuyo resto alqueniilo inferior es un grupo alqueniilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alqueniilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 dobles enlaces). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo viniloximetilo, un grupo 2-viniloxietilo, un grupo 2-(1-propeniilo)etilo, un grupo 2-(1-metil-1-propeniilo)etilo, un grupo 2-(2-metil-1-propeniilo)etilo, un grupo 2-(2-propeniilo) etilo, un grupo 2-(2-buteniilo)etilo, un grupo 2-(1-buteniilo)etilo, un grupo 2-(3-buteniilo)etilo, un grupo 2-(2-penteniilo) etilo, un grupo 2-(1-penteniilo)etilo, un grupo 2-(3-penteniilo) etilo, un grupo 2-(4-penteniilo)etilo, un grupo 2-(1,3-butadieniilo)etilo, un grupo 2-(1,3-pentadieniilo)etilo, un grupo 2-(2-penten-4-iniilo)etilo, un grupo 2-(2-hexeniilo)etilo, un grupo 2-(1-hexeniilo)etilo, un grupo 2-(5-hexeniilo)etilo, un grupo 2-(3-hexeniilo)etilo, un grupo 2-(4-hexeniilo)etilo, un grupo 2-(3,3-dimetil-1-propeniilo)etilo, un grupo 2-(2-etil-1-propeniilo)etilo, un grupo 2-(1,3,5-hexatrieniilo)etilo, un grupo 2-(1,3-hexadieniilo)etilo, un grupo 2-(1,4-hexadieniilo)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 entre el 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 anteriormente 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

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

- 5 un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono con preferiblemente de 1 a 7, más preferiblemente 1 a 3 átomos de halógeno). Los ejemplos específicos de los mismos 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-propil- fenil)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-bromo- propil)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 y un grupo N,N-difenilamino.

- Los ejemplos del grupo aril alqueno inferior incluyen un grupo alqueno inferior como se ha ilustrado anteriormente que tiene un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alqueno lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 grupos arilo y de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-feniletlenilo, un grupo 3-fenil-2-propenilo, un grupo 3-[(1- ó 2-naftil)-2-propenilo, un grupo 4-[(2-, 3- ó 4-metilfenil)-2-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3- ó 4-etilfenil)-3-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3- ó 4-n-propilfenil)-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4-n-butilfenil)-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4-n-pentilfenil)-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4-n-hexilfenil)-3-pentenilo, un grupo 3-[(2-, 3- ó 4-isobutilfenil)-2-propenilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4)terc-butilfenil]fenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftil]-2- propenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftil]-3-pentenilo, un grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftil]-2-propenilo, un grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftil]etenilo, un grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4)clorofenil], un grupo (2-, 3- ó 4)fluorofenil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4)bromofenil]-3-pentenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)cloro-1-naftil]-2-propenilo, un grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)cloro-2-naftil]etenilo, un grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)fluoro-1-naftil]-2-propenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)fluoro-2-naftil]-2-butenilo, un grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)bromo-1-naftil]-3-butenilo, un grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8)bromo-2-naftil]-1,3-butadienilo, un grupo 5-[(2-, 3- ó 4)aminofenil]-1,3,5-hexatrienilo, un grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-) amino-1-naftil]-2,4-hexadienilo, un grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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-dimetilnaftil)-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 anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), en el grupo piridilo y/o un grupo amino. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo N-(2-, 3- ó 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 aril alquilo inferior (que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior, como un sustituyente, en el grupo arilo y/o el grupo alquilo inferior) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos arilo como se ha ilustrado anteriormente. Ha de observarse que, en el grupo arilo y/o el resto alquilo, puede haber de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente, de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente;

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

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

un grupo alcoxi-carbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del grupo aril alquilo inferior (que puede tener un sustituyente seleccionado entre el 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 alcoxycarbonilo inferior, 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- ó 4-)fluorobencilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)fluorofenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-) fluorofenil] etilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-) fluorofenil]propilo, un grupo 2-[(2,6- ó 3,5-)difluorofenil] etilo, un grupo 1- (3, 5-difluorofenil)etilo, un grupo 1-(3,5-difluorofenil)propilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorobencilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 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- ó 4-)trifluorometilfenilbencilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]propilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilbencilo, un grupo 2-[(2- 3- ó 4-)metilfenil]etilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)trifluorometilfenil]etilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxibencilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)metilfenil]etilo, un grupo 1-[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]propilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxibencilo, un grupo (3,4- o 3,5-)dimetoxibencilo, un grupo (3,4- ó 3,5-)di(n-butoxi)bencilo, un grupo 2-[(3,5- ó 3,4-)dimetoxifenil]etilo, un grupo 2-(2-etoxifenil)etilo, un grupo 1-(4-metoxifenil)butilo, un grupo 1-fenil-1-metoxicarbonilmetilo, un grupo 1-carbamoil-2-feniletilo, un grupo 1-metoxi-carbonil-2-feniletilo, un grupo 2-metoxicarbonil-2-feniletilo, un grupo 2-fenil-2-hidroxietilo, un grupo 2-(4-hidroxi- fenil)-1-metoxicarboniletilo, un grupo 3-cloro-4-difluorometoxifenilmetilo y un grupo naftilmetilo.

Los ejemplos del grupo alquinilo inferior incluyen un grupo alquinilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos del mismo 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.

Los ejemplos del grupo ariloxi alquilo inferior (en el grupo arilo, un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior; un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilo inferior; y un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo, pueden estar presentes, incluyen un grupo aril alquilo inferior cuyo resto arilo y un grupo alquilo inferior son como se han ilustrado anteriormente. En el grupo arilo en este documento, pueden estar presentes de 1 a 5 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente; y un grupo oxo puede estar presente como uno o más sustituyentes. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)metoxifenoxietilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)carbamoilfenoxi]etilo, un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-) (N-metil-N-etoxicarbamoil)fenoxi]etilo y un grupo 2-[(2-, 3- ó 4-)(2-oxo-1-pirrolidinil)fenoxi]etilo.

Los ejemplos del grupo isoxazolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo isoxazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 3-oxoisoxazolidin-4- ó 5-ilo y un grupo 3,5-dioxoisoxazolion-4-ilo.

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

Los ejemplos del grupo aril alcoxi inferior-alquilo inferior incluyen un grupo aril alcoxi inferior-alquilo inferior cuyo resto arilo, resto alcoxi inferior y resto del grupo alquilo inferior son como se han ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo benciloximetilo, un grupo 2-benciloxietilo y un grupo 2-benciloxibutilo.

- 5 Los ejemplos del grupo azetidinitilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroílo incluyen un grupo azetidinitilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados entre un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo aroílo como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2- ó 3-azetidinitilo, un grupo 1-acetil-(2- ó 3-azetidinitilo), un grupo 1-butiril-(2- ó 3-azetidinitilo) y un grupo 1-benzoil-(2- ó 3-azetidinitilo).
- 10 Los ejemplos del grupo azetidinitil alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo aroílo incluyen un grupo azetidinitil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo aroílo como se ha ilustrado anteriormente y tener un resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2- ó 3-azetidinitilmetilo, un grupo 2-(2- ó 3-azetidinitil)etilo, un grupo 1-acetil-(2- ó 3-azetidinitil)metilo, un grupo 1-butiril-(2- ó 3-azetidinitil)metilo, un grupo 1-benzoil-(2- ó 3-azetidinitil)metilo, un grupo 2-[1-acetil-(2- ó 3-azetidinitil)]etilo, un grupo 2-[1-butiril-(2- ó 3-azetidinitil)]etilo y un grupo 2-[1-benzoil-(2- ó 3-azetidinitil)]etilo.

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

- 20 Los ejemplos del grupo indolinil- que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo indolinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 3-, 5-, 6-, 7- ó 8-)indolinilo, un grupo 2-oxo-(1-, 3-, 5-, 6-, 7- ó 8-)indolinilo y un grupo 2,3-diaxo-(1-, 5-, 6-, 7- ó 8-)indolinilo.

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

- 25 Los ejemplos del grupo triazolilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior incluyen un grupo triazolilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alquiltio inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 3- ó 5-)-1,2,4-triazolilo, un grupo (1-, 2- ó 5-)-1,3,5-triazolilo, un grupo 2-metil-5-metil-1,2,4-triazol-3-ilo y un grupo 1-metil-5-metil-1,2,3-triazol-2-ilo.

- 30 Los ejemplos del grupo imidazolilo que puede tener un grupo carbamoílo incluyen un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos carbamoílo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- ó 5-)imidazolilo y un grupo 4-carbamoil-(1-, 2- ó 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 anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 3- ó 4-)oxazolilo y un grupo 4-metil-(2- ó 3-)oxazolilo.

- 35 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 anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (3-, 4- ó 5-) isotiazolilo y un grupo (3- ó 4-)metil-2-isotiazolilo.

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

- 40 Los ejemplos del grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un único grupo oxo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2-, 5-, 6-, 7- ó 8-)2,3-dihidrobenzo-tiazolilo y un grupo 2-oxo-(1-, 5-, 6-, 7- ó 8-)2,3-dihidrobenzotiazolilo.

Los ejemplos del grupo tienilo que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior incluyen un grupo tienilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos alcoxicarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2- ó 3-)tienilo y un grupo 3-metoxicarbonil-2-tienilo.

- 45 Los ejemplos del grupo oxazolil alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo oxazolil alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, cuyo grupo alquilo como se ha ilustrado anteriormente, que tiene 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente en el anillo oxazol. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 4- ó 5-)oxazolilmetilo, un grupo 2-(2-, 4- ó 5-)oxazolilmetilo, un grupo 12-metil-(4- ó 5-)oxazolil]metilo y un grupo (2,5-dimetil-4-oxazolil)metilo.

- 50 Los ejemplos del grupo amino alquilo inferior que puede tener un grupo, en el grupo amino, que se selecciona entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo arilo, un grupo aril alquilo inferior, un grupo aroílo y un grupo alquilo amino sustituido (en el grupo amino del grupo alquilo amino sustituido, un grupo alquilo inferior puede estar presente como un sustituyente) incluyen un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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. Ha de observarse que, en el grupo amino, pueden estar presentes de 1 a 2 sustituyentes que se seleccionan entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo alquilo inferior
 5 sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (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-carbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente

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

10 un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente;

un grupo aril alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente;

un grupo aroilo como se ha ilustrado anteriormente; y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) que tiene de 1 a 5, preferiblemente 1 a 3, más preferiblemente 1, grupos amino (pueden estar presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado
 15 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo amino, como uno o más sustituyentes). Los ejemplos específicos del grupo amino alquilo inferior que puede tener, en el grupo amino, un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo arilo, un grupo aril alquilo inferior, un grupo aroilo y un grupo alquilo amino sustituido ((en el grupo amino del grupo alquilo amino
 20 sustituido, puede estar presente un grupo alquilo inferior como un 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-benzoilaminometilo, un grupo N-metil-aminoetilo, 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-benzoilaminoetilo, un grupo N-metil-N-propionilaminoetilo, un grupo N-metil-N-bencilaminoetilo y un grupo N-metil-N-terc-butoxicarbonilaminoetilo.

30 Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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 anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y está sustituido con 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos carbamoilo, que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un
 35 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 anteriormente (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). Los ejemplos específicos de los mismos incluyen un grupo carbamoilmetilo, un grupo 2-carbamoil etilo, 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 anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo tiocarbamoilo, un
 50 grupo N-metil-tiocarbamoilo, un grupo N-etil-tiocarbamoilo, un grupo N-n-propiltiocarbamoilo, un grupo N-n-butiltiocarbamoilo, un grupo N-n-pentiltiocarbamoilo, un grupo N-n-hexiltiocarbamoilo, un grupo N-isobutil-tiocarbamoilo, un grupo N-terc-butiltiocarbamoilo, un grupo N,N-dimetiltiocarbamoilo y un grupo N-metil-N-etiltiocarbamoilo.

Los ejemplos del grupo oxazolidinilo que puede tener un grupo oxo incluyen un grupo oxazolidinilo que puede tener de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo. Los ejemplos específicos del mismo 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 entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 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.

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

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

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

Los ejemplos del grupo arilsulfonilo incluyen un grupo arilsulfonilo cuyo resto arilo es fenilo, bifenilo, bifenilo sustituido, fenilo sustituido, naftilo y naftilo sustituido, y que puede tener, en el resto arilo, de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente de 1 a 2 grupos alquilo lineal o ramificado que tiene 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 uno a siete, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente de 1 a 2 sustituyentes de al menos un tipo de estos en el anillo 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- ó 4-) bifenilsulfonilo, un grupo (1- ó 2-)naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etil-fenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-pentilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)isobutilfenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butilfenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')metil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')metil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')metil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')etil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')etil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')etil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-propil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-propil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-propil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-pentil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-pentil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-hexil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-hexil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')n-hexil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')isobutil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')isobutil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')isobutil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')terc-butil-2-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')terc-butil-3-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5'- ó 6')terc-butil-4-bifenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)metil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)etil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-propil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-pentil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)n-hexil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)isobutil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)terc-butil-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)clorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)fluorofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bromofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)cloro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)fluoro-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)bromo-2-naftilsulfonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)aminofenilsulfonilo, un grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)amino-1-naftilsulfonilo, un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 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.

Los ejemplos del grupo piperidilo que puede tener un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un

grupo alquilo inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo arilsulfonilo; un grupo oxo; un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo alcanoilamino inferior-alcanóilo inferior incluyen un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 5, preferiblemente de 1 a 3, más preferiblemente 1 sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

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

un grupo arilsulfonilo como se ha ilustrado anteriormente; un grupo oxo; un grupo hidroxilo; y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcoxycarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alcanoil amino inferior-alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilo, un grupo 1-metil-4-piperidilo, un grupo 2-etil-4-piperidilo, un grupo 3-n-propil-4-piperidilo, un grupo 4-isopropil-4-piperidilo, un grupo 2-n-butiril-1-piperidilo, un grupo 3-isobutil-1-piperidilo, un grupo 4-terc-butiril-1-piperidilo, un grupo 1-sec-butiril-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-iso-hexil-3-piperidilo, un grupo 5-(3-metilpentil)-3-piperidilo, un grupo 6-formil-3-piperidilo, un grupo 1-acetil-4-piperidilo, un grupo 2-propionil-4-piperidilo, un grupo 3-butiril-4-piperidilo, un grupo 4-isobutil-4-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)-4-piperidilo, un grupo 2-(2,3-di-aminofenilsulfonil)-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 4-(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 y un grupo 4-[N-metil-N-(N-acetilamino)acetilamino]-1-piperidilo.

Los ejemplos del grupo piperidilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo carboxil alquilo inferior, un grupo alquilo carbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoil, un grupo alcoxil inferior, un grupo carboxil, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que un grupo alquilo inferior puede estar presente como un sustituyente), un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decano, un grupo morfolinilo, un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que puede estar presente un grupo alquilo inferior como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridoxil, un grupo piridil alcoxil inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo aril alcoxil inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxil inferior y un grupo alcoxil inferior sustituido con halógeno), un grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxil inferior y un grupo hidroxil), un grupo ariloxil (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxil inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno), un grupo aril alquilo inferior (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxil inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno) y un grupo aroilo (que puede tener en el grupo arilo un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxil inferior) incluyen un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) sustituyentes, en el grupo piperidilo, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo hidroxil;

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

un grupo carboxil alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente que tiene un resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un

grupo carbamoilo que tiene de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (lineal o ramificado grupos alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo carbamoilo;

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

5 un grupo alcocarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente,

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

10 un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcocarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo aroilo como se ha ilustrado anteriormente); un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes); un grupo
15 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decilo; un grupo morfolinilo;

un grupo hexahidro-1,4-diazepinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) como uno o más sustituyentes); un grupo piridilo; un grupo piridiloxi;

20 un grupo piridil alcoxi inferior que tiene un resto alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente; un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 (preferiblemente 1) grupos oxo); un grupo benzodioxolilo (preferiblemente un grupo benzo[1,3]dioxolilo);

un grupo aril alcoxi inferior que tiene un resto arilo y un resto alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente);
25 un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo hidroxil); un grupo ariloxi que tiene un resto arilo como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente); un grupo aril inferior que tiene un resto arilo y un resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el 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

30 un grupo aroilo como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) metil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)hidroxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroxi-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)hidroximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroximetil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroximetil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroximetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(2-hidroxietil)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-etil-carbamoilmetil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(N-etil-carbamoil-metil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)N-etil-carbamoilmetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carbamoil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)carbamoil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carboxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carboximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxi-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo

40 (1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) metil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)hidroxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroxi-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)hidroximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroximetil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)hidroximetil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hidroximetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(2-hidroxietil)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-etil-carbamoilmetil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(N-etil-carbamoil-metil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(N-etil-carbamoilmetil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)N-etil-carbamoilmetil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carbamoil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)carbamoil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)carbamoil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carboxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)carboximetil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxi-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxi-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxi-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-4-piperidilcarbonilo, un grupo

(2-, 3- ó 4-) acetilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)acetilamino-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc- butoxicarbonilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)terc- butoxicarbonilamino-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)terc-butoxicarbonilamino-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)terc-butoxicarbonilamino-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)butirilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)benzoilamino-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-metil-N-butirilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(N-metil-N-benzoilamino)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-1- piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidil]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) [1-acetil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[1-butiril-(2-, 3- ó 4-) piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[1-terc-butoxicarbonil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) [1-benzoil-(2-, 3- ó 4-)piperidil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-piperazinil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)[1-(3,4-dimetilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 3- ó 4-)[1-(4-metilpiperazinil)]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2- ó 4-)[1-(4-metil- piperazinil)]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2- ó 3-)[1-(4-metilpiperazinil)]-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 4-, 5- ó 6-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2- ó 3-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinil]-4- piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil- hexahidro-2,4-diazepinil)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(4-metil-hexahidro-1,4-diazepinil)-4-piperidil carbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-,4-, 5- ó 6-)(1,4- dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-2-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-3-piperidilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)(1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]dec-8-il)-4-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 4- ó 5-)benzo[1,3]dioxolil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)-1,2,3,4-tetrahidroquinolil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolil]-2- ó 3-metil)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridiloxi)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridilmetoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)fluorobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)bromobenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-) metilbenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibenciloxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3,4-diclorobenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3,4-dimetoxibenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-cloro-4-metoxibenciloxi)-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-) fluorofenoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenoxi]-1-piperidilcarbonilo; un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)cianofenoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metilfenoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxifenoxil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-) fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)hidroxifenoxi]-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-etoxicarbonil-(2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-) metilbencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo 4-hidroxi-(2-, 3- ó 4-)bencil-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)metoxibenzoil]- 1-piperidilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)fluorobenzoil]-1-piperidilcarbonilo y un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)trifluorometoxibencil]-1-piperidilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo hidroxil alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxil, un grupo amino (que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanilo inferior y un grupo aroilo en el mismo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior, un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como un sustituyente), un grupo amino alquilo inferior (que puede tener un grupo alquilo inferior en el mismo como un sustituyente) y un grupo aril oxi (que puede tener en el grupo arilo un grupo alcoxi inferior sustituido con halógeno), un grupo ariloxi alquilo inferior (en el que puede estar presente un grupo arilo, 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente que tiene de 1 a 3 grupos hidroxil (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono): un grupo carbamoilo; un grupo hidroxil;

un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo

inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcanóilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, y un grupo aroílo como se ha ilustrado anteriormente);

5 un grupo morfolinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono); un grupo pirrolidinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo piperidil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

10 un grupo piperazinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo, como uno o más sustituyentes);

15 un grupo amino alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (pueden estar presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo amino, como uno o más sustituyentes), un grupo ariloxi que tiene un resto arilo como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo, de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno), un grupo ariloxi alquilo inferior que tiene un resto arilo y un resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo, de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno) y un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un único grupo oxo). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2- ó 3-)pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)hidroximetil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroximetil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroximetil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)carbamoil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)carbamoil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)carbamoil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)hidroxi-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroxi-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)hidroxi-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)amino-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)acetamido-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)acetamido-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)acetamido-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)butirilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(N-metil-N-acetilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(N-metil-N-butirilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)benzoilamino-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(N-metil-N-benzoilamino)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-) morfolinil-metil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)morfolinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2- ó 3-)pirrolidinilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)[(1-, 2-, 3- ó 4-)piperidilmetil]-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(9-metil-1-piperazinilmetil)-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(4-metil-1-piperazinilmetil)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)N, N-dimetilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)N, N-dimetilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)N, N-dimetilaminometil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (2- ó 3-)N, N-dietilaminometil-1-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)N, N-dietilaminometil-2-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)N, N-dietilaminometil-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(4-trifluorometoxifenoximetil)-3-pirrolidinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4- ó 5-)(4-trifluorometoxifenoxi)-3-pirrolidinilcarbonilo y un grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)(2-oxi-1,2,3,4-tetrahydroquinolil)-3-pirrolidinilcarbonilo.

45 Los ejemplos de un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanóilo inferior, un grupo hidroxi alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcocarbonilo inferior, un grupo amino alquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente en el grupo amino, como un sustituyente), un grupo piperidil alquilo inferior (un grupo alquilo inferior puede estar presente en el grupo piperidilo, como un sustituyente), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior, un grupo tetrahydrofuril alquilo inferior, un grupo piridil alquilo inferior (un grupo fenilo puede estar presente en el grupo alquilo inferior como un sustituyente), un grupo imidazolil alquilo inferior, un grupo furil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil carbonil alquilo inferior, un grupo piperidil que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, un grupo piridilo (un sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un ciano grupo y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno puede estar presente en el grupo piridilo, como un sustituyente), un grupo tieno[2,3-c] piridilo, un grupo arilo (en el que puede estar presente un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroílo, un grupo furil alquilo inferior, un grupo arilo alcocarbonilo inferior 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

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

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

- 5 un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 anteriormente (grupos alcoxi lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono)); un grupo alcoxycarbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente;

- 10 un grupo amino alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente, preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (pueden estar presentes de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo amino, como uno o más sustituyentes);

- 15 un grupo piperidil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente, preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperidilo como uno o más sustituyentes);

un grupo morfolinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- 20 un grupo pirrolidinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo 1,3 dioxolanil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo tetrahidrofuril alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- 25 un grupo piridil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha 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 uno o más sustituyentes); un grupo imidazolil alquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- 30 un grupo furil alquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

un grupo pirrolidinil carbonil alquilo inferior, cuyo resto alquilo inferior es uno que se ha 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 anteriormente (lineal o ramificado grupos alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono);

- 35 un grupo piridilo (pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1) seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), un grupo ciano, y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como se ha ilustrado anteriormente (preferiblemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con 1 a 7 átomos de halógeno) en el grupo piridilo); un grupo tieno[2,3-c]piridilo; un grupo arilo como se ha

- 40 ilustrado anteriormente (que puede tener en el grupo arilo de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo aroilo como se ha ilustrado anteriormente, un grupo furil alquilo inferior que tiene un resto alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo aril alcoxi carbonilo inferior que tiene un resto arilo y un resto alcoxi carbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo oxo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1- ó 2-)piperazinilcarbonilo, un

- 45 grupo (2-, 3- ó 4-)metil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)n-propil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-butil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)n-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-etil-n-propil)]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-etil-n-propil)]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-,

- 50 3- ó 4-)isopropil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)isopropil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)terc-butil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-hexil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)n-hexil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)ciclopentil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)ciclopentil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)cicloheptil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)cicloheptil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)acetil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)butiril-1-piperazinil grupo carbonilo, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)acetil-

2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-hidroxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-hidroxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-metoxietil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-metoxietil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3- metoxipropil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-metoxipropil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(4-metoxibutil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metoxibutil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etoxicarbonil-2-piperazinil- grupo carbonilo, (2-, 3- ó 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)terc-butoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(N,N-dimetilamino) etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-(N,N-dimetilamino)etil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-(1-piperidil)etil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-) (2-(1-piperidil)etil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(4-morfolinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(4-morfolinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) [2-(1-pirrolidinil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(2-(1,3-dioxolanil)etil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-){2-[2-(1,3-dioxolanil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-tetrahidrofurilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-tetrahidrofurilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(2-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(4-piridilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-piridilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(4-piridil) etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(2-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-) [2-(2-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[2-(1-imidazolil)etil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[2-(1-imidazolil)etil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-furilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-furilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1-pirrolidinilcarbonilmetil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-) (1-metil-4-piperidil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(1-metil-4-piperidil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(2-, 3- ó 4-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-ciano-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-ciano-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-){4-metil-2-piridil}-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(4-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-metil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)(3-metil-2-piridil)-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)(3-trifluorometil-2-piridil)-1-piperazinilcarbonilo, un grupo [1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-] (3-trifluorometil-2-piridil)-2- piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)tieno(2,3-c)piridil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)[(2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)tieno-[2,3-c]piridil]-2-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-)clorofenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2-, 3- ó 4-) metilfenil]-1-piperazinilcarbonilo, un grupo 3-oxo-(2- ó 4-)fenil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)benzotil-1-piperazinilcarbonilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)[(2- ó 3-)furilcarbonil]-1-piperazinilcarbonilo y un grupo (2-, 3- ó 4-)benciloxicarbonil-1-piperazinilcarbonilo.

45 El ejemplo de un grupo hexahidroazepinilcarbonilo incluye un grupo (1-, 2-, 3- ó 4-)hexahidroazepinilcarbonilo.

El ejemplo de un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener un sustituyente seleccionado entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo piridilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (hexahidro-1,4-diazepin-(1-,2-, 5- ó 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.

El ejemplo de un grupo dihidropirrolilcarbonilo incluye un grupo 2,3-dihidropirrolilcarbonilo y un grupo 2, 5-dihidropirrolilcarbonilo.

55 Los ejemplos del grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener un grupo alquilo inferior incluyen un grupo dihidropirrolilcarbonilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 4, preferiblemente de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1-, 2- ó 3-) (2,5-dihidropirrolilcarbonilo), un grupo 2,5-dimetil-1-(2,5-dihidropirrolilcarbonilo) y un grupo 2,5-dimetil-1-(2,3-dihidropirrolilcarbonilo).

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

Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un

grupo alquilo inferior, y un grupo piperidil alquilo 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos piperidilo como uno o más sustituyentes), un grupo arilo como se ha descrito anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 3- ó 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- ó 5-) tiazolidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo arilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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) grupos arilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (2-, 3-, 4- ó 5-)tiazolidinil-carbonilo, un grupo (2-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-)metoxifenil]-3-tiazolidinilcarbonilo y un grupo (2-, 4- ó 5-)[(2-, 3- ó 4-) cianofenil]-3-tiazolidinilcarbonilo.

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

Los ejemplos del grupo azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener un grupo ariloxi sustituido con halógeno o sin sustituir 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 anteriormente (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 no sustituidos como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 1-azabicyclo[3,2,1]oct-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, un grupo 2-azabicyclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, un grupo 3-azabicyclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 6- ó 8-)ilcarbonilo, un grupo 6-azabicyclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ó 8-)ilcarbonilo, un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]oct-(1-, 2-, 3-, 6- ó 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- ó 7-)indolinilcarbonilo.

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

Los ejemplos del grupo piperazinil alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y pueden estar presentes de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (grupos alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1- ó 2-)piperazinilmetilo, un grupo 2-[(1- ó 2-)piperazinil]etilo, un grupo 1-[(1- ó 2-)piperazinil] etilo, un grupo 3-[(1- ó 2-)piperazinil]propilo, un grupo 4-[(1- ó 2-)piperazinil]butilo, un grupo 5-[(1- ó 2-)piperazinil]pentilo, un grupo 6-[(1- ó 2-)piperazinil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- ó 2-)piperazinil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1- ó 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.

Los ejemplos del grupo morfolinilcarbonil alquilo inferior incluyen un grupo morfolinilcarbonil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono). Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 2-morfolinilcarbonilmetilo, un grupo 3-morfolinilcarbonilmetilo, un grupo 4-morfolinilcarbonilmetilo, un grupo 2-(2-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 2-(3-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 2-(4-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1-(2-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1-(3-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 1-(4-morfolinilcarbonil)etilo, un grupo 3-(2-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo 3-(3-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo 3-(4-morfolinilcarbonil)propilo, un grupo

4-(2-morfolinilcarbonil)butilo, un grupo 4-(3-morfolinilcarbonil)butilo, un grupo 4-(4-morfolinilcarbonil)butilo, un grupo 5-(2-morfolinilcarbonil)pentilo, un grupo 5-(3-morfolinilcarbonil)pentilo, un grupo 5-(4-morfolinilcarbonil)pentilo, un grupo 6-(2-morfolinilcarbonil)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.

Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonil alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo piperazinilo incluyen un grupo piperazinilcarbonil alquilo inferior cuyo resto alquilo inferior es un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y que puede tener de 1 a 7, preferiblemente de 1 a 5, más preferiblemente 1, grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente (un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) en el grupo piperazinilo. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1- ó 2-)piperazinilcarbonilmetilo, un grupo 2-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 1-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 3-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]propilo, un grupo 4-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]butilo, un grupo 5-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]pentilo, un grupo 6-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]hexilo, un grupo 1,1-dimetil-2-[(1- ó 2-)piperazinilcarbonil]etilo, un grupo 2-metil-3-[(1- ó 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-butil-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 amino alcoxi inferior (en el grupo amino puede estar presente un grupo alquilo inferior) incluyen un grupo alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente (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 puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo amino metoxi, un grupo 2-amino etoxi, 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-dietilamino)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 resto alcoxi inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo metoximatoxi, 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-metiletoxi.

Los ejemplos del grupo piperazinilo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo alcoxi carbonilo inferior incluyen un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 (de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior como se ha ilustrado anteriormente, un grupo alcanoilo inferior como se ha ilustrado anteriormente y un grupo alcoxi carbonilo inferior como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo (1- ó 2-)piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)metil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)etil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)n-propil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)n-propil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)formil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)acetil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)propionil-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)propionil-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)butiril-1-piperazinilo, un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)butiril-2-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)metoxicarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)etoxicarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2-, 3- ó 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinilo, un grupo (2- ó 3-)oxo -1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)acetil-1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)butiril-1-piperazinilo, un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-)metoxicarbonil-1-piperazinilo y un grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5- ó 6-) metoxicarbonil-1-piperazinilo.

Los ejemplos del grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo como se ha ilustrado anteriormente. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanil-(1, 2, 3, 4 ó 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- ó 6-)-1,2,3,4-tetrahidropiridilo y un grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5- ó 6-)-1,2,3,6-tetrahidropiridilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener un grupo piridilo incluyen un grupo tetrahidropiridilcarbonilo como se ha ilustrado anteriormente que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos piridilo. Los ejemplos específicos del mismo 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 tioxi incluyen un grupo

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

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

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

10 (1) un grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros 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);

15 (2) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros que tiene de 1 a 4 (preferiblemente 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), un grupo dihidroimidazolilo (tal como un grupo 1H-2,3-dihidroimidazolilo), un grupo triazolilo (tal como, un grupo 4H-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);

20 (3) un grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros 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 saturado de 3 a 8 (preferiblemente de 5 a 6) miembros 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;

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

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

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

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

45 De ellos puede hacerse 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 se seleccionan entre el 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 adicionalmente se hace mención preferiblemente de un grupo heteromonocíclico saturado o insaturado que tiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno y se seleccionan entre 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- ó 6-)-1,2,3,4-tetrahidroquinoxalinilo y un grupo (1-, 2-, 5- ó 6-)-5,6,7,8-tetrahidroquinoxalinilo.

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

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

Los ejemplos del grupo dihidrobenzoimidazolilo incluyen un grupo (1-, 2-, 4- ó 5-)-2,3-dihidro-1H-benzoimidazolilo.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

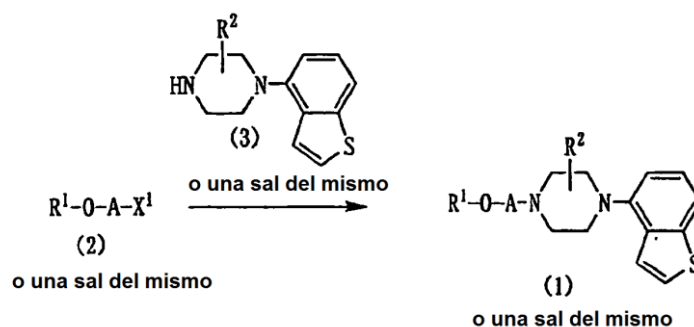
20 Los ejemplos del grupo benzoxatiolilo incluyen un grupo (2-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-benzo[d][1,3]oxatiolilo, un grupo (3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-3H-benzo[c][1,2]oxatiolilo y grupo (3-, 4-, 5-, 6- ó 7-)-3H-benzo[d][1,2]oxatiolilo.

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

25 Un compuesto heterocíclico (en lo sucesivo en este documento denominado un compuesto (1)) representado por la fórmula general (1) puede producirse por diversos tipos de procedimientos, por ejemplo, un procedimiento mostrado en la siguiente fórmula de reacción 1 o la fórmula de reacción 2.

[Fórmula 4]

Fórmula de reacción 1



30 en la que R¹, R² y A son los mismos que se han definido anteriormente; 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 alcanosulfonilo inferior, un grupo arilsulfonilo inferior y un grupo aralquilsulfonilo inferior.

Un 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.

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

Los ejemplos específicos del grupo arilsulfoniloxi representado por X¹ incluyen un grupo fenilsulfoniloxi y un grupo naftilsulfoniloxi que pueden tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el 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 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 X¹ incluyen un grupo alquilsulfoniloxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo fenilo; y

un grupo alquilsulfoniloxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y sustituido con un grupo naftilo; ambos de los cuales pueden tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el 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 fenilo.

Los ejemplos específicos del grupo alquilsulfoniloxi sustituido con un grupo fenilo como se ha mencionado anteriormente 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 alquilsulfoniloxi sustituido con un grupo naftilo incluyen un grupo α -naftilmetilsulfoniloxi y un grupo β -naftilmetilsulfoniloxi.

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

Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que puede no afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona, tal como acetona y metiletil cetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y diglima; un disolvente basado en éster, tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar sin protón, tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción puede realizarse en una mezcla de solución de estos disolventes convencionales. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base inorgánica, tal como un metal alcalino (por ejemplo, sodio y potasio), un hidrógeno carbonato de metal alcalino (por ejemplo, hidrógeno carbonato de litio, hidrogenocarbonato sódico y hidrógeno carbonato potásico), un hidróxido de metal alcalino (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico y hidróxido de cesio), carbonato de metal alcalino (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato sódico, carbonato potásico y carbonato de cesio), alcóxido inferior de metal alcalino (por ejemplo, metóxido sódico y etóxido sódico), y un hidruro (por ejemplo, hidruro sódico e hidruro potásico); o en presencia de una base orgánica, tal como una trialkilamina (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etil diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanilina, N-metilmorfolina, 1,5-diazabicyclo[4,3,0]non-5-eno (DBN), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU). Cuando estas bases toman forma líquida pueden usarse como disolventes.

Estos compuestos básicos pueden usarse solos o en una mezcla de dos tipos o más.

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

La reacción que se ha mencionado anteriormente puede realizarse, si es necesario, con la adición de un yoduro de metal alcalino que sirve como un acelerador, tal como yoduro potásico y yoduro sódico.

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

La temperatura de reacción no se limita particularmente y puede realizarse generalmente en condiciones de refrigeración o calor, y preferiblemente se realiza a una temperatura de casi la temperatura ambiente a aproximadamente 150 °C durante 1 a 30 horas.

El compuesto (2) que sirve como material de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención incluye un compuesto novedoso y puede producirse mediante diversos procedimientos, por ejemplo, un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 3.

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

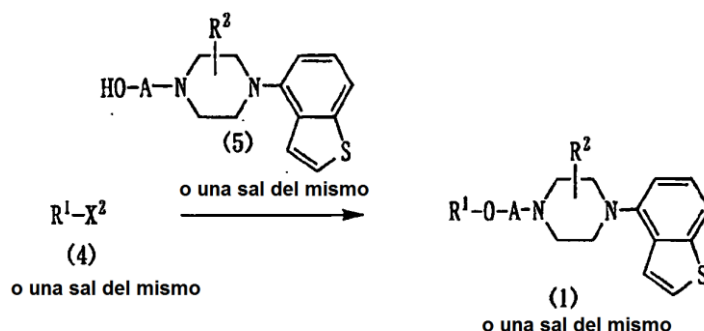
Puede usarse una sal de un compuesto (2) en lugar del compuesto (2) y una sal de un compuesto (3) en lugar del

compuesto (3). Las sales de los compuestos (2) y (3) incluyen sales de adición de ácidos. Estas sales de adición de ácidos pueden prepararse haciendo reaccionar un ácido farmacéuticamente aceptable con un compuesto (2) ó (3). Los ejemplos del ácido usado en este documento incluyen ácidos inorgánicos, tales como ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido clorhídrico, ácido fosfórico y ácido bromhídrico; ácidos sulfónicos, tales como ácido p-tolueno sulfónico, ácido metano sulfónico y ácido etano sulfónico; 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 mediante la reacción con un compuesto básico farmacéuticamente aceptable. Los ejemplos de un compuesto básico de este tipo incluyen hidróxidos metálicos, tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de litio e hidróxido cálcico; carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato sódico, hidrogenocarbonato sódico, hidrógeno carbonato potásico; y alcoholatos de metales alcalinos, tales como metilato sódico y etilato potásico.

[Fórmula 5]

Fórmula de reacción 2



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

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 junto con la fórmula general (4) son los mismos que se han mencionado anteriormente.

El compuesto (1) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto (en lo sucesivo en este documento denominado un compuesto (4)) representado por la fórmula general (4) y un compuesto (en lo sucesivo en este documento denominado un "compuesto (5)") representado por la fórmula general (5).

La reacción puede realizarse en condiciones similares que en la fórmula de reacción 1.

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

Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que puede no afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona, tal como acetona y metiletil cetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y diglima; un disolvente basado en éster, tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar sin protón, tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, como un disolvente que se va a usar en este documento, puede mencionarse una mezcla de solución de estos disolventes convencionales.

Como agente de condensación, puede mencionarse una mezcla de un azocarboxilato, tal como azodicarboxilato de dietilo y un compuesto de fosfina, tal como trifenilfosfina.

La cantidad del agente de condensación usado en este documento es generalmente al menos equimolar, preferiblemente equimolar con respecto a dos veces tal grande como la de un compuesto (4).

La relación de un compuesto (4) con respecto a un compuesto (5) usado en la fórmula de reacción 2 puede ser al menos generalmente equimolar preferiblemente aproximadamente 2 veces por mol.

La temperatura de reacción no se limita particularmente y puede realizarse generalmente en condiciones de refrigeración y calor, 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 material de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un

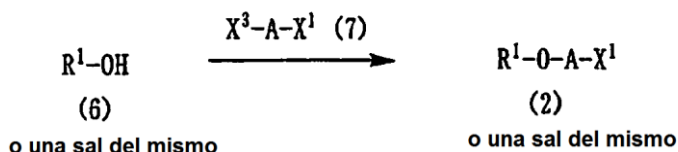
compuesto conocido o un compuesto que puede producirse fácilmente a partir de un compuesto conocido.

El compuesto (5) que sirve como material de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención incluye un compuesto novedoso y un compuesto que puede producirse mediante diversos procedimientos, por ejemplo, un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 4 ó 5,

- 5 Puede usarse una sal de un compuesto (4) en lugar del compuesto (4) y una sal de un compuesto (5) en lugar del compuesto (5). Como una sal preferible de un compuesto (4), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (2). Como una sal preferible de un compuesto (5), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (3).

[Fórmula 6]

10 **Fórmula de reacción 3**



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

- 15 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 junto con la fórmula general (7) son los mismos que se han mencionado anteriormente.

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

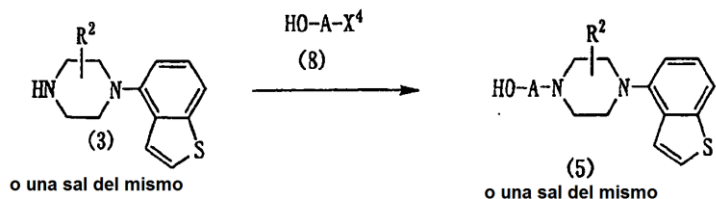
La reacción puede realizarse en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

- 20 Los compuestos (6) y (7) que sirven como materiales de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención son compuestos conocidos o compuestos que pueden producirse fácilmente a partir de compuestos conocidos.

En lugar de un compuesto (6) puede usarse una sal del compuesto (6). Como una sal preferible de un compuesto (6), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (2).

25 [Fórmula 7]

Fórmula de reacción 4



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

- 30 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 junto con la fórmula general (8) son los mismos que se han mencionado anteriormente.

El compuesto (5) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (en lo sucesivo en este documento denominado un compuesto (8)) representado por la fórmula general (8).

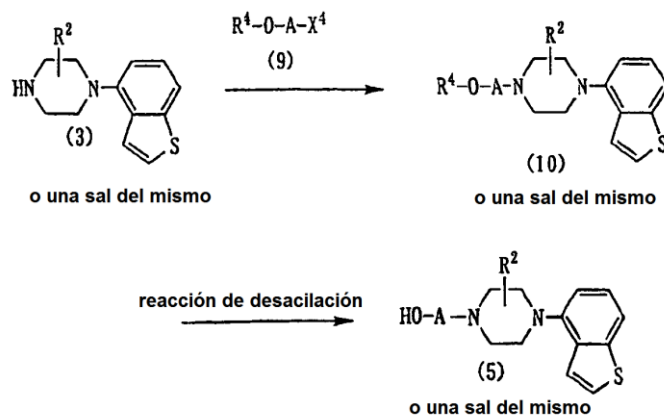
La reacción puede realizarse en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

- 35 El compuesto (8) que sirve como material de partida para un compuesto de acuerdo con la presente invención es un compuesto conocido o un compuesto que puede producirse fácilmente a partir de un compuesto conocido.

En lugar de un compuesto (3) puede usarse una sal del compuesto (3). Como una sal preferible de un compuesto (3), pueden mencionarse las mismas sales que anteriormente.

[Fórmula 8]

Fórmula de reacción 5



5

en la que R² y A son los mismos que se han definido anteriormente; R⁴ es un grupo alcanoilo inferior; y X⁴ 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 R⁴ en las fórmulas generales (9) y (10) son los mismos que se han mencionado anteriormente.

- 10 Además, los ejemplos del átomo de halógeno representado por X⁴ y el grupo que media la misma reacción de sustitución que en un átomo de halógeno junto con la fórmula general (9) son los mismos que se han mencionado anteriormente.

Un compuesto (en lo sucesivo en este documento denominado un compuesto (10)) representado por la fórmula general (10) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto (3) y un compuesto (9).

- 15 La reacción puede realizarse en condiciones similares a las de la fórmula de reacción 1.

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

En lugar de un compuesto (3) puede usarse una sal del compuesto (3). Como una sal preferible de un compuesto (3), pueden mencionarse las mismas sales que anteriormente.

- 20 Posteriormente, el compuesto (10) se somete a una reacción para retirar un grupo acilo con el fin de producir un compuesto (5).

Como un procedimiento preferiblemente de la reacción, puede mencionarse una reacción convencional, tal como hidrólisis. La reacción de hidrólisis puede realizarse preferiblemente en presencia de una base o un ácido, incluyendo ácido de Lewis. Los ejemplos de la base preferible incluyen sales inorgánicas, tales como un metal alcalino (por ejemplo, sodio y potasio), un hidrógeno carbonato de metal alcalino (por ejemplo, hidrógeno carbonato de litio, hidrogenocarbonato sódico y hidrógeno carbonato potásico), un hidróxido de metal alcalino (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico e hidróxido de cesio), un carbonato de metal alcalino (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato sódico, carbonato potásico y carbonato de cesio), un alcóxido inferior de metal alcalino (por ejemplo, metóxido sódico y etóxido sódico), e hidruros (por ejemplo, hidruro sódico e hidruro potásico); y bases orgánicas, tales como un trialkilamina (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, y N-etil diisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilnilina, N-metilmorfolina, DBN, DABCO y DBU. Como un ácido preferible, pueden mencionarse 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 retirada usando un ácido de Lewis, tal como un ácido trihaloacético (por ejemplo, ácido tricloroacético y ácido trifluoroacético) puede realizarse preferiblemente en presencia de un agente de captura de cationes (por ejemplo, anisol y fenol).

- 40 Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que puede no afectar negativamente a la reacción, tal como agua; un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona, tal como acetona y metiletil cetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y diglima; un disolvente basado en éster, tal como

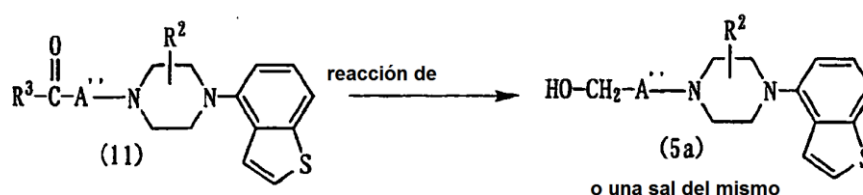
acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar sin protón, tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción puede realizarse en una mezcla de solución de estos disolventes convencionales. De ellos, es preferible etanol. La temperatura de reacción no se limita particularmente y puede realizarse generalmente en condiciones de refrigeración y calor, y se realiza preferiblemente a casi la temperatura ambiente a casi un punto de ebullición del disolvente que se va a usar durante 0,5 a 75 horas.

En lugar de un compuesto (10), puede usarse una sal del compuesto (10). Como una sal preferible de un compuesto (10), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (3).

Además, puede producirse un compuesto (en lo sucesivo en este documento denominado un compuesto (5a)) en el que A" del compuesto (5) representa -CH₂A"- en la que A" representa un grupo alquileo de C1 a C5 mediante un procedimiento representado por la siguiente fórmula de reacción 6.

[Fórmula 9]

Fórmula de reacción 6



en la que R² es igual que se ha definido anteriormente; y R³ es un grupo alcoxi inferior. A" representa un grupo alquileo de C1 a C5. El grupo alcoxi inferior representado por R³ en la fórmula general (11) es el mismo que se ha definido anteriormente.

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

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

La reacción puede realizarse mediante el procedimiento mostrado en el Ejemplo de Referencia 6 o un procedimiento similar del mismo. La reacción también puede realizarse mediante un procedimiento convencional usando un agente reductor.

Como un agente de reducción preferible, puede hacerse mención a un hidruro (tal como hidruro de litio y aluminio, borohidruro sódico, borohidruro de litio, diborano y cianoborohidruro sódico).

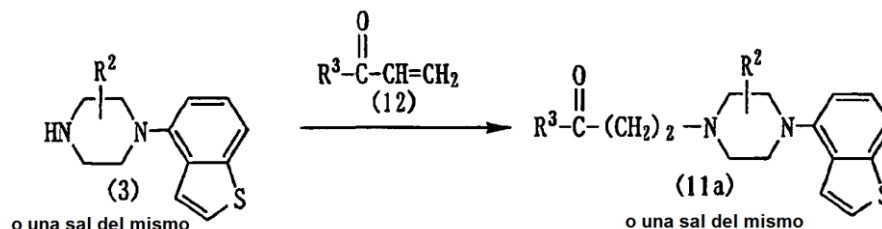
Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que puede no afectar negativamente a la reacción, tal como un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona, tal como acetona y metiletil cetona; un disolvente basado en éter, tal como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y diglima; un disolvente basado en éster, tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar sin protón, tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción puede realizarse en una mezcla de solución de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no se limita particularmente y puede realizarse generalmente en condiciones de refrigeración y calor, y se realiza preferiblemente de casi la temperatura ambiente a casi un punto de ebullición del disolvente que se va a usar durante 0,5 a 75 horas.

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

En lugar de un compuesto (11) puede usarse una sal del compuesto (11). Como una sal preferible de un compuesto (11), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (2).

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

[Fórmula 10]

Fórmula de reacción 7

en la que R² y R³ son los mismos que se han definido anteriormente.

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

La reacción puede realizarse mediante el procedimiento que se ha mostrado en el Ejemplo de Referencia 5 o un procedimiento similar del mismo. Esta reacción se realiza generalmente en un disolvente convencional que puede no afectar negativamente a la reacción, tal como agua, un disolvente basado en alcohol, tal como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoroetanol y etilenglicol; un disolvente basado en cetona, tal como acetona y metiletil cetona; un disolvente basado en éter tal como, tetrahydrofurano, dioxano, éter dietílico y diglima; un disolvente basado en éster, tal como acetato de metilo y acetato de etilo; un disolvente polar sin protón, tal como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida y dimetilsulfóxido; un disolvente basado en hidrocarburo halogenado, tal como cloruro de metileno y cloruro de etileno; u otros disolventes orgánicos. Además, la reacción puede realizarse en una mezcla de solución de estos disolventes convencionales. La temperatura de reacción no se limita particularmente y puede realizarse generalmente en condiciones de refrigeración y calor, y se realiza preferiblemente de casi la temperatura ambiente a casi un punto de ebullición del disolvente que se va a usar durante 0,5 a 75 horas.

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

- 20 Puede usarse una sal de un compuesto (3) en lugar del compuesto (3) y una sal de un compuesto (12) en lugar del compuesto (12). Como una sal preferible de un compuesto (3), puede mencionarse la misma sal que se ha mostrado anteriormente. Como una sal preferible de un compuesto (12), puede mencionarse la misma sal que se muestra en un compuesto (2).

- 25 El compuesto objeto por cada fórmula de reacción anterior puede formar una sal adecuada. Dichas sales adecuadas incluyen las sales preferibles del compuesto (1) que se ilustra a continuación.

Las sales preferibles del compuesto (1) son sales farmacológicamente aceptables y los ejemplos incluyen sales metálicas, tales como sales de metales alcalinos (por ejemplo, sal sódica, sal potásica, etc.), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sal cálcica, sal magnésica, etc.), sales de bases inorgánicas, tales como sal de amonio, carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, carbonato de litio, carbonato potásico, carbonato sódico, carbonato de cesio, etc.), hidrógeno carbonatos de metales alcalinos (por ejemplo, hidrógeno carbonato de litio, hidrogenocarbonato sódico, bicarbonato potásico, etc.), hidróxidos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas, tales como tri(inferior)alquilamina (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etildiisopropilamina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilalanilina, N-(inferior)alquil-morfolina (por ejemplo, N-metilmorfolina), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2,2,2] octano (DABCO); sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidrato, bromhidrato, yodhidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos, tales como formiato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, p-toluenosulfonato, glutamato.

- 40 Además, los compuestos en la forma en la que se añadió solvato (por ejemplo, hidrato, etanolato, etc.) a los compuestos de partida y el compuesto objeto mostrado en cada una de las fórmulas de reacción se incluyen en cada una de las fórmulas generales. Como un solvato preferible, puede mencionarse hidrato.

Cada uno de los compuestos objeto obtenido por cada una de las fórmulas generales puede aislarse y purificarse 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 la refrigeración para separar un producto de reacción en bruto seguido de una operación de purificación convencional, tal como cromatografía en columna o recristalización.

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

Un compuesto y una sal del mismo representado por la fórmula general (1) puede usarse en forma de preparación farmacéutica general. La preparación puede prepararse usando un diluyente o un excipiente, tal como una carga, un agente expansor, aglutinante, humectante, disgregante, tensioactivo y lubricante. Como una preparación farmacéutica, pueden seleccionarse diversas formas dependiendo del propósito terapéutico. Sus formas típicas incluyen un comprimido, píldora, polvo, líquido, suspensión, emulsión, gránulo, encapsulado, supositorio e inyección (líquida, suspensión).

En la formación de un comprimido, puede usarse una amplia diversidad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la materia. Los ejemplos del vehículo que puede usarse incluyen un excipiente tal como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato cálcico, caolín, celulosa cristalina y silicato; un aglutinante, tal como agua, etanol, propanol, jarabe corriente, solución de glucosa, solución de almidón, solución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metil celulosa, fosfato potásico y polivinilpirrolidona; un disgregante tal como almidón deshidratado, alginato de sodio, agar en polvo, laminaran en polvo, hidrógenocarbonato sódico, carbonato cálcico, éster de ácidos grasos de polioxietilensorbitán, lauril sulfato sódico, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, y lactosa; un supresor de disgregación tal como sacarosa, estearina, manteca de cacao y aceite hidrogenado; un absorbente tal como una base de amonio cuaternario y lauril sulfato sódico; 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, estearato, ácido bórico en polvo y polietilenglicol refinados. Adicionalmente, si fuera necesario, un comprimido puede recubrirse con una película general. Los ejemplos de tal comprimido recubierto incluyen un comprimido recubierto con azúcar, encapsulado en gelatina, con recubrimiento entérico, recubierto con una película o con una doble capa y una capa múltiple.

En la formación de una píldora, puede usarse a una amplia diversidad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos de vehículos que pueden usarse incluyen un excipiente tal como glucosa, lactosa, almidón, manteca de cacao, aceite vegetal endurecido, caolín y talco; un aglutinante tal como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina y etanol; y un disgregante tal como laminaran y agar.

En la formación de un supositorio, puede usarse una amplia diversidad de tipos de vehículos convencionalmente conocidos en la técnica. Los ejemplos de vehículos que pueden usarse incluyen polietilenglicol, manteca de cacao, alcohol superior, ésteres de un alcohol superior, gelatina, y glicéridos semisintéticos.

Una cápsula se prepara normalmente mezclando un compuesto de un principio activo con un vehículo, como se ilustra anteriormente de acuerdo con un método convencional, y cargar la mezcla en una cápsula de gelatina dura o blanda.

En la preparación de una inyección, preferentemente, un agente líquido, emulsión y suspensión se esterilizan y se vuelven isotónicos con la sangre. Cuando se preparan en una inyección, puede usarse cualquier diluyente siempre que este se use convencionalmente como un diluyente en la técnica. Los ejemplos de diluyentes que pueden usarse incluyen agua, alcohol etílico, macrogol, propilenglicol, alcohol isoestearílico etoxilado, alcohol isoestearílico polioxietilado, ésteres de ácidos grasos de polioxietilensorbitán.

Obsérvese que, en este caso, una preparación farmacéutica puede contener una sal, glucosa o glicerina en una cantidad suficiente para preparar una solución isotónica. Como alternativa, puede añadirse un solubilizante auxiliar general, un tampón, un lenitivo. Adicionalmente, si fuera necesario, a una composición farmacéutica puede añadirse un pigmento, un conservante, un aromatizante, un saporífero, un edulcorante y otras sustancias medicinales.

La cantidad de un compuesto de la fórmula general (1) y una sal del mismo contenida en una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención no se limita particularmente y se selecciona apropiadamente a partir de un amplio intervalo; sin embargo es generalmente de aproximadamente el 1 al 70% en peso, preferentemente de aproximadamente el 1 al 30% en peso en una composición de preparación.

El método de administración de una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención no está limitado y se administra por un método de acuerdo con la forma de una preparación, la edad, el sexo y otras condiciones de un paciente y de acuerdo con la gravedad de la enfermedad. Por ejemplo, en el caso de un comprimido, píldora, agente líquido, suspensión, emulsión, gránulo y cápsula, la preparación farmacéutica se administra por vía oral. Adicionalmente, en el caso de una inyección, esta se administra por vía intravenosa por sí misma o mezclando con un reabastecedor general tal como glucosa y aminoácidos, y, si fuera necesario, se administra exclusivamente por vía intramuscular, intracutánea, subcutánea o intraperitoneal. En el caso de un supositorio, este se administra en el recto.

La dosis de una preparación farmacéutica de acuerdo con la presente invención se selecciona de manera apropiada dependiendo del régimen de dosificación (instrucciones para su uso), edad, sexo y otras condiciones del paciente, y de acuerdo con la gravedad de la enfermedad, etc.; sin embargo, la dosis de un compuesto de principio activo puede establecerse general y preferentemente a aproximadamente de 0,1 a 10 mg/peso (kg) al día. Es deseable que un compuesto de principio activo esté contenido en el intervalo de aproximadamente 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 agonista parcial del receptor D₂, un efecto antagonista del receptor 5-HT_{2A} y un efecto inhibidor de la captación de serotonina.

- 5 El efecto agonista parcial del receptor D₂ se refiere a una acción que decelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando este se potencia, mientras que acelera la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando este disminuye. De esta manera, el agonista parcial del receptor D₂ actúa como un estabilizador del sistema de la dopamina, que estabiliza la neurotransmisión DA en un estado normal. En virtud de este efecto, el compuesto de la presente invención produce un excelente efecto de mejoría clínica sobre los síntomas producidos por una
- 10 neurotransmisión DA anómala (aceleración o deceleración) sin desarrollar efectos secundarios. Como excelente efecto de mejoría clínica, pueden mencionarse los efectos de, mejoría los síntomas positivos y negativos del deterioro cognitivo y síntomas depresivos (véase Michio Tom, *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, CM.: *Drugs* 64: 1715-1736,2004).
- 15 El efecto antagonista del receptor 5-HT_{2A} se refiere a una acción que reduce los efectos secundarios extrapiramidales y desarrolla una respuesta clínica superior y funciona eficazmente de manera más específica para mejorar los síntomas negativos, el deterioro cognitivo, los síntomas depresivos y el insomnio (véase Jun Ishigooka y Ken Inada: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 4, páginas 1653-1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 1, páginas 5-22 (1998), y Meltzer, H. Y. et al.: *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1159-1172,2003).
- 20

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

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

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

- 30 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 consiguiente, un compuesto de la presente invención es extremadamente eficaz mejorando diversos tipos de trastornos del sistema nervioso central tales como esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; perturbación emocional; trastorno psicótico; trastorno anímico; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno
- 35 distímico; trastorno ciclotímico; trastorno por ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo compulsivo; trastorno por estrés postraumático; trastorno por ansiedad generalizada y trastorno por estrés agudo); trastorno somatoforme (por ejemplo histeria; trastorno por somatización, trastorno por conversión, trastorno por dolor e hipocondriasis); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de la excitación sexual y disfunción
- 40 eréctil); trastornos alimentarios (por ejemplo, anorexia nerviosa y bulimia nerviosa); trastornos del sueño; trastorno de adaptación; trastornos relacionados con sustancia (por ejemplo, alcoholismo; intoxicación alcohólica; drogadicción; intoxicación por estimulantes y narcotismo); anhedonía (por ejemplo, anhedonía iatrogénica, anhedonía de una causa psicótica o mental, anhedonía asociada con depresión, anhedonía asociada con esquizofrenia); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer; enfermedad
- 45 de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos, cinetosis; obesidad; migraña; dolor (dolencia); retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastornos por tics; trastorno de hiperactividad/déficit de atención; trastorno conductual y síndrome de Down.

- 50 Adicionalmente, el compuesto de la presente invención tiene escasos efectos secundarios y es excelente en cuanto a tolerabilidad y seguridad.

Los compuestos de partida usados en cada una de las fórmulas de reacción anteriores pueden ser sales adecuadas, el compuesto objeto obtenido en cada una de las reacciones puede formar una sal adecuada. Tales sales adecuadas incluyen las sales preferentes del compuesto (1) ilustrado más adelante.

- 55 Las sales preferentes del compuesto (1) son sales farmacológicamente aceptables y los ejemplos incluyen sales metálicas tales como sales metálicas alcalinas (por ejemplo, sal de sodio, sal de potasio, etc.), sales metálicas

alcalinotérricas (por ejemplo, sal de calcio, sal de magnesio, etc.), sales de bases inorgánicas tales como sal de amonio, carbonatos metálicos alcalinos (por ejemplo carbonato de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, etc.), hidrógenocarbonatos metálicos alcalinos (por ejemplo, hidrógenocarbonato de litio, hidrógenocarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, etc.), hidróxidos metálicos alcalinos (por ejemplo, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio, etc.); por ejemplo, sales de bases orgánicas tales como trialkilamina(inferior), (por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, N-etildiisopropilamina), 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]undecen-7 (DBU), 1,4-diazabicyclo[2.2.2] octano (DABCO); sales de ácidos inorgánicos tales como clorhidrato, bromhidrato, yodhidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sales de ácidos orgánicos, tales como, formato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanosulfonato, etanosulfonato, p-toluenosulfonato, glutamato.

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

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

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

El compuesto de fórmula general (1) y una sal del mismo pueden usarse en una forma de preparación farmacéutica común. La preparación farmacéutica se prepara usando un diluyente o un excipiente normalmente usado, tal como una carga, un agente expansor, un aglutinante, un humectante, un agente disgregante, un tensioactivo y un lubricante. Al igual que para esta preparación farmacéutica, pueden seleccionarse diversas formas dependiendo del propósito del tratamiento, y como ejemplos típicos se incluyen, un comprimido, píldora, polvo, solución, suspensión, emulsión, gránulo, cápsula, supositorio e inyección (solución, suspensión).

Para conformar un comprimido, como vehículos, pueden usarse ampliamente diversos materiales convencionalmente muy conocidos en la técnica. Como ejemplos, pueden usarse, por ejemplo, excipientes tales como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa cristalina, silicato; aglutinantes tales como agua, etanol, propanol, jarabe simple, solución de glucosa, almidón líquido, solución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metil celulosa, fosfato de potasio, polivinilpirrolidona; agentes disgregantes tales como almidón seco, alginato de sodio, agar en polvo, laminaran en polvo, hidrógenocarbonato de sodio, carbonato de calcio, éster de ácido graso de polioxietilensorbitán, laurilsulfato sódico, monoglicérido de ácido esteárico, almidón, lactosa, agentes que previenen la disgregación, tales como sacarosa, estearina, manteca de cacao, aceite hidrogenado; adsorbentes tales como bases de amonio cuaternario, lauril sulfato sódico; agentes humectantes tales como glicerina, almidón; agentes absorbentes tales como almidón, lactosa, caolín, bentonita, sílice coloidal; lubricantes tales como talco purificado, estearato, borato en polvo, polietilenglicol. Adicionalmente, el comprimido puede ser un comprimido proporcionado con un recubrimiento convencional según se requiera, por ejemplo, un comprimido recubierto con azúcar, un comprimido encapsulado con gelatina, un comprimido recubierto de ... entérica, un comprimido recubierto con una película o un doble comprimido, o un comprimido multicapas.

Para conformar una píldora, como vehículos, pueden usarse ampliamente diversos materiales convencionalmente muy conocidos en la técnica. Como ejemplos, pueden usarse, por ejemplo, excipientes tales como glucosa, lactosa, almidón, manteca de cacao, aceite vegetal hidrogenado, caolín, talco; aglutinantes tal como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina, etanol; agentes disgregantes tal como laminarán, agar.

Para conformar un supositorio, como vehículos, pueden usarse ampliamente diversos materiales convencionalmente muy conocidos. Como ejemplos de los mismos se incluyen, por ejemplo, polietilenglicol, manteca de cacao, alcohol superior, ésteres de alcoholes superiores, gelatina, glicéridos semisintetizados.

Normalmente una cápsula se prepara de acuerdo con un método convencional mezclando los compuestos del principio activo con diversos vehículos ilustrados anteriormente y cargándolos en una cápsula de gelatina dura, una cápsula blanda o similar.

Cuando se preparan como un líquido para inyección, es preferible que la solución, emulsión y suspensión estén esterilizadas y sean isotónicas con la sangre y para formarse en estos modos, como diluyente puede usarse cualquiera de los diluyentes convencionalmente usados en la técnica y puede usarse, por ejemplo, agua, alcohol etílico, macrogol, polipropilenglicol, alcohol isoestearílico etoxilado, alcohol isoestearílico polioxietilado, ésteres de ácidos grasos de polioxietilensorbitán, etc.

La preparación farmacéutica puede contener sales, glucosa o glicerina normales en una cantidad suficiente para preparar una solución isotónica en este caso y también puede añadirse un solubilizante, un tampón, un lenitivo.

Adicionalmente, si se requiere, puede contener pigmentos, conservantes, aromatizantes, saporíferos, edulcorantes y otros productos farmacéuticos.

La cantidad de un compuesto de la fórmula general (1), o una sal del mismo, contenida en la preparación farmacéutica de la presente invención no está particularmente limitada, aunque normalmente es adecuado de aproximadamente el 1 al 70% en peso en la composición de preparación y preferentemente de aproximadamente el 1 al 30% en peso.

No existe ninguna limitación en particular en cuanto al modo de administración de la preparación farmacéutica de la presente invención y puede administrarse mediante un método de acuerdo con la forma específica de la preparación, la edad, sexo y otras condiciones de un paciente, gravedad de la enfermedad, etc. Por ejemplo, en el caso de comprimidos, píldoras, solución, suspensión, emulsión, gránulos y cápsulas, la preparación farmacéutica se administra por vía oral. En el caso de inyección, se administra sola por vía intravenosa o mezclada con líquidos de sustitución convencionales tales como glucosa y aminoácidos y, si fuera necesario, la preparación sola también puede administrarse por vía intramuscular, intracutánea, subcutánea o interperitoneal. En caso de supositorios, se administra por el recto.

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

El compuesto de la presente invención tiene efecto agonista parcial del receptor D₂, efecto agonista del receptor 5-HT_{2A} y efecto inhibidor de la captación de serotonina (o efecto inhibidor de la recaptación de serotonina).

El efecto agonista parcial del receptor D₂ suprime la neurotransmisión dopaminérgica (DA) cuando este se potencia y acelera la neurotransmisión DA cuando este disminuye y por tanto tiene una función para estabilizar la neurotransmisión DA a un estado normal (estabilizador del sistema de dopamina). De acuerdo con esta función, se desarrolla un excelente efecto clínicamente mejorador de las afecciones basadas en la neurotransmisión DA anómala (potenciación y disminución), por ejemplo, un efecto mejorador sobre síntomas positivos y negativos, un efecto mejorador sobre el deterioro cognitivo, un efecto mejorador sobre síntomas depresivos, etc., sin desarrollar efectos secundarios (véase Michio Tom, *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, CM.: *Drugs* 64: 1715-1736, 2004).

El efecto antagonista del receptor 5-HT_{2A} reduce efectos secundarios extrapiramidales, desarrolla efectos clínicos superiores y es eficaz, por ejemplo, en la mejoría de síntomas negativos, mejoría de deterioro cognitivo, mejoría del estado depresivo, mejoría de insomnio (véase Jun Ishigooka y Ken Inada: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 4, páginas 1653-1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: *Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology*, vol. 1, páginas 5-22 (1998), y Meltzer, H. Y. et al.: *Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry* 27: 1159-1172, 2003).

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

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

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

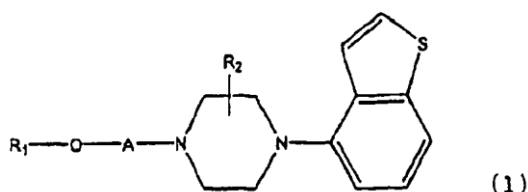
Por lo tanto, los compuestos de la presente invención tienen un amplio espectro de tratamiento para, y excelente efecto clínico sobre, la esquizofrenia y otros trastornos del sistema nervioso central.

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; perturbación emocional; trastorno psicótico; trastorno anímico; trastorno bipolar (por ejemplo, trastorno bipolar de tipo I y de tipo II); depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; trastorno por ansiedad (por ejemplo, ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo compulsivo; trastorno por estrés postraumático; trastorno por ansiedad generalizada y trastorno por estrés agudo); trastorno somatoforme (por ejemplo histeria; trastorno por somatización, trastorno por conversión, trastorno por dolor e hipocondriasis); trastorno facticio; trastorno disociativo; trastorno sexual (por ejemplo, disfunción sexual, trastorno del deseo sexual, trastorno de la excitación sexual y disfunción eréctil); trastornos alimentarios (por ejemplo, anorexia nerviosa y bulimia nerviosa); trastornos del sueño; trastorno de adaptación; trastornos relacionados con sustancia (por ejemplo,

- alcoholismo; intoxicación alcohólica; drogadicción; intoxicación por estimulantes y narcotismo); anhedonía (por ejemplo, anhedonía iatrogénica, anhedonía de una causa psicótica o mental, anhedonía asociada con depresión, anhedonía asociada con esquizofrenia); delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo causado por enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos, cinetosis; obesidad; migraña; dolor (dolencia); retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastornos por tics; trastorno de hiperactividad/déficit de atención; trastorno conductual y síndrome de Down.
- 10 Adicionalmente, los compuestos de la presente invención poseen pocos efectos secundarios, o ninguno, y es excelente en cuanto a tolerabilidad y seguridad.

Un ejemplo preferible de un compuesto deseado (1) es como se indica a continuación:

[Fórmula 1]



- 15 en la que R² 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 cicloalquilo C3-C8; en la que en el grupo ciclo alquilo C3-C8, pueden estar presentes de 1 a 5 (más preferiblemente 1 a 3) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (1) a (66) que se muestran a continuación como un sustituyente:
- 20 (1) un grupo alquilo inferior,
- (2) un grupo alqueno inferior,
- (3) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- 25 (5) un grupo fenoxi,
- (6) un grupo alquiltio inferior,
- (7) un grupo alcoxi inferior sustituido halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,
- (9) un grupo fenil alcoxi inferior,
- 30 (10) un grupo hidroxilo alquilo inferior,
- (11) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (12) un átomo de halógeno,
- (13) un grupo ciano,
- (14) un grupo fenil arilo,
- 35 (15) un grupo nitro,
- (16) un grupo amino,
- (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior; un grupo alcanilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo carboxilo, un grupo alquilo carboxilo inferior, un grupo amino alcanilo inferior, un grupo alcanilamino

- inferior-alcanoílo inferior y un grupo alcoxycarbonilamino inferior-alcanoílo inferior como uno o más sustituyentes (más preferiblemente un grupo N-alquilamino inferior, un grupo N,N-di alquilamino inferior, un grupo N-alcanoilamino inferior, un grupo N-alcoxycarbonilamino inferior, un grupo N-alquilsulfonilamino inferior, un grupo N-alquil inferior-N-alcanoilamino inferior, un grupo N-alquil inferior-N-alcoxycarbonilamino inferior, un grupo N-[carbamoil]amino, un grupo N-[N-alquilcarbamoil inferior]amino, un grupo N-[N,N-dialquilcarbamoil inferior]amino, un grupo N-[amino alcanoil inferior]amino, un grupo N-[[N-alcanoilamino] inferior-alcanoil amino inferior o un grupo N-[[N-alcoxycarbonilamino] inferior-alcanoil]amino inferior),
- 5 (18) un grupo alcanoílo inferior,
- (19) un grupo fenil sulfonilo que puede tener un grupo alquilo inferior en el grupo fenilo (más preferiblemente un grupo alquilfenilsulfonilo inferior),
- 10 (20) un grupo carboxi,
- (21) un grupo alcoxycarbonilo inferior,
- (22) un grupo carboxi alquilo inferior,
- (23) un grupo alcoxycarbonil inferior-alquilo inferior,
- 15 (24) un grupo alcanoilamino inferior-alcanoílo inferior,
- (25) un grupo carboxi alquenilo inferior,
- (26) un grupo alcoxycarbonil inferior-alquenilo inferior,
- (27) un grupo carbamoil alquenilo inferior que puede tener como uno o más sustituyentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el 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 carbamoil alquenilo inferior, un grupo N-alquilcarbamoil inferior-alquenilo inferior, un grupo N,N-dialquilcarbamoil alquenilo inferior o un grupo N-[a alquilo sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno] carbamoil inferior-alquenilo inferior),
- 20 (28) un grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:
- 25 (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcoxi inferior,
- (iii) un grupo hidroxil alquilo inferior,
- (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (v) un grupo feniloxi alquilo inferior,
- 30 (vi) un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- (vii) un grupo amino alquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoílo inferior, un grupo benzoílo y un grupo carbamoílo (más preferiblemente un grupo N,N-dialquilamino inferior-alquilo inferior, un grupo N-alcanoilamino inferior-alquilo inferior, un grupo N-alquil-N-inferior-alcanoilamino inferior-alquilo inferior, un grupo N-alquil-N-benzoilamino inferior-alquilo inferior o un grupo N-carbamoilamino alquilo inferior)
- 35 (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) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxil, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo fenil alcoxi inferior como un sustituyente,
- (ix) un grupo alquilo inferior sustituido con cicloalquilo C3-C8,
- 40 (x) un grupo alquenilo inferior,
- (xi) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos carbamoílo que pueden tener de 1 a 2 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener un único grupo alquilo inferior y un grupo fenilo que puede tener un único grupo alcoxi inferior como uno o más sustituyentes (más preferiblemente un grupo carbamoil alquilo inferior, un grupo dicarbamoil alquilo inferior, un grupo N-alquilcarbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo N,N-dialquilcarbamoil inferior-alquilo inferior, un grupo N-[alquilfenil]carbamoil inferior-alquilo o un grupo N-[alcoxilfenil]carbamoil inferior-alquilo inferior),
- 45

- (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alcoxicarbonilo inferior,
- (xiii) un grupo furil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo furilo),
- (xiv) un grupo tetrahidrofuril alquilo inferior,
- 5 (xv) un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranyl alquilo inferior,
- (xvii) un grupo pirrolil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo pirrolilo),
- (xviii) un grupo dihidropirazolil alquilo inferior que puede tener un único grupo oxo,
- 10 (xix) un grupo pirazolil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo pirazolilo),
- (xx) un grupo imidazolil alquilo inferior,
- (xxi) un grupo piridil alquilo inferior,
- (xxii) un grupo pirazinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo pirazinilo),
- 15 (xxiii) un grupo pirrolidinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior como uno o más sustituyentes el grupo pirrolidinilo),
- (xxiv) un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo),
- 20 (xxv) un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinil alquilo inferior,
- 25 (xxvii) un grupo tienil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolil alquilo inferior,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofuril alquilo inferior,
- (xxx) un grupo benzopiranyl alquilo inferior (que puede tener un único grupo oxo como un sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- 30 (xxxi) un grupo benzoimidazolil alquilo inferior,
- (xxxii) un grupo indolil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior),
- (xxxiii) un grupo imidazolil alquilo inferior que tiene de 1 a 3 sustituyentes (preferiblemente 1 sustituyente) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo carbamoílo y un grupo alcoxicarbonilo inferior en el grupo alquilo inferior,
- 35 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior como uno o más sustituyentes,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo como un sustituyente,
- 40 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un átomo de halógeno en el grupo fenilo,
- 45

- (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un único grupo oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo furilo como un sustituyente,
- 5 (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,
- 10 (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno y un grupo oxo como un sustituyente,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- 15 (xlviii) un grupo benzodioxolil alquilo inferior,
- (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes, seleccionados entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilo sulfonilo inferior, un grupo alquilo inferior y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio inferior; un grupo alcanóilo inferior; un grupo alcoxycarbonilo inferior; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo inferior; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxi; un grupo fenil alcoxi inferior; un grupo hidroxil; un grupo hidroxil alquilo inferior; un grupo carbamoílo que puede tener un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un único 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 único grupo oxo; un grupo tiazolidinil alquilo inferior que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolil alcanóilo inferior y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 20
- 25
- 30 (l) un grupo ciano alquilo inferior,
- (li) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo oxo,
- (lii) un grupo alquilamino inferior sustituido con halógeno,
- (liii) un grupo alquiltio inferior-alquilo inferior,
- 35 (liv) un grupo amidino que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior,
- (lv) un grupo amidino alquilo inferior,
- (lvi) un grupo alqueniloxi inferior-alquilo inferior,
- (lvii) un grupo fenil amino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferiblemente 1 sustituyente) seleccionados entre el 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,
- 40 (lviii) un grupo fenil alquenilo 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-N-[alquilpiridil inferior]amino inferior),
- 45 (lx) un grupo fenil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo

- alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxi inferior sustituido halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo carbamoilo y un grupo alcoxycarbonilo inferior como un sustituyente en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo inferior),
- (lxi) un grupo alquinilo inferior,
- 5 (lxii) un grupo feniloxi alquilo inferior (que puede tener como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo 1 a 3 grupos (preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior, un grupo N-alcoxi inferior-N-alquilcarbamoilo inferior y un grupo oxopirrolidinilo),
- (lxiii) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (lxiv) un grupo dihidroindenilo,
- 10 (lxv) un grupo fenil alcoxi inferior-alquilo inferior,
- (lxvi) un grupo tetrahidropiranilo,
- (lxvii) un grupo azetidínulo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo,
- 15 (lxviii) un grupo azetidínulo alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo inferior y un grupo benzoílo,
- (lxix) un grupo tetrazolilo,
- (lxx) un grupo indolinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (lxxi) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquiltio inferior,
- 20 (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,
- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- (lxxv) un grupo benzoimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un único grupo oxo,
- 25 (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxycarbonilo inferior, y
- (lxxviii) un grupo oxazolil alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior
- (29) un grupo amino alquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo inferior, un grupo benzoílo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
- 30 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un único grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- 35 (31) un grupo tiocarbamoilo que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior,
- (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo (más preferiblemente un grupo oxazolidinilo sustituido con un único grupo oxo),
- 40 (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,

(38) un grupo isoxazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aún más preferiblemente 1) sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo alcanoilamino inferior-alcanoilo inferior (más preferiblemente un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2, y aún más preferiblemente 1) sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilfenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo N-alquilamino inferior, un grupo N,N-dialquilamino inferior, un grupo N-alcanoilamino inferior, un grupo N-alquil inferior-N-alcoxi inferior-carbonilamino, un grupo N-alquil inferior-N-alcanoilamino inferior y un grupo N-alcanoilamino inferior-alcanoilamino inferior),

(40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo hidroxilo, un grupo hidroxilo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo carboxilo alquilo inferior, un grupo alquilo carbamoilo inferior-alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi inferior, un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo benzoilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanoilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior y un grupo benzoilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 (más preferiblemente de 1 a 2) grupos alquilo inferior como un sustituyente), 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 un único grupo alquilo inferior como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridil alcoxi inferior, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un único grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenil alcoxi inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el 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 el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior y un grupo hidroxilo), un grupo feniloxi (que puede tener en el grupo fenilo 1 a 3 grupos (preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el 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 fenil alquilo inferior (que puede tener en el grupo fenilo 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el 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 entre el 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 un sustituyente, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo hidroxilo alquilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener en el grupo amino de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior y un grupo benzoilo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo piperidil alquilo inferior, un grupo piperazinil alquilo inferior (que puede tener un único grupo alquilo inferior como un sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo amino alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino), un grupo feniloxi (que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituido con halógeno en el grupo fenilo), un grupo feniloxi alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos alcoxi inferior sustituido 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 un sustituyente, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanoilo inferior, un grupo hidroxilo alquilo inferior, un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo amino alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como un sustituyente en el grupo amino), un grupo piperidil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinil alquilo inferior, un grupo pirrolidinil alquilo inferior, un grupo 1,3-dioxolanil alquilo inferior, un grupo tetrahydrofuril alquilo inferior, un grupo piridil alquilo inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos fenilo como uno o más sustituyentes en el grupo alquilo inferior), un grupo imidazolil alquilo inferior, un grupo furil alquilo inferior, un grupo pirrolidinilcarbonil alquilo inferior, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 1) grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo ciano y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno como un sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo fenilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un

átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior), un grupo benzoilo, un grupo furil carbonilo, un grupo fenil alcoxycarbonilo inferior y un grupo oxo,

(43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,

5 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes (más preferiblemente 1 sustituyente) seleccionados entre el 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,

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

(48) un grupo tiazolidinil carbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente 1 grupo) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi inferior y un grupo ciano,

15 (49) un grupo azabiciclo[3,2,2]nonilcarbonilo,

(50) un grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos feniloxi sustituidos con halógeno o sin sustituir,

(51) un grupo indolinilcarbonilo,

(52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,

20 (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,

(54) un grupo morfolinil alquilo inferior,

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

(56) un grupo morfolinilcarbonil alquilo inferior,

25 (57) un grupo piperazinilcarbonil alquilo 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 amino alcoxi inferior (que puede tener de 1 a 2 (más preferiblemente 2) grupos alquilo inferior en el grupo amino),

30 (60) un grupo alcoxi inferior-alcoxi inferior,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilo inferior (más preferiblemente, un grupo piperazinilo sustituido con un único grupo oxo, un grupo piperazinilo sustituido con un único grupo alquilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un único grupo alcanóilo inferior, un grupo piperazinilo sustituido con un único grupo single oxo y un único grupo alcanóilo inferior, y un grupo piperazinilo sustituido con un único grupo oxo y un único grupo alcoxi carbonilo inferior),

35

(62) un grupo morfolinilo,

40 (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos (más preferiblemente de 1 a 2 grupos) seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,

(64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 (más preferiblemente 1) grupos piridilo,

(65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un grupo tioxo, y

(66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

45 En la fórmula general (1), R¹ es preferiblemente un grupo ciclohexilo. El anillo de cada uno de los grupos está sustituido preferiblemente con 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en:

- (1) un grupo alquilo inferior,
- (4) un grupo alcoxi inferior,
- (10) un grupo hidroxil inferior,
- 5 (17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alcoxi inferior carbonilo, un grupo alquilo sulfonilo inferior, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo carbamoilo inferior, un grupo amino alcanóilo inferior, un grupo alcanoilamino inferior-alcanóilo inferior y un grupo alcoxycarbonilamino inferior-alcanóilo inferior como uno o más sustituyentes,
- (21) un grupo alcoxycarbonilo inferior,
- 10 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) que se muestran a continuación:
- (i) un grupo alquilo inferior,
- (ii) un grupo alcoxi inferior,
- (iv) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior,
- 15 (xii) un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos alquilcarbonilo inferior,
- (xxi) un grupo piridil inferior,
- (29) un grupo amino alquilo inferior que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo inferior como uno o más sustituyentes en el grupo amino) en el grupo amino,
- 20 (30) un grupo alquilo inferior sustituido con un único grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior sustituido con halógeno,
- 25 (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo inferior,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (36) un grupo imidazolilo,
- 30 (39) un grupo piperidilo que puede tener un único sustituyente seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior, un grupo alquilo fenilsulfonilo inferior, un grupo oxo, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo N-alquilamino inferior, un grupo N-N di-alquilo amino inferior, un grupo N-alcanoilamino inferior, un grupo N-alquil inferior-N-alcoxycarbonilamino inferior, un grupo N-alquil inferior-N-alcanoilamino inferior y un grupo N-alcanoilamino inferior-alcanoilamino inferior,
- 35 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanóilo inferior y un grupo alcoxi inferior carbonilo, y
- (62) un grupo morfolinilo.

Ejemplo

40 En lo sucesivo en este documento, la presente invención se hará más clara con referencia a los Ejemplos de Referencia, los Ejemplos y los Ejemplos Farmacológicos Experimentales y los Ejemplos de Preparación.

Ejemplo de Referencia 1

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

45 Una mezcla que consiste en 14,4 g de 4-bromobenzo[b]tiofeno, 29,8 g de piperazina anhídrido, 9,3 g de t-butóxido sódico, 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 calentó a reflujo con calentamiento durante una hora en una atmósfera de nitrógeno. En la solución de reacción se vertió agua, 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 por cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol:amoníaco-agua 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.

- 5 Después, se añadieron 3,7 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de metanol de 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina, y el disolvente se evaporó a presión reducida. Al residuo obtenido se le añadió acetato de etilo y se obtuvieron cristales precipitados por filtración. La recristalización se realizó en metanol para obtener clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en forma de cristales similares a agujas incoloros.

Punto de fusión 276-280 °C

- 10 ^1H RMN (DMSO- Cl_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 a).

Ejemplo de Referencia 2

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

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

- 15 ^1H -RMN (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 = 8 Hz), 7,38 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,61 (1H, d, J = 8 Hz).

Ejemplo de Referencia 3

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

- 20 Se añadió ácido trifluoroacético (6 ml) a una solución de 1,22 g (3,7 mmol) de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metilpiperazin-1-carboxilato de terc-butilo en una solución de diclorometano (12 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y al residuo se le añadió una solución acuosa al 5% de carbonato potásico y la mezcla resultante se extrajo con diclorometano. La solución de extracción con diclorometano se secó sobre sulfato de magnesio y después de esto se concentró a presión reducida. Al residuo
- 25 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 diclorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metilpiperazina (0,98 g) en forma de un polvo de color pardo claro.

^1H -RMN (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, a), 7,38 (1H, dd, J = 8 Hz; J = 8 Hz), 7,5-8,0 (3H, m), 9,4-10,1 (2H, m).

- 30 Ejemplo de Referencia 4

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

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

- 35 ^1H RMN (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, a).

Ejemplo de Referencia 5

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

- 40 Se añadieron 5,05 g (19,8 mmol) de clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina a una solución acuosa de hidróxido sódico, y la mezcla se extrajo con diclorometano. La solución 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 se añadió acrilato de etilo (2,44 ml, 21,8 mmol) al mismo, y después la mezcla de reacción se calentó a reflujo con calentamiento durante 4 horas. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. Se
- 45 añadió diisopropil éter al residuo, se obtuvo una materia insoluble precipitada por filtración, se lavó con diisopropil éter y se secó para obtener 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo (5,26 g) en forma de un polvo de color blanco.

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

Ejemplo de Referencia 6

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

Se añadió hidruro de litio y aluminio (1,18 g, 24,8 mmol) a una solución de 5,26 g (16,5 mmol) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etilo en una solución en tetrahidrofurano (THF) (55 ml) en refrigeración con hielo, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. A la solución de reacción se le añadieron agua (1,2 ml), una solución acuosa al 15% de hidróxido sódico (1,2 ml) y agua (3,6 ml) en este orden, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. La materia insoluble se retiró por filtración, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 3:2 → acetato de etilo) y se concentró a 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 un polvo de color blanco.

- 5
10 ¹H-RMN (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 a), 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

- 15 Se suspendió 1,0 g (3,9 mmol) de clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina en 20 ml de dimetilformamida (DMF) y se añadieron carbonato potásico (1,3 g, 9,4 mmol) y acetato de 4-bromobutilo (0,7 ml, 4,8 mmol) a la misma. La mezcla de reacción se agitó a 80 °C durante 6 horas, se enfrió a temperatura ambiente, a la misma se le añadió agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato sódico y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol = 30:1) y se concentró a sequedad a presión reducida para obtener 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butil acetato (0,72 g) en forma de un aceite de color amarillo claro.

20 ¹H-RMN (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

- 30 Se añadió carbonato potásico (3,87 g, 28 mmol) a una solución de 7,76 g (23,3 mmol) de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butilo en una solución al 90% de metanol (150 ml). La mezcla de solución se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con diclorometano. La solución de extracción se secó sobre sulfato sódico y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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.

- 35 ¹H RMN(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 a), 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

- 40 Se suspendió 3,56 g (12,9 mmol) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol en 30 ml de diclorometano y a la misma se le añadieron tetracloruro de carbono (30 ml) y trifenil fosfina (4,06 g, 15,5 mmol). La mezcla se calentó a reflujo con calentamiento durante 3 horas. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y después a la misma se le añadieron metanol y diclorometano para homogeneizar la mezcla. A la solución se le añadió gel de Sílice (30 g), y el disolvente se evaporó a presión reducida. El residuo obtenido se cargó sobre una columna de gel de sílice (300 g) y se extrajo con un disolvente mezcla de n-hexano:acetato de etilo = 2:1. La solución 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.

45 ¹H-RMN (CDCl₃) 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

- 50 Síntesis de 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metilo

Se añadió gota a gota cloruro de tionilo (1,6 ml) a una solución en metanol (20 ml) de ácido 4-hidroxitiofeno-2-carboxílico (1,1 g, 7,6 mmol) en refrigeración con hielo. La mezcla de solución se calentó a reflujo con calentamiento

durante 5 horas. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua enfriada con hielo y se extrajo con acetato de etilo. La solución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 un polvo de color blanco.

^1H RMN (CDCl_3) δ ppm: 3,90 (3H, s), 5,50-6,60 (1H, a), 6,64 (1H, d, J = 1,9 Hz), 7,43 (1H, d, J = 1,8 Hz).

Ejemplo de Referencia 11

Síntesis de 6-hidroxipirimidina-4-carboxilato de etilo

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

^1H RMN (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, a).

Ejemplo de Referencia 12

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

Una solución en éter dietílico (35 ml) de acetileno dicarboxilato de dimetilo (5,0 g, 35 mmol) se enfrió con un medio de congelación (sal y hielo). A esta solución se le añadió gota a gota una solución en éter dietílico (15 ml) de metil hidrazina (0,63 ml, 35 mmol) mientras se mantuvo la temperatura a 0 °C o menor. Después de la finalización de la adición gota a gota, la solución se agitó a 0 °C durante una hora. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración y se lavó con éter dietílico. La torta de filtro se calentó a 130 °C durante 30 minutos y se enfrió a temperatura ambiente. A la torta se le añadió metanol, que se concentró a presión reducida. Al residuo obtenido se le añadió acetato de etilo y el residuo se concentró a presión reducida. Al residuo se le añadió acetato de etilo y la materia insoluble precipitada se obtuvo por 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 un polvo de color amarillo claro.

^1H RMN (DMSO-d_6) δ ppm: 3,58 (3H, s), 3,73 (3H, s), 5,77 (1H, s), 11,41 (1H, a).

Ejemplo de Referencia 13

Síntesis de 6-cloro-N-(2,2,2-trifluoroetil)nicotina amida

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

^1H RMN (CDCl_3) δ ppm: 4,15 (2H, dc, J = 6,5 Hz, 9,0 Hz), 6,35 (1H, a), 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-cloropiridina-2-carboxamida

Se añadieron 1-hidroxibenzotriazol (0,53 g, 3,5 mmol), clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,67 g, 3,5 mmol) y 2,2,2-trifluoroetil amina (0,51 ml, 6,35 mmol) a una solución en diclorometano (5 ml) de ácido 4-cloropiridina-2-carboxílico (0,5 g, 3,17 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. A la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con acetato de etilo. La solución de extracción con acetato de etilo se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 11:1 \rightarrow 5:1). El producto purificado se concentró a sequedad a presión reducida para obtener N-(2,2,2-trifluoroetil)-4-cloropiridina-2-carboxamida (435 mg) en forma de un polvo de color blanco.

^1H RMN (CDCl_3) δ ppm: 4,13 (2H, dc, J = 6,8 Hz, 9,0 Hz), 7,49 (1H, dd, J = 2,1 Hz, J = 5,3 Hz), 8,22 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 2,1 Hz), 8,30 (1H, a), 8,49 (1H, dd, J = 0,4 Hz, J = 5,3 Hz).

Ejemplo de Referencia 15

Síntesis de 2-clorotiazol-4-carboxamida

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

10 ^1H RMN (CDCl_3) δ ppm: 5,70 (1H, a), 7,01 (1H, a), 8,06 (1H, s).

Ejemplo de Referencia 16

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

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

15 ^1H RMN (CDCl_3) δ ppm: 3,00 (3H, d, J = 4,9 Hz), 5,92 (1H, a), 7,84 (1H, a).

Ejemplo de Referencia 17

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

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

25 ^1H RMN (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 a).

Ejemplo de Referencia 18

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

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

35 ^1H RMN (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 a).

Ejemplo de Referencia 19

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

40 El compuesto del título se obtuvo usando 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

^1H RMN (DMSO-d_6) δ ppm: 1,34 (3H, d, J = 6,8 Hz), 4,46 (1H, c, J = 6,8 Hz), 6,23-6,27 (1H, m), 6,33 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,70 (1H, d, J = 8,6 Hz), 9,11 (1H, s), 10,44 (1H, s a).

Ejemplo de Referencia 20

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

Se añadió cloruro de p-toluenosulfonilo (4,39 g, 23 mmol) a una solución en piridina (30 ml) de 4-(4-metoxifenil)piperidina (4,0 g, 21 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. A la mezcla de solución se le añadió agua, 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 por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 1:1). El producto purificado se concentró a sequedad a presión reducida para obtener 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonyl)piperidina (4,8 g) en forma de un polvo de color blanco.

- 5 ^1H RMN (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

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

Polvo de color pardo

^1H RMN (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 a), 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

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

Se añadió borohidruro sódico (0,28 g, 6,9 mmol) a una solución en THF (30 ml) de 5-bromo-2-hidroxi-3-metoxibenzaldehído (3,2 g 13,8 mmol) en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó a 0 °C durante 2 horas. A la solución de reacción se le añadió ácido acético para ajustar el pH a 3. A la mezcla de reacción se le añadió ácido clorhídrico al 10%, que después se extrajo con acetato de etilo. El material extraído se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 \rightarrow 1:1) y se concentró a sequedad a presión reducida para obtener 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol (3,23 g) en forma de un aceite de color amarillo claro.

^1H RMN (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

- 25 Síntesis de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximatobenzaldehído

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

^1H RMN (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).

- 35 Ejemplo de Referencia 24

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

Se añadieron 2-oxazolidinona (0,38 g, 4,36 mmol), dipaladiotris(dibencilidenoacetona) (0,17 g, 0,18 mmol), 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno (XANTPHOS) (0,32 g, 0,55 mmol) y carbonato de cesio (1,66 g, 5,1 mmol) a una solución en dioxano (20 ml) de 5-bromo-3-metoxi-2-metoximatobenzaldehído (1,0 g, 3,6 mmol) y la mezcla se agitó a 100 °C durante 24 horas en una atmósfera de argón. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a la misma se le añadió acetato de etilo. La mezcla se filtró por cerite. El filtrado se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 4:1 \rightarrow 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Al residuo se le añadieron acetato de etilo y diisopropil éter. La materia insoluble purificada de esta manera se obtuvo por filtración y se secó para obtener 3-metoxi-2-metoximatoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (0,5 g) en forma de un polvo de color blanco.

^1H RMN (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(1 H, s).

Ejemplo de Referencia 25

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

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

¹H RMN (CDCl₃) 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 solución en metanol (5 ml) de 3-(3-metoxi-4-metoximatoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (0,48 g, 1,79 mmol) y la mezcla se agitó a 50 °C durante 10 minutos. A la solución de reacción se le añadió agua, que se extrajo con acetato de etilo. El material extraído se secó sobre sulfato de magnesio, y después de esto se concentró a sequedad a presión reducida para obtener 3-(4-hidroxi-3-metoxi-5-metilfenil)oxazolidin-2-ona (434 mg) en forma de un polvo amarillo claro.

¹H RMN (CDCl₃) 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, a), 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 usando 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.

¹H RMN (CDCl₃) 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 solución 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 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 17 horas. A la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con diclorometano. El material extraído se secó sobre sulfato de magnesio, se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano:metanol: = 300:1 → 30:1). El producto purificado se concentró a sequedad a presión reducida para obtener 1-(4-hidroxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona (0,31 g) en forma de un polvo de color pardo claro.

¹H RMN (CDCl₃) 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, a), 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-metoximatoxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldehído

El compuesto del título se obtuvo usando 5-bromo-3-metoxi-2-metoximatoxi-benzaldehído y 2-pirrolidona de la misma manera que en el Ejemplo de Referencia 25.

¹H RMN (CDCl₃) 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-metoximatoxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldehído (0,72 g, 2,56 mmol) en una mezcla de disolvente de ácido acético (5 ml) y etanol (7 ml) y a la misma se le añadió paladio al 10% sobre carbono (70 mg) para realizar una reducción catalítica a 50 °C durante 10 horas. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró por cerite. La torta filtrada se concentró a presión reducida. El residuo obtenido de este modo se

5 disolvió en diclorometano (15 ml) y a la misma se le añadieron ácido trifluoroacético (2,0 ml, 25,6 mmol) y trietilsilano (2,0 ml, 12,8 mmol) en refrigeración con hielo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla se concentró a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 un aceite de color amarillo claro.

^1H RMN (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

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

^1H RMN (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

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

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

Polvo de color blanco

25 ^1H RMN (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 a).

Ejemplo de Referencia 33

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

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

^1H RMN (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 a).

Ejemplo de Referencia 34

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

El compuesto del título se obtuvo usando 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

40 ^1H RMN (DMSO-d_6) δ ppm: 4,18 (2H, s a), 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 a), 9,48 (1H, s a), 13,21 (1H, s a).

Ejemplo de Referencia 35

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

45 Se añadieron carbonato de cesio (2,08 g, 6,4 mmol) y 1-bromo-3-cloropropano (1,6 ml) a una solución en DMF (5 ml) de 5-hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (0,83 g, 5,3 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 21 horas. A la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La solución de reacción se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo =

100:1 → 4:1). El producto purificado se concentró a 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.

¹H RMN (CDCl₃) 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).

5 Ejemplo de Referencia 36

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

El compuesto del título se obtuvo usando 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.

Cristal similar a agujas de color pardo claro (etanol-n-hexano)

10 Punto de fusión: 119-120 °C

Ejemplo 1 (Referencia)

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

Se añadieron 5-(3-cloropropoxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,17 g, 5,0 mmol), clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il piperazina (1,35 g, 5,3 mmol), carbonato potásico (1,74, 12,6 mmol) y yoduro sódico (0,75 g, 5,0 mmol) a DMF (12 ml), y la mezcla se agitó a 80 °C durante 3 horas. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, a la misma se le añadió agua y después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 en reposo aún a temperatura ambiente para obtener una sustancia sólida, que se lavó con diisopropil éter y se secó para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,49 g).

Punto de fusión: 109,0-110,5 °C

MS 414 (M⁺)

25 Ejemplo 2 (Referencia)

Síntesis de ácido 5-[3-(9-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico

Se añadió una solución acuosa 6 N de hidróxido sódico (2 ml) a una solución en etanol (10 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (1,62 g, 3,9 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. Después, a la solución de reacción se le añadió ácido clorhídrico 6 N (2 ml) en refrigeración con hielo y la mezcla de solución se agitó. A la solución de reacción se le añadió diclorometano y el precipitado se obtuvo por filtración. El filtrado se separó y la fase orgánica se concentró a presión reducida. La torta de 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 un polvo de color blanco.

35 Punto de fusión: 114,5-118,0 °C

Ejemplo 3 (Referencia)

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

Una solución 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 mmol) se enfrió en hielo y a la misma se le añadieron trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmol), clorhidrato de metilamina (0,3 g, 4,5 mmol) y fosforocianidato de dietilo (DEPC) (0,25 ml, 1,4 mmol), y después, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. A la solución de reacción se le añadieron trietilamina (0,73 ml, 5,2 mmol), clorhidrato de metilamina (0,3 g, 4,5 mmol) y DEPC (0,25 ml, 1,4 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. A la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con acetato de etilo. El material extraído se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La solución se concentró a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo y al mismo se le añadió una solución 4 N de ácido clorhídrico/acetato de etilo. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración y se secó para obtener clorhidrato 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 un polvo de color blanco.

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

Ejemplo 4 (Referencia)

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

El compuesto del título se obtuvo usando 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.

5 Polvo de color blanco (acetato de etilo-diisopropil éter)

Punto de fusión: 186,5-188,5 °C

Ejemplo 5 (Referencia)

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

10 Se añadió hidruro sódico (55%, oleoso, 90 mg, 2,2 mmol) a una solución en DMF (2 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmol) y N-metil-2-clorotiazol-4-carboxamida (0,26 g, 1,45 mmol) en refrigeración con hielo y la solución se agitó a 80 °C durante 1,5 horas. Después, la solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente y a la misma se le añadió agua y se extrajo con acetato de etilo. La solución de extracción con acetato de etilo se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (diclorometano: acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo).

15 Después de que el producto purificado se concentrara a presión reducida, el residuo se disolvió en acetato de etilo. A la solución se le añadió una solución 4 N de ácido clorhídrico/acetato de etilo y la materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración y se secó para obtener clorhidrato de N-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]tiazol-4-carboxamida (0,24 g) en forma de un polvo de color amarillo claro.

Punto de fusión: 199,5-202,5 °C

20 Ejemplo 6 (Referencia)

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

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

25

30

Punto de fusión: 155,0-158,0 °C

MS 411 (M⁺)

Ejemplo 7 (Referencia)

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

35 Se añadió 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina (0,9 g, 2,2 mmol) a formiato de etilo (10 ml) y se calentó a reflujo con calentamiento durante 33 horas. Después de que la solución de reacción se enfriara a temperatura ambiente, se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). El producto purificado se concentró a presión reducida y se añadió una solución 4 N de ácido clorhídrico/acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración para obtener clorhidrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,3 g) en forma de un polvo de color blanco.

40

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

Ejemplo 8 (Referencia)

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

Se añadió una solución acuosa 6 N de clorhidrato sódico a clorhidrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}formamida (0,23 g, 0,48 mmol) y la mezcla de solución se extrajo con diclorometano. La solución de extracción con diclorometano se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se disolvió en una solución en tetrahidrofurano (THF) (5 ml) y a la misma se le añadió hidruro de

litio y aluminio (30 mg, 0,71 mmol) en refrigeración con hielo y se calentó a reflujo con calentamiento durante 15 minutos. La solución de reacción se enfrió en hielo, a la mezcla de reacción se le añadieron agua (0,03 ml), una solución acuosa al 15% de hidróxido sódico (0,03 ml) y agua (0,09 ml) en este orden y se agitó. La materia insoluble se retiró por filtración, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía

5 básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 3:1) y se concentró a presión reducida. Se añadió una solución 4 N de ácido clorhídrico/acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo, y la materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración para obtener clorhidrato de N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina (63 mg) en forma de un polvo de color blanco.

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

10 Ejemplo 9 (Referencia)

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

Se añadió hidruro sódico (55%, oleoso, 0,06 g, 1,3 mmol) a una solución en DMF (5 ml) de N-{4-(3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi)-3-metoxi-5-metilfenil}acetamida (0,45 g, 0,99 mmol) en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó a 0 °C durante 15 minutos. A la solución de reacción se le añadió yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmol) y la solución se agitó a 0 °C durante una hora. Además, a la solución de reacción se le añadieron hidruro sódico (oleoso al 55%, 0,06 g, 1,3 mmol) y yoduro de metilo (0,07 ml, 1,1 mmol) y la mezcla de solución se agitó a 0 °C durante 2

15 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y la extracción se realizó con acetato de etilo. El material extraído se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → acetato de etilo). Después de que el producto purificado se concentrara a presión reducida, se añadió una solución 4 N de ácido clorhídrico/acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración para obtener clorhidrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-N-metilacetamida (325 mg).

20

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

25 Ejemplo 10 (Referencia)

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

Se añadieron formalina (37%, 0,29 ml, 3,9 mmol) y cianoborohidruro sódico (0,21 g, 3,1 mmol) a una solución en metanol (6 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilnilina (0,32 g, 0,78 mmol) en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó a 0 °C durante 15 minutos. A la solución de reacción se le añadió ácido acético (0,18 ml, 3,1 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. A la solución de reacción se le añadió una solución acuosa de carbonato potásico en refrigeración con hielo y la extracción se realizó con acetato de etilo. El material extraído se secó sobre sulfato de magnesio. La solución de reacción se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano :acetato de etilo = 11:1 → 3:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Se añadió una solución 4 N de ácido

30 clorhídrico y acetato de etilo a una solución en acetato de etilo del residuo y la materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración para obtener clorhidrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N,N-dimetil-3-metoxi-5-metilnilina (137 mg) en forma de un polvo de color blanco.

35

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

Ejemplo 11 (Referencia)

40 Síntesis de clorhidrato 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 mmol) en THF (20 ml). A esta solución se le añadió gota a gota una solución 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 mmol) en una atmósfera de argón. Después de la finalización de la adición gota a gota, la mezcla de solución se calentó a reflujo con calentamiento durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadieron agua (0,1 ml), una solución acuosa al 15% de hidróxido sódico (0,1 ml) y agua (0,3 ml) en refrigeración con hielo y se agitó. La materia insoluble se retiró por filtración de cerite, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre 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 al mismo se le añadió una solución (0,34 ml) 1 N de ácido clorhídrico/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó para obtener clorhidrato 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.

45

50

Punto de fusión 207,9-208,8 °C

Ejemplo 12 (Referencia)

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

Se añadieron formalina (37%, 0,22 ml, 2,7 mmol) y MP-cianoborohidruro (2,41 mmol/g, 1,12 g, 2,7 mmol) a una solución en metanol (15 ml) de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,30 g, 0,67 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. La materia insoluble se retiró por filtración y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre 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 al mismo se le añadió una solución (0,64 ml) 1 N de ácido clorhídrico/etanol. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó para obtener clorhidrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,23 g) en forma de un sólido de color pardo claro.

Punto de fusión: 248,1-249,6 °C

Ejemplo 13 (Referencia)

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

Una solución en THF (20 ml) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metilquinazolina (0,25 g,

0,58 mmol) se enfrió en hielo. A esta solución se le añadió gota a gota una solución en THF (5 ml) de hidruro de litio y aluminio (26 mg, 0,69 mmol) en una atmósfera de argón. Después de la finalización de la adición gota a gota, la solución se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos y se calentó a reflujo con calentamiento durante una hora. A la solución de reacción se le añadieron agua (0,03 ml), una solución acuosa al 15% de hidróxido sódico (0,03 ml) y agua (0,1 ml) en refrigeración con hielo y se agitó. La materia insoluble se retiró por filtración de cerite, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna sobre 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 éste se le añadió una solución (0,189 ml) 1 N de ácido clorhídrico/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó para obtener clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahydroquinazolin-4-ol (87 mg) en forma de un sólido de color blanco.

MS: 438 (M⁺).

Una solución de elución de diclorometano/metanol (10:1) se pasó a través de la columna de la cromatografía en columna sobre gel de sílice. El eluato obtenido se concentró a presión reducida y después el residuo se disolvió en acetato de etilo (5 ml). A éste se le añadió una solución (0,226 ml) 1 N de ácido clorhídrico/etanol y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó para obtener clorhidrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metil-1,2,3,4-tetrahydroquinazolina (49 mg) en forma de un sólido de color blanco.

Punto de fusión: 203,1-204,4 °C

Ejemplo 14 (Referencia)

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

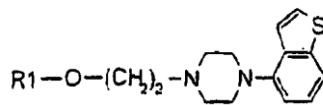
Se añadió trietilsilano (1,14 ml, 7,14 mmol) a una solución en ácido trifluoroacético (5 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-indol (228 mg, 0,71 mmol) y la mezcla se agitó a 50 °C durante 2 horas. La mezcla se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en diclorometano, se neutralizó por una solución saturada acuosa de hidrogenocarbonato sódico y se separó. La fase orgánica se lavó con una solución saturada acuosa de hidrogenocarbonato sódico, agua y una solución salina saturada en este orden y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida, el residuo se añadió a acetato de etilo (5 ml), al mismo se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol (0,10 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. La materia insoluble precipitada se obtuvo por filtración, se lavó con acetato de etilo y se secó para obtener clorhidrato 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.

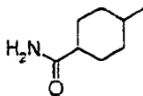
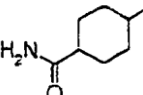
Punto de fusión: 222,4-223,9 °C

Los compuestos enumerados en las siguientes Tablas 1 a 14 se produjeron usando sustancias de partida apropiadas de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia 1 a 36 o los Ejemplos 1 a 14 y 195 a 211.

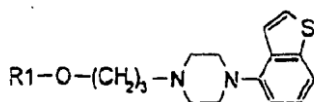
En las siguientes Tablas, los compuestos con las propiedades físicas, tales como forma cristalina, p.f. (punto de fusión, sal, ¹H RMN y MS (espectro de masas), se prepararon realmente.

[Tabla 1]

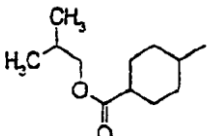
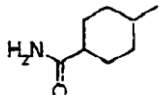
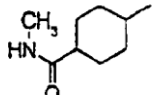


| Ejemplo | R1 | Forma cristalina (Disolvente de recristalización) | Punto de fusión (°C) | Sal |
|---------|---|---|----------------------|-----|
| 15 |  | Polvo de color blanco (Etanol/acetato de etilo) | 166,0-171,0 | - |
| 16 |  | Polvo de color blanco (Acetato de etilo/isopropil éter) | 138,5-141,0 | - |

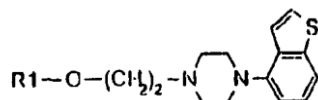
[Tabla 2]

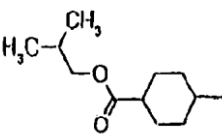


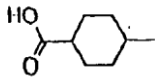
5

| Ejemplo | R1 | Forma cristalina (Disolvente de recristalización) | Punto de fusión (°C) | Sal |
|---------|---|---|----------------------|-------------|
| 17 |  | Polvo de color blanco (Acetato de etilo) | 199,0-201,5 | clorhidrato |
| 18 |  | Polvo de color blanco (Acetato de etilo/isopropil éter) | 107,5-108,5 | - |
| 19 |  | Polvo de color blanco (Acetato de etilo/isopropil éter) | 110,0-112,0 | - |

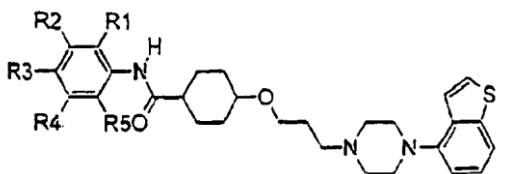
[Tabla 3]



| Ejemplo | R1 | H-RMN |
|---------|---|---|
| 20 |  | ¹ H RMN (CDCl ₃) δ ppm: 0,93 (6H, d, J = 6,7 Hz), 1,41-1,75 (5H, m), 1,75-2,02 (4H, m), 2,23-7,48 (1H, m), 2,65-2,87 (6H, m), 3,06-3,25(4H, m), 3,42-3,54 (1H, m), 3,62 (2H, t, J = 6,2 Hz), 3,85 (2H, d, J = 6,5 Hz), 6,89 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,34 (1H, m), 7-34-7,46 (2H, m), 7,54 (1H, d, J = 8,0 Hz). |

| | | |
|----|---|--|
| 21 |  | ¹ H RMN (CDCl ₃) δ ppm: 1,41-1,75 (4H, m), 1,75-2,01 (4H, m), 2,18-2,44 (1H, m), 2,72-3,04 (6H, m), 3,14-3,31 (4H, m), 3,44-3,54 (1H, m), 3,64 (2H, t, J = 6,0 Hz), 6,88 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,31 (1H, m), 7,31-7,44 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz). |
|----|---|--|

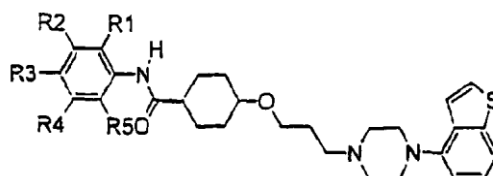
[Tabla 4]



| Ejemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS (M+1) |
|---------|--|---|-------------------------------------|----------------------------------|-------------------|----------|
| 22 | -H | -H | -OCF ₃ | -H | -H | 562 |
| 23 | -H | -H | -OCH ₃ | -H | -H | 508 |
| 24 | -H | -OCH ₃ | -H | -H | -H | 508 |
| 25 | -OCH ₃ | -H | -OCH ₃ | -H | -H | 538 |
| 26 | -H | -OCH ₃ | -H | -H | -OCH ₃ | 538 |
| 27 | -H | -OCH ₃ | -H | -OCH ₃ | -H | 538 |
| 28 | -H | -NHCOCH ₃ | -H | -H | -OCH ₃ | 565 |
| 29 | -H | -OCH ₃ | -OCH ₃ | -H | -H | 538 |
| 30 | -H | -H | -N(CH ₃) ₂ | -H | -H | 521 |
| 31 | -H | -COCH ₃ | -H | -H | -H | 520 |
| 32 | -H | -NHCOCH ₃ | -H | -H | -H | 535 |
| 33 | -H | -H | -NHCOCH ₃ | -H | -H | 535 |
| 34 | -H | -H | -H | -CN | -H | 503 |
| 35 | -H | -CO ₂ CH ₃ | -H | -H | -OCH ₃ | 566 |
| 36 | -H | -H | -OC ₂ H ₅ | -H | -H | 570 |
| 37 | -H | -CO ₂ CH ₃ | -H | -CO ₂ CH ₃ | -H | 594 |
| 38 | -OCH ₃ | -OCH ₃ | -H | -H | -H | 538 |
| 39 | -H | -Cl | -OH | -H | -H | 528 |
| 40 | -CO ₂ C ₂ H ₅ | -H | -H | -H | -Cl | 584 |
| 41 | -H | -H | -CN | -H | -H | 503 |
| 42 | -H | -OCH ₂ C ₂ H ₅ | -H | -H | -H | 584 |
| 43 | -H | -H | -NHCO ₂ CH ₃ | -H | -H | 571 |
| 44 | -H | -H | -CONHC ₆ H ₅ | -H | -H | 597 |
| 45 | -H | -H | -CONHCH ₃ | -H | -H | 535 |
| 46 | -H | -H | -NHC ₆ H ₅ | -H | -H | 569 |
| 47 | -H | -H | -CH ₂ CH ₂ OH | -H | -H | 522 |

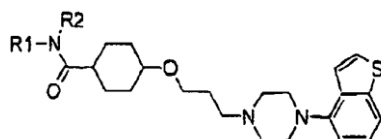
| Ejemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS (M+1) |
|---------|----------------------|----------------------|-------|----|----|----------|
| 48 | -H | -H | -C≡CH | -H | -H | 502 |
| 49 | -NHCOCH ₃ | -H | -H | -H | -H | 525 |
| 50 | -H | -CONHCH ₃ | -H | -H | -H | 535 |

[Tabla 5]



| Ejemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS (M+1) |
|---------|----|----|----|----|----|----------|
| 51 | -H | -H | | -H | -H | 561 |
| 52 | -H | -H | | -H | -H | 607 |
| 53 | -H | | -H | -H | -H | 589 |
| 54 | -H | | -H | -H | -H | 545 |

[Tabla 6]

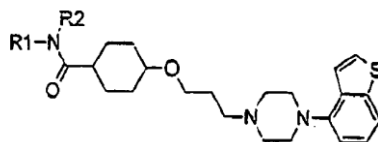


| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|--|--|----------|
| 55 | -CH ₃ | -ciclo-C ₆ H ₁₁ | 498 |
| 56 | -ciclo-C ₆ H ₁₁ | -H | 484 |
| 57 | -C ₄ H ₉ | -C ₄ H ₉ | 514 |
| 58 | -CH ₂ CH(CH ₃) ₂ | -CH ₂ CH(CH ₃) ₂ | 514 |
| 59 | -CH ₂ CH ₂ OH | -CH ₂ CH ₂ OH | 490 |
| 60 | -C ₂ H ₅ | -CH ₂ CH ₂ OH | 474 |
| 61 | -CH ₂ CH ₂ OH | -ciclo-C ₆ H ₁₁ | 528 |
| 62 | -CH ₂ CH ₂ OCH ₃ | -CH ₂ CH ₂ OCH ₃ | 518 |

ES 2 383 949 T3

| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|--|---|----------|
| 63 | -C ₃ H ₇ | -CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅ | 498 |
| 64 | -ciclo-C ₅ H ₈ | -CH ₂ CH=CH ₂ | 510 |
| 65 | -C ₂ H ₅ | -C ₂ H ₅ | 458 |
| 66 | -C ₄ H ₉ | -H | 458 |
| 67 | -C(CH ₃) ₂ | -H | 458 |
| 68 | -ciclo-C ₃ H ₅ | -H | 442 |
| 69 | -C ₂ H ₅ | -H | 430 |
| 70 | -CH ₂ CH ₂ OCH ₃ | -H | 460 |
| 71 | -C ₄ H ₉ | -C ₂ H ₅ | 486 |
| 72 | -CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅ | -H | 474 |
| 73 | -(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅ | -H | 488 |
| 74 | -ciclo- C ₅ H ₈ | -H | 470 |
| 75 | -CH ₂ -ciclo- C ₃ H ₅ | -H | 456 |
| 76 | -CH ₂ -ciclo- C ₆ H ₁₁ | -H | 498 |
| 77 | -(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃ | -H | 487 |
| 78 | -(CH ₂) ₅ OH | -H | 488 |
| 79 | -CH ₂ CONH ₂ | -H | 459 |
| 80 | -CH ₂ C=CH | -H | 440 |
| 81 | -CH ₃ | -CH(CH ₃) ₂ | 458 |
| 82 | -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂ | -H | 472 |
| 83 | -CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃ | -H | 486 |
| 84 | -CH ₂ C(CH ₃) ₃ | -H | 472 |
| 85 | -CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂ | -H | 486 |
| 86 | -CH (CONH ₂) ₂ | -H | 502 |
| 87 | -CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅ | -CH ₃ | 470 |
| 88 | -CH (CONH ₂) ₂ | -H | 499 |

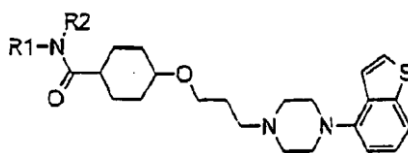
[Tabla 7]



| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|------------------|----------|
| 89 | -CH ₃ | -CH ₃ | 430 |
| 90 | -(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂ | -H | 502 |

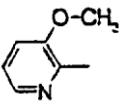
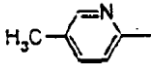


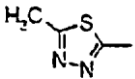

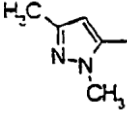
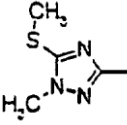
| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|----|----------|
| 91 | -CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃ | -H | 486 |
| 92 | -CH(C ₂ H ₅) ₂ | -H | 472 |
| 93 | -CH ₂ CN | -H | 441 |
| 94 | -(CH ₂) ₃ OCH ₃ | -H | 474 |
| 95 | -(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂ | -H | 488 |
| 96 | -CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃ | -H | 488 |
| 97 | -CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃ | -H | 474 |
| 98 | -CH ₂ CH ₂ F | -H | 448 |
| 99 | -CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH | -H | 476 |
| 100 | -CH ₂ CONHCH ₃ | -H | 473 |
| 101 | -(CH ₂) ₂ SCH ₃ | -H | 476 |
| 102 | -CH ₂ CH ₂ OH | -H | 446 |
| 103 | -CH ₂ CH F ₂ | -H | 466 |
| 104 | -C ₆ H ₁₃ | -H | 486 |
| 105 | -CH ₂ CH ₂ NHCONH ₂ | -H | 488 |

[Tabla 8]

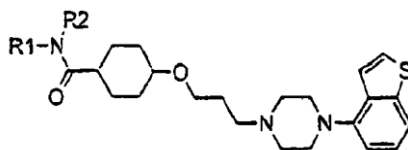


| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|----|------------------|----------|
| 106 | | -CH ₃ | 508 |
| 107 | | -H | 479 |
| 108 | | -H | 479 |
| 109 | | -H | 479 |
| 110 | | -H | 493 |

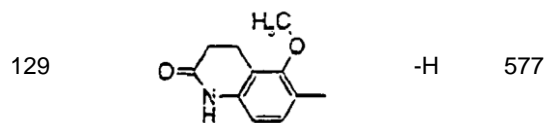
ES 2 383 949 T3

| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|----|----------|
| 111 |  | -H | 509 |
| 112 |  | -H | 493 |
| 113 |  | -H | 485 |
| 114 |  | -H | 486 |
| 115 |  | -H | 500 |
| 116 |  | -H | 470 |
| 117 |  | -H | 496 |
| 118 |  | -H | 529 |

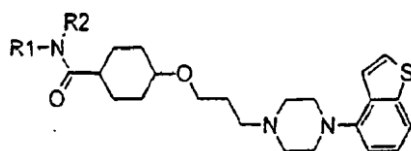
[Tabla 9]

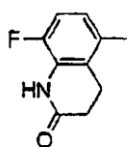
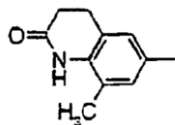

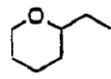
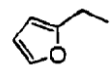

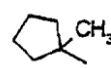
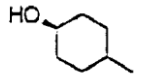
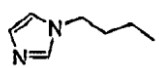
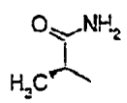



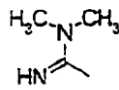
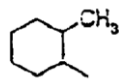
| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M-M) |
|---------|----|----|----------|
| 119 | | -H | 511 |
| 120 | | -H | 469 |
| 121 | | -H | 518 |
| 122 | | -H | 517 |
| 123 | | -H | 533 |
| 124 | | -H | 518 |
| 125 | | -H | 551 |
| 126 | | -H | 529 |
| 127 | | -H | 529 |
| 128 | | -H | 543 |



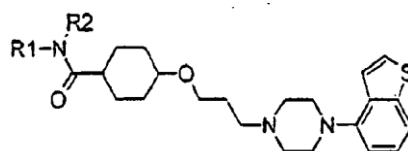
[Tabla 10]

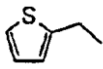
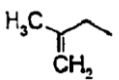
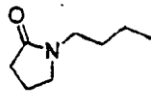
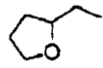
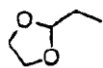
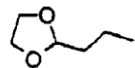
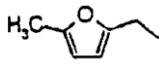
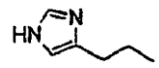



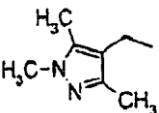
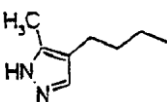
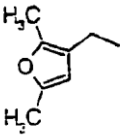
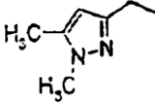
| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|--------------------------------|----------|
| 130 |  | -H | 565 |
| 131 |  | -H | 561 |
| 132 |  | -H | 444 |
| 133 |  | -C ₂ H ₅ | 528 |
| 134 |  | -H | 482 |
| 135 |  | -H | 456 |
| 136 |  | -H | 484 |
| 137 |  | -H | 500 |
| 138 |  | -H | 510 |
| 139 |  | -H | 473 |

| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|----|----------|
| 140 |  | -H | 487 |
| 141 |  | -H | 472 |
| 142 |  | -H | 498 |

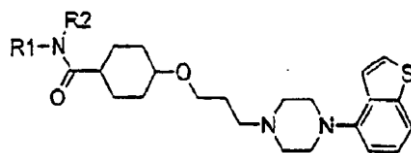
[Tabla 11]

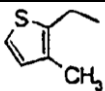
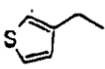
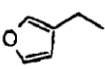
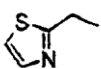
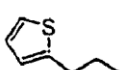


| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|--------------------------------|----------|
| 143 |  | -H | 498 |
| 144 |  | -C ₂ H ₅ | 484 |
| 145 |  | -H | 527 |
| 146 |  | -H | 486 |
| 147 |  | -H | 488 |
| 148 |  | -H | 502 |
| 149 |  | -H | 496 |
| 160 |  | -H | 496 |

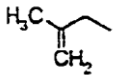
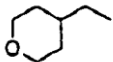

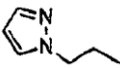

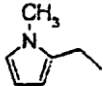
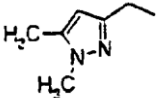
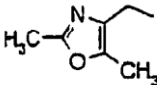
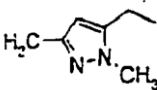
| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|--|----|----------|
| 151 |  | -H | 495 |
| 152 |  | -H | 524 |
| 153 |  | -H | 524 |
| 154 |  | -H | 510 |
| 155 |  | -H | 510 |

[Tabla 12]

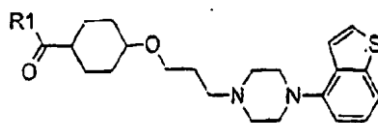


| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|----|----------|
| 156 |  | -H | 512 |
| 157 |  | -H | 498 |
| 158 |  | -H | 482 |
| 159 |  | -H | 499 |
| 160 |  | -H | 512 |


ES 2 383 949 T3

| Ejemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---------|---|------------------|----------|
| 161 |  | -H | 456 |
| 162 |  | -H | 500 |
| 163 |  | -H | 482 |
| 164 |  | -H | 496 |
| 165 |  | -H | 486 |
| 166 |  | -CH ₃ | 510 |
| 167 |  | -CF ₃ | 524 |
| 168 |  | -CH ₃ | 525 |
| 169 |  | -H | 510 |

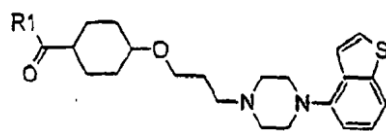
[Tabla 13]

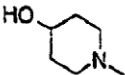
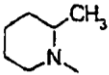

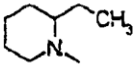
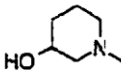
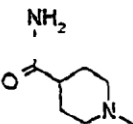
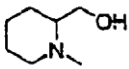
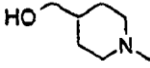
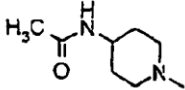
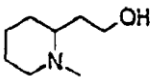


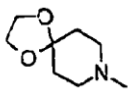
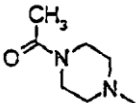
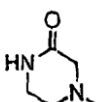
| Ejemplo | R1 | MS (M+1) |
|---------|----|----------|
| 170 | | 456 |
| 171 | | 486 |
| 172 | | 499 |
| 173 | | 472 |
| 174 | | 513 |
| 175 | | 482 |
| 176 | | 474 |
| 177 | | 488 |
| 178 | | 472 |
| 179 | | 500 |
| 180 | | 498 |

| Ejemplo | R1 | MS (M+1) |
|---------|---|----------|
| 181 |  | 470 |

[Tabla 14]



| Ejemplo | R1 | MS (M+1) |
|---------|---|----------|
| 182 |  | 486 |
| 183 |  | 484 |
| 184 |  | 484 |
| 185 |  | 498 |
| 186 |  | 486 |
| 187 |  | 513 |
| 188 |  | 500 |
| 189 |  | 500 |
| 190 |  | 527 |
| 191 |  | 514 |

| Ejemplo | R1 | MS (M+1) |
|---------|---|----------|
| 192 |  | 528 |
| 193 |  | 513 |
| 194 |  | 485 |

Ejemplo 195 (Referencia)

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

Se añadió paladio al 5% sobre carbono (0,8 g) a una solución en etanol (30 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-N-etil-3-nitrobenzamida (1,0 g, 2,1 mmol) y la mezcla se sometió a reducción catalítica a temperatura ambiente a presión normal. El catalizador se retiró por filtración y el filtrado se concentró a presión reducida. Al residuo se le añadió agua y la solución se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 del 83%) en forma de un sólido amorfo de color amarillo.

¹H RMN (CDCl₃) 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 a), 3,21 (4H, s a), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, a), 4,13 (2H, t, J = 6,5 Hz), 5,99 (1H, s a), 6,80 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 2,1, 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo 196 Referencia

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

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

Punto de fusión: 208-210 °C

Ejemplo 197 (Referencia)

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

Se añadieron PS-trifenilfosfina (3 mmol/g, 1,80 g), azodicarboxilato de diterc-butilo (1,27 g, 5,4 mmol) y N-hidroxisuccinimida (510 mg, 4,3 mmol) a una solución en THF (50 ml) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (1,00 g, 3,6 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La resina se retiró por filtración y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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 del 47%). Se disolvieron 157 mg del sólido amorfo de color blanco en etanol. A la solución se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico-etanol (0,42 ml) y se añadió más cantidad de éter. La solución se mantuvo en reposo en un refrigerador. El cristal producido se filtró y se secó para obtener clorhidrato de 1-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-pirrolidina-2,5-diona (158 mg) en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión: 255,0-257,0 °C

Ejemplo 198 (Referencia)

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

- 5 Se añadieron trietilamina (0,24 ml, 1,7 mmol) y cloroformiato de isobutilo (0,19 ml, 1,4 mmol) a una solución 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 mmol) en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó durante 20 minutos. A la solución de reacción se le añadió amoniaco-agua al 28% (0,5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. A la solución de reacción se le añadió acetato de etilo y la solución se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía
- 10 básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en un disolvente mezcla de acetato de etilo-diisopropiléter para obtener la amida del ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-naftaleno-1-carboxílico (0,27 g, rendimiento del 53%) en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión 167,0-169,0 °C

- 15 Ejemplo 199 (Referencia)

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

- 20 Se añadió una solución al 40% de metilamina metanol (5 ml) a una solución en metanol (5 ml) de éster etílico del ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,5 g, 1,1 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. La solución se concentró a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 5:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en un disolvente mezcla de acetato de etilo-diisopropiléter para obtener metilamina del ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,32 g, rendimiento del 57%) en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión 138,5-140,5 °C

- 25 Ejemplo 200

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

- 30 Se añadieron amoniaco-agua (28%, 0,5 ml), clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC) (0,36 g, 1,9 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (DMAP) (0,05 g, 0,4 mmol) a una solución en diclorometano (10 ml) de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexanocarboxílico (0,5 g, 1,2 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 19 horas. A la solución 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 esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 3:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se recrystalizó en un disolvente mezcla de acetato de etilo-diisopropiléter para obtener amida del ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-ciclohexano-carboxílico (0,1 g, rendimiento del 22%), en forma de un polvo de color blanco.
- 35

Punto de fusión 107,5-108,5 °C

Ejemplo 201 (Referencia)

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

- 40 Una solución en diclorometano (4 ml) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenilamina (0,2 g, 0,49 mmol) se enfrió en hielo. A ésta se le añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmol) y sulfonilcloruro de etano (0,07 ml, 0,73 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Además, se añadieron N-etildiisopropilamina (0,15 ml, 0,87 mmol) y sulfonilcloruro de etano (0,07 ml, 0,73 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 19 horas. A ésta se le añadieron una solución acuosa 6 N de hidróxido sódico (0,5 ml) y etanol (2 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. A la solución de reacción se le añadió diclorometano, que después se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a presión reducida. Al residuo se le añadió una solución 4 N de clorhidrato/acetato de etilo. El cristal generado se filtró y se secó para obtener clorhidrato de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metil-fenil}amida del ácido etanosulfónico (222 mg, rendimiento del 85%) en forma de un polvo de color blanco.
- 50

Punto de fusión: 235,5-237,5 °C

Ejemplo 202 (Referencia)

Síntesis de éster metílico del ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-carbámico

5 Una solución en diclorometano (2 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxil-1-metil-1H-pirazol-3-il-
amina (0,17 g, 0,47 mmol) se enfrió en hielo. A ésta se le añadieron piridina (0,08 ml, 0,94 mmol) y cloroformiato de
metilo (0,04 ml, 0,52 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 17 horas. A la solución de reacción
se le añadió acetato de etilo y la mezcla de reacción se lavó con agua. La capa de agua se extrajo con acetato de
10 etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro, y después de esto, se
concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (n-
hexano:acetato de etilo = 2:1 → 1:1). El producto purificado se concentró a presión reducida y el residuo se
recristalizó en un disolvente mezcla de acetato de etilo-diisopropiléter para obtener éster metílico del ácido 5-[3-(4-
benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}carbámico (0,10 g, rendimiento del 51%) en forma de
un polvo de color blanco.

Punto de fusión: 162,5-165,0 °C.

15 Ejemplo 203 (Referencia)

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

20 Una solución 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 mmol) se enfrió en hielo. A ésta se le añadieron trietilamina (0,36 ml, 2,5 mmol), cloruro de
dimetilcarbamoilo, (0,20 ml, 2,1 mmol) y piridina (0,06 ml, 0,73 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente
durante una noche. A la solución de reacción se le añadió agua y la solución de reacción se extrajo con acetato de
etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión
reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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 se
añadió una solución 4 N de clorhidrato/acetato de etilo al mismo. El cristal producido se filtró y se secó para obtener
25 clorhidrato 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 del 30%), en forma de un polvo de color amarillo claro.

Punto de fusión: 174,0-176,5 °C

Ejemplo 204 (Referencia)

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

30 Se añadió una solución acuosa de dimetilamina (50%, 0,16 ml, 1,6 mmol) a una solución en DMF (3 ml) de fenil
éster del 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 mmol) y
la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. A la solución de reacción se le añadió agua, que
después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de
esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice
35 (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 solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol y el cristal producido se filtró y se
secó para obtener clorhidrato 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 del 37%) en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión: 186,0-187,5 °C

40 Ejemplo 205 (Referencia)

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

45 Se añadieron anhídrido acético (1 ml) y trietilamina (0,09 ml, 0,65 mmol) a una solución en diclorometano (4 ml) de
5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,20 g, 0,54 mmol) y la mezcla se
agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. A la solución de reacción se le añadió una solución acuosa de
carbonato potásico, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de
magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía
básica en columna sobre gel de sílice (n-hexano:acetato de etilo = 2:1 → 0:1). El producto purificado se concentró a
presión reducida y el residuo se recristalizó en un disolvente mezcla de acetato de etilo-diisopropiléter para obtener
50 N-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}acetamida (0,19 g, rendimiento del 89%)
en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión: 137,0-139,0 °C

Ejemplo 206 (Referencia)

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

En primer lugar, se añadió clorhidrato de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldehído (1,28 g, 2,4 mmol) a una solución acuosa de clorhidrato potásico. La mezcla se extrajo con diclorometano. La solución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (15 ml). A la solución se le añadió borohidruro sódico (0,05 g, 1,2 mmol) en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Después, a la mezcla se le añadió ácido clorhídrico al 10% en refrigeración con hielo para descomponer el reactivo excesivo presente. Después a la solución se le añadió una solución acuosa 6 N de hidróxido sódico para convertirla en una solución alcalina, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 éste se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol. El cristal producido se recrystalizó en etanol para obtener clorhidrato 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 del 41%) en forma de un polvo de color blanco.

Punto de fusión: 224,0-226,5 °C (descompuesto)

Ejemplo 207 (Referencia)

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

Se añadieron clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-bromo-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]piperazina (0,5 g, 0,98 mmol), 1-acetil piperazina (0,15 g, 1,2 mmol), acetato de paladio (11 mg, 0,048 mmol), 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) (63 mg, 0,098 mmol) y t-butóxido sódico (0,23 g, 2,3 mmol) a tolueno (10 ml) y la mezcla se agitó en una atmósfera de argón a 90 °C durante 22 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró por cerite. La torta de filtro se lavó con acetato de etilo. El filtrado y el líquido lavado se combinaron y después de esto se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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 éste se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol y el cristal producido se filtró y se secó para obtener clorhidrato de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-metoxi-5-metilfenil}-piperazina (75 mg, rendimiento del 14%) en forma de un polvo de color blanco.

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

30 Ejemplo 208 (Referencia)

Síntesis de clorhidrato 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-yodo-2-metoxi-6-metil-fenoxi)-propil]-piperazina (0,6 g, 0,69 mmol), imidazol (0,07 g, 1,03 mmol), yoduro de cobre (I) (13 mg, 0,069 mmol), trans-N,N'-dimetil-1,2-ciclohexanodiamina (0,02 ml, 0,14 mmol) y carbonato de cesio (0,47 g, 1,38 mmol) a 1,4-dioxano (6 ml) y la mezcla se calentó a reflujo con calentamiento en una atmósfera de argón durante 50 horas. Después de que la mezcla de reacción resultante se enfriara a temperatura ambiente, a la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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 éste se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol y el cristal producido se filtró y se secó para obtener clorhidrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metoxi-6-metilfenoxi)propil]-piperazina (60 mg, rendimiento del 17%) en forma de un polvo de color amarillo claro.

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

Ejemplo 209 (Referencia)

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

Se añadieron carbonato de cesio (0,34 g, 0,99 mmol) y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,05 ml, 0,47 mmol) a una solución en DMF (2 ml) de 4-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-hidroxi-5,N-dimetilbenzamida (188 mg, 0,39 mmol), y la mezcla se agitó a 40 °C durante 2 horas. Después, se añadió más cantidad de 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano (0,1 ml, 0,94 mmol) y la mezcla se agitó a 40 °C durante 5 horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriara a temperatura ambiente, a la solución de reacción se le añadió agua, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía básica en columna sobre gel de sílice (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. A éste se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol y después de esto se concentró a presión reducida. El

residuo se recrystalizó en un disolvente mezcla de alcohol isopropílico/acetato de etilo para obtener clorhidrato de 4-[3-(4-benzo[b]-tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-trifluoro-etoxi)benzamida (88 mg, rendimiento del 40%) en forma de un polvo de color amarillo claro.

Punto de fusión: 156,0-357,5 °C

5 Ejemplo 210 (Referencia)

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

Se añadió clorhidrato de metoxi metilamida del ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,61 g, 1,3 mmol) a una solución acuosa de hidróxido sódico y la mezcla de solución se extrajo con diclorometano. La solución extraída se concentró a presión reducida y el residuo se disolvió en THF (12 ml). La solución se enfrió a -78 °C y a la misma se le añadió una solución 1 N de metil litio éter (1,2 ml) y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 2 horas. A la solución de reacción se le añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y la solución se calentó a temperatura ambiente. A la solución se le añadió cloruro potásico, que después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 éste se le añadió una solución 1 N de ácido clorhídrico/etanol y el cristal producido se recrystalizó en etanol que contenía agua para obtener clorhidrato 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 del 40%) en forma de un polvo de color blanco.

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

20 Ejemplo 211 (Referencia)

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

Una solución en THF (8 ml) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propoxi]-3-(terc-butil-dimetilsilaniloximetil)-1-metil-1H-pirazol (0,75 g, 1,5 mmol) se enfrió en hielo y a la misma se le añadió una solución 1 M en THF de fluoruro de tetrabutil amonio (1,7 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. A la solución de reacción se le añadió acetato de etilo, que se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después de esto se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre 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 un disolvente mezcla de acetato de etilo y diisopropil éter para obtener 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propoxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol (0,46 g, rendimiento del 79%) en forma de un polvo de color blanco.

Temperatura de fusión: 123,5-126,0 °C.

Ensayo farmacológico 1

1) Ensayo de unión al receptor de dopamina D₂

El ensayo 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-raclopride. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259).

Se decapitaron ratas macho Wistar, recuperando inmediatamente el cerebro y se extirpó el cuerpo estriado. Este se homogeneizó en un volumen de tampón tris(hidroximetil)aminometano (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) de 50 veces del peso del tejido usando un homogeneizador con una cuchilla rotatoria a alta velocidad y se centrifugó a 4 °C, 48.000 x g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen 50 veces del peso del tejido y después se incubó a 37 °C durante 10 minutos, se centrifugó en el estado descrito anteriormente. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (que contenía NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl₂ 2 mM, MgCl₂ 1 mM, pH 7,4) de un volumen 25 veces del peso del tejido y se conservó como un espécimen de membrana, congelando a -85 °C hasta que se usó para realizar el ensayo de unión.

El ensayo de unión se realizó usando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de [³H]-raclopride (concentración final de 1 a 2 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (que contenía NaCl 120 mM, KCl 5 mM, CaCl₂ 2 mM, MgCl₂ 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total era de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido al 1%). La reacción se realizó a temperatura ambiente durante 1 hora y concluyó realizando filtración por succión con un colector de células sobre una placa de filtro de fibra de vidrio. La placa de filtro fabricada de fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) y después se secó, se añadió un cóctel de centelleo líquido a la microplaca y se midió la radioactividad con un contador de centelleo de microplaca. La radioactividad en presencia de (+)-clorhidrato de butaclamol 10 µM se supuso como unión no específica.

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

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

5 El ensayo 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).

10 Se decapitaron ratas macho Wistar, recuperando inmediatamente el cerebro y se extirpó el córtex frontal. Este se homogeneizó en un volumen de sacarosa 0,25 M de 10 veces del peso del tejido usando un homogeneizador de vidrio Teflón, y se centrifugó a 4 °C, 1.000 x g durante 10 minutos. El sobrenadante obtenido se transfirió a otro tubo de centrífuga y se suspendió en un volumen de sacarosa 0,25 M de 5 veces del peso del tejido y el precipitado se centrifugó en el estado descrito anteriormente. El sobrenadante obtenido se combinó con el sobrenadante obtenido anteriormente y se ajustó a un volumen 40 veces del peso del tejido con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4) y se centrifugó a 4 °C, 35.000 x g durante 10 minutos. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen 40 veces del peso del tejido y se centrifugó en el estado descrito anteriormente. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen 20 veces del peso del tejido y se conservó como un espécimen de membrana, congelando a -85 °C hasta que se usó para realizar el ensayo de unión.

20 El ensayo de unión se realizó usando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de [³H]-Ketanserina (concentración final de 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 total fue de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido al 1%). La reacción se realizó a 37 °C durante 2 minutos y concluyó realizando filtración por succión con un colector de células sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

25 La placa de filtro fabricada con fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después se secó, a la microplaca se añadió un cóctel de centelleo líquido y se midió la radioactividad con un contador de centelleo de microplaca. La radioactividad en presencia de espiperona 10 µM se supuso como unión no específica.

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

3) Ensayo de unión al receptor de adrenalina αI

30 El ensayo se realizó de acuerdo con el método de Grop G et al. (Grop 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 ocl-adrenoceptor binding sites. *Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol.*, 1987, 336: 597-601).

35 Se decapitaron ratas macho Wistar, recuperando el cerebro inmediatamente y se extirpó el córtex cerebral. Se homogeneizó en un volumen de tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (NaCl 100 mM, que contenía dihidrógeno etilendiamina tetraacetato disódico 2 mM, pH 7,4) de 20 veces del peso del tejido usando un homogeneizador con una cuchilla rotatoria a alta velocidad, y se centrifugó a 4 °C, 80.000 x g durante 20 minutos. El precipitado obtenido se suspendió en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces del peso del tejido y después se incubó a 37 °C durante 10 minutos, se centrifugó en el estado descrito anteriormente. El precipitado obtenido se suspendió de nuevo en el tampón descrito anteriormente de un volumen de 20 veces del peso del tejido y se centrifugó en el estado descrito anteriormente. El precipitado obtenido se suspendió en tampón (Tris)-ácido clorhídrico 50 mM (que contenía dihidrógeno etilendiamina tetraacetato disódico 1 mM, pH 7,4) de un volumen 20 veces del peso corporal del tejido y se conservó como un espécimen de membrana congelando a -85 °C hasta que se usó para realizar el ensayo de unión.

45 El ensayo de unión se realizó usando 40 µl del espécimen de membrana, 20 µl de [³H]-prazosin (concentración final de 0,2 a 0,5 nM), 20 µl de un fármaco de ensayo y tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (que contenía EDTA 1 mM, pH 7,4) de manera que la cantidad total era de 200 µl (concentración final de dimetilsulfóxido al 1%). La reacción se realizó a 30 °C durante 45 minutos y concluyó realizando filtración por succión con un colector de células sobre una placa de filtro de fibra de vidrio.

La placa de filtro fabricada con fibra de vidrio se lavó con tampón Tris-ácido clorhídrico 50 mM (pH 7,4), y después se secó, se añadió un cóctel de centelleo líquido a la microplaca y se midió la radioactividad con un contador de centelleo de microplaca. La radioactividad en presencia de clorhidrato de fentolamina 10 µM se supuso como unión no específica.

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

Ensayo farmacológico 2

Actividad agonista parcial del receptor de dopamina D_2 usando células de expresión del receptor D_2 .

- 5 La actividad agonista parcial del receptor de dopamina D_2 se evaluó cuantitativamente determinando el efecto inhibitorio de la producción de AMP cíclico de un compuesto de ensayo en células de expresión del receptor de dopamina D_2 en las se indujo la producción de adenosin 3',5'-monofosfato cíclico (AMP cíclico) mediante estimulación con forskolina.

10 Se cultivaron células de ovario de hámster Chino que expresaban el receptor de dopamina D_2 recombinante humano/DHFR(-) en un medio de cultivo (Medio de Dulbecco Modificado por Iscove (medio de cultivo IMDM), suero bovino fetal al 10%, 50 U.I./ml de penicilina, 50 μ g/ml de estreptomycin, 200 μ g/ml de geneticina, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μ M) a una temperatura de 37 °C y con dióxido de carbono al 50%. Las células se sembraron a 10^4 células/pocillo en una placa de microtitulación de 96 pocillos revestida con poli-L-lisina y se cultivaron en las mismas condiciones durante 2 días. Cada pocillo se lavó con 100 μ l de un medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μ M). El medio de cultivo se substituyó con 5 μ l de medio de cultivo (medio de cultivo IMDM, ascorbato sódico al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μ M) en cuyo interior se habían disuelto 3 μ M de un compuesto de ensayo. Después de dejar incubar a 37 °C, con dióxido de carbono al 5% durante 20 minutos, el medio de cultivo se substituyó con 100 μ l de medio de cultivo estimulador con foscolina (medio de cultivo IMDM, ascorbato sódico al 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μ M, forskolina 10 μ M, 3- isobutil-1- metilxantina 500 μ M) en cuyo interior se habían disuelto 3 μ M del compuesto de ensayo y se dejó incubar a 37 °C, con dióxido de carbono al 5% durante 10 minutos. Después, el medio de cultivo se retiró y se dispensaron 20 μ l de solución acuosa 1B de Lisis (Amersham Bioscience, reactivo anexo al sistema de inmunoensayo enzimático de biorrastreo de AMP cíclico) y se agitó durante 10 minutos. La solución acuosa de cada pocillo se usó como una muestra para realizar la medición. Las muestras para la medición se diluyeron cuatro veces y se sometieron a medición de la cantidad de AMP cíclico usando el sistema de inmunoensayo enzimático descrito anteriormente. La proporción de inhibición del compuesto de ensayo respectivo se calculó suponiendo que la cantidad de AMP cíclico del pocillo al cual no se añadió el compuesto de ensayo era del 100%. En este sistema de ensayo empírico, se usó dopamina como un fármaco de control que suprime la cantidad de AMP cíclico a aproximadamente el 10% como la actividad máxima.

- 30 Se confirmó que los compuestos de ensayo tenían una actividad agonista parcial para el receptor de dopamina D_2 en el ensayo descrito anteriormente.

35 Dados que los compuestos del ensayo tienen actividad agonista parcial para el receptor de dopamina D_2 , estos pueden estabilizar la neurotransmisión de dopamina a un estado normal en un paciente con esquizofrenia y como resultado, muestran, por ejemplo, un efecto de mejoría del estado positivo y negativo, efecto de mejoría del deterioro cognitivo y efectos de mejoría de otros síntomas sin producir efectos secundarios.

Ensayo farmacológico 3

Efecto inhibitorio sobre el comportamiento estereotipado inducido por la apomorfina en ratas.

- 40 Como animales de ensayo se usaron ratas Wistar (macho, de seis-siete semanas de vida, Japan SLC, Inc.). Un compuesto de ensayo se suspendió en goma arábiga / (solución salina fisiológica o agua) al 5%, usando un mortero de ágata y, en caso de ser necesario, se diluyó con el mismo disolvente.

Los animales del ensayo se dejaron en ayunas durante la noche desde el día anterior. La apomorfina (0,7 mg/kg) se administró por vía subcutánea (1 ml/kg) 1 hora antes de que cada compuesto de ensayo se administrase por vía oral (5 ml/kg). El comportamiento estereotipado se observó durante 1 minuto, respectivamente 20, 30 y 40 minutos después de la inyección de apomorfina.

- 45 El comportamiento estereotipado de cada animal se cuantificó de acuerdo con el siguiente estado, se calculó el total de la puntuación realizada a tres puntos y se evaluó el efecto anti-apomorfina. Para cada grupo se usaron seis animales de ensayo.

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

1: Olfateo discontinuo, actividad exploratoria constante;

- 50 2: Olfateo continuo, actividad exploratoria periódica;

3: Olfateo continuo, mordisqueos, roeduras o lamidos discontinuos. Periodos muy breves de actividad locomotora;

4: Mordisqueos, roeduras o lamidos continuos; actividad no exploratoria.

En todo el proceso estadístico se usó un sistema de análisis estadístico no clínico. Cuando el valor de probabilidad significativa era inferior a 0,05, se llegó a la conclusión de que existía una diferencia significativa. Usando el ensayo de suma de clasificación de Wilcoxon o el ensayo de Steel se analizó la diferencia de la puntuación entre el grupo al que se había administrado disolvente y el grupo de administración con cada compuesto de ensayo. Además, se usó análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz al 50% (intervalo de confianza del 95%).

5

Dado que los compuestos de ensayo mostraron un efecto inhibitor para el comportamiento estereotipado inducido por la apomorfina, se confirmó que los compuestos de ensayo tenían efecto antagonista del receptor D₂.

Ensayo farmacológico 4

10 Efecto inhibitor en sacudidas de cabeza inducido por (±)D-2,5-dimetoxi-4-yodoanfetamina (DOI) en ratas.

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

15 Los animales de ensayo se dejaron en ayunas durante la noche desde el día anterior. Se administró DIO (5,0 mg/kg) por vía subcutánea (1 ml/kg) 1 hora antes de que cada compuesto de ensayo se administrase por vía oral (5 ml/kg). Inmediatamente después de la inyección de DOI, se contó el número de sacudidas de cabeza durante 10 minutos. Para cada grupo se usaron seis animales de ensayo.

20 En todo el proceso estadístico se usó un análisis estadístico no clínico. Cuando el valor de probabilidad significativa era inferior a 0,05, se llegó a la conclusión de que existía una diferencia significativa. Usando el ensayo de t o el ensayo de Dunnett se analizó la diferencia en cuanto al número de sacudidas de cabeza entre el grupo al que se administró disolvente y el grupo de administración con cada compuesto de ensayo. Además, se usó análisis de regresión lineal para calcular la dosis eficaz al 50% (intervalo de confianza del 95%).

Dado que los compuestos de ensayo mostraron efecto inhibitor en sacudidas de cabeza inducido por DOI, se confirmó que los compuestos de ensayo tenían efecto antagonista del receptor de serotonina 5HT_{2A}.

25 Ensayo farmacológico 5

Efecto inductor de catalepsia en ratas

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

30 Los animales de ensayo se dejaron en ayunas durante una noche desde el día anterior. La observación de la catalepsia y ptosis se realizó 1, 2, 4, 6 y 8 horas después de administrar cada compuesto de ensayo por vía oral (5 ml/kg). Para cada grupo se usaron seis animales de ensayo.

35 Se colocó una pata delantera de una rata en un extremo de una pequeña caja de acero (anchura: 6,5 cm, profundidad: 4,0 cm, altura: 7,2 cm) (una pose no natural) y cuando la rata mantuvo la pose durante más de 30 segundos, se consideró el caso como positivo a catalepsia. Esta observación se realizó tres veces en cada punto y si había al menos un caso positivo, se consideró que se producía catalepsia en el individuo.

Como resultado, el efecto inductor 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 aprensión para el efecto secundario extrapiramidal en la práctica clínica sería baja.

40 Ensayo farmacológico 6

Medición de la actividad inhibitora de la captación de serotonina (5-HT) de un compuesto de ensayo mediante sinaptosoma cerebral en rata.

45 Se decapitaron ratas macho Wistar, se recuperó el cerebro, se diseccionó el córtex frontal y se homogeneizó en solución de sacarosa 0,32 M de un peso 20 veces del peso del tejido usando un homogeneizador de tipo Potter. El homogeneizado se centrifugó a 4 °C, 1.000 x g durante 10 minutos, el sobrenadante obtenido se centrifugó adicionalmente a 4 °C, 20.000 x 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 de potasio 4,5 mM, cloruro de magnesio 1,2 mM, cloruro de calcio 1,5 mM), que se usó como fracción sinaptosómica en bruto.

50 Se realizó reacción de captación de 5-HT en un volumen de 200 µl usando una placa de fondo redondo de 96 pocillos y en el tampón de incubación se incluyó pargilina (concentración final 10 µM) y ascorbato de sodio (concentración final 0,2 mg/ml) después de la reacción y se usó.

A cada pocillo se añadió, tampón de incubación (recuento total), 5-HT sin marcar (concentración final 10 μ M, recuento no específico) y el compuesto de ensayo diluido (concentración final 300 nM). Se añadió una décima cantidad del volumen final de la fracción sinaptosómica y después de preincubar a 37 °C durante 10 minutos, se añadió la solución de 5-HT marcada con tritio (concentración final 8 nM) y la reacción de captación comenzó a 37 °C.

- 5 El tiempo de captación fue de 10 minutos y la reacción concluyó por filtración al vacío a través de una placa de papel de filtro de vidrio de 96 pocillos y después el papel de filtro se lavó con solución salina enfriada, se secó bien y se añadió Microscint0 (Perkin-Elmer) al filtro y se midió la radioactividad que quedó sobre el filtro.

La actividad inhibidora de la captación de serotonina (%) se calculó a partir de la radioactividad del recuento total como 100%, del recuento no específico como 0% y del recuento obtenido con el compuesto de ensayo.

- 10
$$\% \text{ de inhibición de 5-HT (\%)} = 100 - \left[\frac{\text{recuento obtenido con el compuesto de ensayo} - \text{recuento no específico (captación 0\%)}}{\text{recuento total (captación 100\%)} - \text{recuento no específico (captación 0\%)}} \right] \times 100$$

Ejemplos de preparación

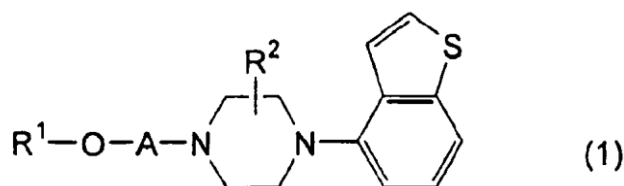
- 15 Se mezclaron 100 g de un compuesto de la presente invención, 40 g de Avicel (marca registrada, producto de Asahi Chemical Industry Co., Ltd.), 30 g de almidón de maíz y 2 g de estearato de magnesio, se pulieron y con un mortero para glicólaxil R10 mm, se comprimió en comprimidos.

El comprimido obtenido se recubrió con una película usando un agente de recubrimiento pelicular constituido por 10 g de TC-5 (marca registrada, producto de Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., hidroxipropil metilcelulosa), 3 g de polietilenglicol 6000, 40 g de aceite de ricino y una cantidad apropiada de etanol para producir un comprimido de la composición anterior recubierto con película.

20

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico o una sal del mismo representada por la fórmula (1):



en la que R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6;

5 A representa un grupo alquileno C1-C6 o un grupo alquenileno C2-C6; y

R¹ representa un grupo cicloalquilo C3-C8;

en la que al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en los grupos (1) a (66) que se muestran a continuación puede estar presente como un sustituyente en el grupo cicloalquilo C3-C8 representado por R¹:

- (1) un grupo alquilo C1-C6,
- 10 (2) un grupo alquenilo C2-C6,
- (3) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
- (4) un grupo alcoxi C1-C6,
- (5) un grupo ariloxi,
- (6) un grupo alquiltio C1-C6,
- 15 (7) un grupo alcoxi C1-C6 sustituido con halógeno,
- (8) un grupo hidroxilo,
- (9) un grupo protegido con hidroxilo,
- (10) un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo,
- (11) un grupo alquilo C1-C6 protegido con hidroxilo,
- 20 (12) un átomo de halógeno,
- (13) un grupo ciano,
- (14) un grupo arilo,
- (15) un grupo nitro,
- (16) un grupo amino,
- 25 (17) un grupo amino que tiene uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo C1-C6 carbamoilo, un grupo alcanoil C1-C6 amino, un grupo alcanoil C1-C6 amino-alcanóilo C1-C6 y un grupo alcoxi C1-C6 carbonilamino-alcanóilo C1-C6 como un sustituyente,
- (18) un grupo alcanóilo C1-C6,
- 30 (19) un grupo arilsulfonilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 en el grupo arilo,
- (20) un grupo carboxilo,
- (21) un grupo alcoxicarbonilo C1-C6,
- (22) un grupo carboxialquilo C1-C6,
- (23) un grupo alcoxi C1-C6 carbonil-alquilo C1-C6,

- (24) un grupo alcanoil C1-C6 amino-alcanoílo C1-C6,
- (25) un grupo carboxialquenilo C2-C6,
- (26) un grupo alcoxi C1-C6 carbonil-alquenilo C2-C6,
- 5 (27) un grupo carbamoil alquenilo C2-C6 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como un sustituyente,
- (28) un grupo carbamoílo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i) a (1 xxviii) que se muestran a continuación como un sustituyente:
- (i) un grupo alquilo C1-C6,
- (ii) un grupo alcoxi C1-C6,
- 10 (iii) un grupo alquilo C1-C6 hidroxilado,
- (iv) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
- (v) un grupo ariloxilado alquilo C1-C6,
- (vi) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,
- 15 (vii) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanoilado C1-C6, un grupo aroílo y un grupo carbamoílo,
- (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilado, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilado y un grupo fenil alcoxi C1-C6 como un sustituyente,
- (ix) un grupo cicloalquilo C1-C6 sustituido con alquilo C3-C8,
- 20 (x) un grupo alquenilo C2-C6,
- (xi) un grupo carbamoil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilado que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 y uno o más grupos fenilado que pueden tener uno o más grupos alcoxi C1-C6 como un sustituyente,
- (xii) un grupo alcoxi C1-C6 carbonilado-alquilo C1-C6,
- 25 (xiii) un grupo furil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente) en el grupo furilado,
- (xiv) un grupo tetrahidrofuril alquilo C1-C6,
- (xv) un grupo 1,3-dioxolanil alquilo C1-C6,
- (xvi) un grupo tetrahidropiranil alquilo C1-C6,
- 30 (xvii) un grupo pirrolil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo pirrolilado),
- (xviii) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo dihidropirazolilado que puede tener uno o más grupos oxo,
- 35 (xix) un grupo pirazolil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo pirazolilado),
- (xx) un grupo imidazolil alquilo C1-C6,
- (xxi) un grupo piridil alquilo C1-C6,
- (xxii) un grupo pirazinil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo pirazinilado),
- 40 (xxiii) un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en uno o más grupos oxo y un grupo alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo pirrolidinilado),
- (xxiv) un grupo piperidil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo

- que consiste en un grupo benzoílo y un grupo alcanóilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo piperidilo),
- (xxv) un grupo piperazinil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo piperazinilo),
- 5 (xxvi) un grupo morfolinil alquilo C1-C6,
- (xxvii) un grupo tienil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo tienilo),
- (xxviii) un grupo tiazolil alquilo C1-C6,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofuril alquilo C1-C6,
- 10 (xxx) un grupo benzopiranyl alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos oxo como un sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- (xxxi) un grupo benzoimidazolil alquilo C1-C6,
- (xxxii) un grupo indolil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alcoxi C1-C6 carbonilo en el grupo alquilo C1-C6),
- 15 (xxxiii) un grupo imidazolil alquilo C1-C6 que tiene uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo carbamoílo y un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo en el grupo alquilo C1-C6,
- (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6 como un sustituyente,
- 20 (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo aroílo como un sustituyente,
- (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo aroílo
- 25 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un átomo de halógeno como un sustituyente,
- (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (xxxviii) un grupo hexahidroazepinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo arilo y un grupo furilo como un sustituyente,
- 30 (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (xlii) un grupo isoxazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (xliii) un grupo indazolilo,
- 35 (xliv) un grupo indolilo,
- (xlv) un grupo tetrahidrobenzotiazolilo,
- (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un átomo de halógeno y un grupo oxo como un sustituyente,
- 40 (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (xlviii) un grupo benzodioxolil alquilo C1-C6,
- (xlix) un grupo arilo que puede tener uno o más grupos como un sustituyente, seleccionados entre el 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 entre el grupo que consiste en un grupo
- 45

- 5 alcanoílo C1-C6, un grupo alquil C1-C6 sulfonilo, un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo sulfamoílo; un grupo alquiltio C1-C6; un grupo alcanoílo C1-C6; un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo C2-C6; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo ariloxi; un grupo aril alcoxi C1-C6; un grupo hidroxilo; un grupo hidroxilo alquilo C1-C6; un grupo carbamoílo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo oxazolilo; un grupo imidazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6; un grupo dihidrofurilo que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo tiazolidinil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos oxo; un grupo imidazolil alcanoílo C1-C6 y un grupo piperidinilcarbonilo,
- 10 (I) un grupo ciano alquilo C1-C6,
- (II) un grupo dihidroquinolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo oxo,
- (III) un grupo alquilamino C1-C6 sustituido con halógeno,
- (IIII) un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6,
- 15 (IV) un grupo amidino que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (V) un grupo amidino alquilo C1-C6,
- (VI) un grupo alqueniloxi C2-C6-alquilo C1-C6,
- (VII) un grupo arilamino que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el 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,
- 20 (VIII) un grupo aril alquenilo C2-C6,
- (IX) un grupo piridilamino que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (X) un grupo aril alquilo C1-C6 (que puede tener en el grupo arilo y/o en el grupo alquilo C1-C6 uno o más grupos seleccionados entre el 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 carbamoílo y un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo como un sustituyente),
- 25 (XI) un grupo alquinilo C2-C6,
- (XII) un grupo ariloxi alquilo C1-C6 (que puede tener como un sustituyente en el grupo arilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi C1-C6; un grupo carbamoílo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6; y un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo),
- 30 (XIII) un grupo isoxazolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (XIV) un grupo dihidroindenilo,
- (XV) un grupo aril C1-C6 alcoxi-alquilo C1-C6,
- 35 (XVI) un grupo tetrahidropiranilo,
- (XVII) un grupo azetidínilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanoílo C1-C6 y un grupo aroílo,
- (XVIII) un grupo azetidínil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanoílo C1-C6 y un grupo aroílo,
- 40 (XIX) un grupo tetrazolilo,
- (XX) un grupo indolinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (XXI) un grupo triazolilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6,
- (XXII) un grupo imidazolilo que puede tener uno o más grupos carbamoílo,
- 45 (XXIII) un grupo oxazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,

- (lxxiv) un grupo isotiazolilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (lxxv) un grupo benzoimidazolilo,
- (lxxvi) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (lxxvii) un grupo tienilo que puede tener uno o más grupos alcoxi C1-C6 carbonilo, y
- 5 (lxxviii) un grupo oxazolil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6
- (29) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo arilo, un grupo aril alquilo C1-C6, un grupo aroilo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo amino) en el grupo amino,
- 10 (30) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo carbamoilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el 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 más grupos alquilo C1-C6,
- 15 (32) un grupo sulfamoilo,
- (33) un grupo oxazolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- (34) un grupo imidazolidinilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6,
- (35) un grupo pirrolidinilo que puede tener uno o más grupos oxo,
- 20 (36) un grupo imidazolilo,
- (37) un grupo triazolilo,
- (38) un grupo isoxazolilo,
- (39) un grupo piperidilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo arilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y Un grupo alcanoilamino C1-C6-alcanóilo C1-C6,
- 25 (40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo carboxialquilo C1-C6, un grupo alquil C1-C6 carbamoil-alquilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo carboxi, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo aroilo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente), 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 más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridil alcoxi C1-C6, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo aril alcoxi C1-C6 (que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el 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 arilo), un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo hidroxilo), un grupo ariloxi (que puede tener en el grupo arilo uno o más grupos seleccionados entre el 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 aril alquilo C1-C6 (que puede tener en el grupo arilo uno o más grupos seleccionados entre el 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 arilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C1-C6),
- 30 (41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener un grupo como un sustituyente, seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo carbamoilo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que
- 35
- 40
- 45
- 50

- 5 puede tener en el grupo amino uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanoilo C1-C6 y un grupo aroilo), un grupo morfolinil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6, un grupo piperidil alquilo C1-C6, un grupo piperazinil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo amino), un grupo ariloxi (que puede tener un grupo alcoxi C1-C6 sustituido con uno o más halógeno en el grupo arilo), un grupo ariloxi alquilo C1-C6 (que puede tener un grupo alcoxi C1-C6 sustituido con uno o más halógeno en el grupo arilo) y un grupo tetrahidroquinolilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos oxo),
- 10 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos como un sustituyente, seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanoilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo amino), un grupo piperidilo alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo piperidilo), un grupo morfolinil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6, un grupo 1,3-dioxolanil alquilo C1-C6, un grupo tetrahidrofuril alquilo C1-C6, un grupo piridil alquilo C1-C6 (que puede tener uno o más grupos fenilo como un sustituyente en el grupo alquilo C1-C6), un grupo imidazolil alquilo C1-C6, un grupo furil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilcarbonil alquilo C1-C6, un grupo piperidilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente, un grupo piridilo (que puede tener en el grupo piridilo uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo ciano y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como un sustituyente), un grupo tieno[2,3-b]piridilo, un grupo arilo (en el que pueden estar presentes uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C1-C6), un grupo aroilo, un grupo furil carbonilo, un grupo aril alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo oxo,
- 15 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
- 20 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo piridilo,
- 25 (45) un grupo dihidropirrolilcarbonilo que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6,
- (46) un grupo tiomorfolinilcarbonilo,
- 30 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo piperidilo alquilo C1-C6 y un grupo arilo,
- (48) un grupo tiazolidinil carbonilo que puede tener uno o más grupos arilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo ciano,
- (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
- 35 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener uno o más grupos ariloxi sustituidos con halógeno o sin sustituir,
- (51) un grupo indolinilcarbonilo,
- (52) un grupo tetrahidroquinolilcarbonilo,
- (53) un grupo tetrahidropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
- (54) un grupo morfolinil alquilo C1-C6,
- 40 (55) un grupo piperazinil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
- (56) un grupo morfolinilcarbonil alquilo C1-C6,
- (57) un grupo piperazinilcarbonil alquilo C1-C6 que puede tener uno o más grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
- 45 (58) un grupo oxo,
- (59) un grupo amino alcoxi C1-C6 (que puede tener uno o más 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 más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanoilo C1-C6 y un grupo alcoxycarbonilo C1-C6,

(62) un grupo morfolinilo,

(63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener uno o más grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo arilo,

(64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener uno o más grupos piridilo,

5 (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener uno o más grupos tioxo, y

(66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R¹ representa un grupo ciclo alquilo C5-C6

en el que, en el grupo cicloalquilo C5-C6 representado por R¹, pueden estar presentes de 1 a 5 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (1) a (66) que se muestran a continuación como uno o más

10 sustituyentes:

(1) un grupo alquilo C1-C6,

(2) un grupo alquenilo C2-C6,

(3) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,

(4) un grupo alcoxi C1-C6,

15 (5) un grupo fenoxi,

(6) un grupo alquiltio C1-C6,

(7) un grupo alcoxi C1-C6 sustituido con halógeno,

(8) un grupo hidroxilo,

(9) un grupo fenil alcoxi C1-C6,

20 (10) un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo,

(11) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,

(12) un átomo de halógeno,

(13) un grupo ciano,

(14) un grupo fenilo,

25 (15) un grupo nitro,

(16) un grupo amino,

(17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanoilo C1-C6, un grupo alcocarbonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo C1-C6 carbamoilo, un grupo alcanoil C1-C6 amino, un grupo alcanoil C1-C6 amino-alcanoilo C1-C6 y un grupo alcocarbonilamino C1-C6-alcanoilo C1-C6 como uno o más

30 sustituyentes,

(18) un grupo alcanoilo C1-C6,

(19) un grupo fenilsulfonilo que puede tener un único grupo alquilo C1-C6 en el grupo fenilo,

(20) un grupo carboxi,

35 (21) un grupo alcocarbonilo C1-C6,

(22) un grupo carboxialquilo C1-C6,

(23) un grupo alcoxi C1-C6 carbonil-alquilo C1-C6,

(24) un grupo alcanoil C1-C6 amino-alcanoilo C1-C6,

(25) un grupo carboxialquenilo C2-C6,

40 (26) un grupo alcoxi C1-C6 carbonil-alquenilo C2-C6,

- (27) un grupo carbamoilo alqueno C2-C6 que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno como uno o más sustituyentes,
- 5 (28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i) a (lxxviii) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:
- (i) un grupo alquilo C1-C6,
 - (ii) un grupo alcoxi C1-C6,
 - (iii) un grupo alquilo C1-C6 hidroxilado,
 - (iv) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
 - 10 (v) un grupo fenoxilado alquilo 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanoilo C1-C6, un grupo benzoilo y un grupo carbamoilo,
 - 15 (viii) un grupo cicloalquilo C3-C8 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilado, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilado y un grupo fenil alcoxi C1-C6 como un sustituyente),
 - (ix) un grupo cicloalquilo C1-C6 sustituido con alquilo C3-C8,
 - (x) un grupo alqueno C2-C6,
 - 20 (xi) un grupo alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 2 grupos carbamoilo que pueden tener de 1 a 2 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilo que puede tener un único grupo alquilo C1-C6 y un grupo fenilo que puede tener un único grupo alcoxi C1-C6,
 - (xii) un grupo alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi C1-C6 carbonilado,
 - 25 (xiii) un grupo furil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo furil),
 - (xiv) un grupo tetrahidrofuril alquilo C1-C6,
 - (xv) un grupo 1,3-dioxolanil alquilo C1-C6,
 - (xvi) un grupo tetrahidropirranil alquilo C1-C6,
 - 30 (xvii) un grupo pirrolil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 en el grupo pirrolilo como uno o más sustituyentes),
 - (xviii) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un grupo dihidropirazolilo que puede tener un único grupo oxo,
 - (xix) un grupo pirazolil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo pirazolilo),
 - 35 (xx) un grupo imidazolil alquilo C1-C6,
 - (xxi) un grupo piridil alquilo C1-C6,
 - (xxii) un grupo pirazinil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 (preferiblemente 1) grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo pirazinilo),
 - 40 (xxiii) un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes el grupo pirrolidinilo),
 - (xxiv) un grupo piperidil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo benzoilo y un grupo alcanoilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo),
 - 45 (xxv) un grupo piperazinil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como uno o más

- sustituyentes en el grupo piperazinilo),
- (xxvi) un grupo morfolinil alquilo C1-C6,
- (xxvii) un grupo tienil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo tienilo),
- 5 (xxviii) un grupo tiazolil alquilo C1-C6,
- (xxix) un grupo dihidrobenzofuril alquilo C1-C6,
- (xxx) un grupo benzopiranyl alquilo C1-C6 (que puede tener un único grupo oxo como un sustituyente en el grupo benzopiranyl),
- (xxxi) un grupo benzoimidazolil alquilo C1-C6,
- 10 (xxxii) un grupo indolil alquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxicarbonilo C1-C6 en el grupo alquilo C1-C6),
- (xxxiii) un grupo imidazolil alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo carbamoilo y un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, en el grupo alquilo C1-C6,
- 15 (xxxiv) un grupo piridilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes,
- (xxxv) un grupo pirrolidinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo como uno o más sustituyentes,
- 20 (xxxvi) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un átomo de halógeno como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo),
- (xxxvii) un grupo tetrahidrofurilo que puede tener un único grupo oxo
- 25 (xxxviii) un grupo hexahidrozepinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (xxxix) un grupo pirazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo fenilo y un grupo furilo como uno o más sustituyentes,
- (xl) un grupo tiazolilo,
- (xli) un grupo tiadiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
- 30 (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,
- 35 (xlvi) un grupo tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un átomo de halógeno y un grupo oxo como uno o más sustituyentes,
- (xlvii) un grupo quinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
- (xlviii) un grupo benzodioxolil alquilo C1-C6,
- 40 (xlix) un grupo fenilo o un grupo naftilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes, seleccionados entre el 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 de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alquil C1-C6 sulfonilo, un grupo alquilo C1-C6 y un grupo arilo; un grupo sulfamoilo; un grupo alquiltio C1-C6; un grupo alcanóilo C1-C6;
- 45 un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo; un grupo pirrolilo; un grupo alquinilo C2-C6; un grupo ciano; un grupo nitro; un grupo feniloxi; un grupo fenil alcoxi C1-C6; un grupo hidroxil; un grupo hidroxil alquilo C1-C6; un

- 5 grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo fenilo; un grupo pirazolilo; un grupo pirrolidinilo que puede tener un único 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 único grupo oxo; un grupo tiazolidinil alquilo C1-C6 que puede tener dos grupos oxo; un grupo imidazolil alcanóilo C1-C6 y un grupo piperidinilcarbonilo,
- (I) un grupo ciano alquilo C1-C6,
- (II) un grupo dihidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo oxo,
- (III) un grupo alquilamino C1-C6 sustituido con halógeno,
- 10 (IIIi) un grupo alquiltio C1-C6-alquilo C1-C6,
- (IV) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo C1-C6,
- (IV) un grupo amidino alquilo C1-C6,
- (VI) un grupo alquenilo C2-C6-alquilo C1-C6,
- 15 (VII) un grupo fenilamino que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el 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,
- (VIII) un grupo fenil alqueno C2-C6,
- (IX) un grupo piridilamino que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
- 20 (IX) un grupo fenil alquilo C1-C6 (que puede tener como uno o más sustituyentes en el grupo fenilo y/o el grupo alquilo C1-C6 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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),
- (XI) un grupo alquino C2-C6,
- 25 (XII) un grupo fenilo alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi C1-C6, un grupo N-alcoxi C1-C6-N-alquilcarbamoilo C1-C6 y un grupo oxopirrolidinilo como un sustituyentes) en el grupo fenilo),
- (XIII) un grupo isoxazolidinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (XIV) un grupo dihidroindenilo,
- (XV) un grupo fenil alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,
- 30 (XVI) un grupo tetrahidropirano,
- (XVII) un grupo azetidino que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoilo,
- (XVIII) un grupo azetidil alquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoilo,
- 35 (XIX) un grupo tetrazolilo,
- (XX) un grupo indolinilo que puede tener un único grupo oxo,
- (XXI) un grupo triazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquiltio C1-C6,
- (XXII) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos carbamoilo,
- 40 (XXIII) un grupo oxazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
- (XXIV) un grupo isotiazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6,
- (XXV) un grupo benzoimidazolilo,
- (XXVI) un grupo dihidrobenzotiazolilo que puede tener un único grupo oxo,

(lxxvii) un grupo tienilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxicarbonilo C1-C6, y

(lxxviii) un grupo oxazolil alquilo 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 entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo C1-C6, un grupo benzoílo y un grupo alquilo amino sustituido (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo amino), en el grupo amino,

(30) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un único grupo carbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,

(31) un grupo tiocarbamoílo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6,

(32) un grupo sulfamoílo,

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

(34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6,

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

(36) un grupo imidazolilo,

(37) un grupo triazolilo,

(38) un grupo isoxazolilo,

(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alquilfenilsulfonilo C1-C6, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo alcanóil C1-C6 amino-alcanóilo C1-C6,

(40) un grupo piperidilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo carboxialquilo C1-C6, un grupo alquil C1-C6 carbamoil-alquilo C1-C6, un grupo carbamoílo, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo carboxi, un grupo alcoxicarbonilo C1-C6, un grupo amino (en el que pueden estar presentes de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo benzoílo), un grupo piperidilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo benzoílo), un grupo piperazinilo (en el que pueden estar presentes de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes), 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 único grupo alquilo C1-C6 como un sustituyente), un grupo piridilo, un grupo piridiloxi, un grupo piridil alcoxi C1-C6, un grupo tetrahydroquinolilo (en el que puede estar presente un único grupo oxo), un grupo benzodioxolilo, un grupo fenil alcoxi C1-C6 (que puede tener en el grupo fenilo de 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 de 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 fenil alquilo C1-C6 (en el grupo fenilo pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el 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 benzoílo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alcoxi C1-C6 en el grupo fenilo),

(41) un grupo pirrolidinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo carbamoílo, un grupo hidroxilo, un grupo amino (que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo benzoílo en el grupo amino), un grupo morfolinil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6, un grupo piperidil alquilo C1-C6, un grupo piperazinil alquilo C1-C6 (que puede tener un único grupo alquilo C1-C6 como un sustituyente en el grupo piperazinilo), un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener presentes de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como un sustituyente 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 feniloxi alquilo 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),

- 5 (42) un grupo piperazinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos como uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo ciclo alquilo C3-C8, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo, un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo aminoalquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo amino), un grupo piperidilo alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo piperidilo), un grupo morfolinil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinil alquilo C1-C6, un grupo 1,3-dioxoranil alquilo C1-C6, un grupo tetrahydrofuril alquilo C1-C6, un grupo piridil alquilo C1-C6 (que puede tener de 1 a 2 grupos fenilo como uno o más sustituyentes en el grupo alquilo C1-C6), un grupo imidazolil alquilo C1-C6, un grupo furil alquilo C1-C6, un grupo pirrolidinilcarbonil alquilo C1-C6, un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes), un grupo piridilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo ciano y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno como uno o más 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 entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo C1-C6), un grupo benzoilo, un grupo furil carbonilo, un grupo fenil alcoxycarbonilo C1-C6 y un grupo oxo,
- 10 (43) un grupo hexahidroazepinilcarbonilo,
- 15 (44) un grupo hexahidro-1,4-diazepinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo 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,
- 20 (47) un grupo morfolinilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo piperidilo alquilo C1-C6 y un grupo fenilo,
- (48) un grupo tiazolidinil carbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo ciano,
- (49) un grupo azabicyclo[3,2,2]nonilcarbonilo,
- 25 (50) un grupo 8-azabicyclo[3,2,1]octilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos feniloxi sustituidos con halógeno o sin sustituir,
- (51) un grupo indolinilcarbonilo,
- (52) un grupo tetrahydroquinolilcarbonilo,
- (53) un grupo tetrahydropirido[3,4-b]indolilcarbonilo,
- 30 (54) un grupo morfolinil alquilo C1-C6,
- (55) un grupo piperazinil alquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
- (56) un grupo morfolinilcarbonil alquilo C1-C6,
- (57) un grupo piperazinilcarbonil alquilo C1-C6 que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo C1-C6 en el grupo piperazinilo,
- 35 (58) un grupo oxo,
- (59) un grupo amino alcoxi 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,
- 40 (61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo alcoxycarbonilo C1-C6,
- (62) un grupo morfolinilo,
- (63) un grupo 1,3,8-triazaespiro[4,5]decanilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo fenilo,
- 45

- (64) un grupo tetrahidropiridilcarbonilo que puede tener de 1 a 3 grupos piridilo,
- (65) un grupo imidazolidinilcarbonilo que puede tener un único grupo tioxo, y
- (66) un grupo 1,4-dioxa-8-azaespiro[4,5]decanilo.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en el que A es un grupo alquileo C1-C6.

5 4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, en el que R¹ representa un grupo cicloalquilo C5-C6 y en el grupo cicloalquilo C5-C6 representado por R¹ pueden estar presentes de 1 a 5 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) mostrados a continuación como uno o más sustituyentes:

(1) un grupo alquilo C1-C6,

10 (4) un grupo alcoxi C1-C6,

(10) un grupo alquilo C1-C6 hidroxilo,

(17) un grupo amino que tiene de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo carbamoilo, un grupo alquilo C1-C6 carbamoilo, un grupo alcanoil C1-C6 amino, un grupo alcanoilamino C1-C6-alcanóilo C1-C6 y un grupo alcoxycarbonilamino C1-C6-alcanóilo C1-C6, como uno o más sustituyentes,

15

(18) un grupo alcanóilo C1-C6,

(21) un grupo alcoxycarbonilo C1-C6,

(28) un grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en los grupos (i), (ii), (iv), (xii) y (xxi) que se muestran a continuación como uno o más sustituyentes:

20

(i) un grupo alquilo C1-C6,

(ii) un grupo alcoxi C1-C6,

(iv) un grupo alcoxi C1-C6-alquilo C1-C6,

(xii) un grupo alquilo C1-C6 que tiene de 1 a 2 grupos alcoxi C1-C6 carbonilo,

(xxi) un grupo piridil alquilo C1-C6,

25

(29) un grupo aminoalquilo C1-C6 que puede tener, en el grupo amino, de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno, un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo fenilo, un grupo fenil alquilo C1-C6, un grupo benzoilo y un grupo alquilo C1-C6 amino sustituido (que puede tener presentes de 1 a 2 grupos alquilo C1-C6 como uno o más sustituyentes en el grupo amino),

30

(30) un grupo alquilo C1-C6 sustituido con un único grupo carbamoilo que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6 y un grupo alquilo C1-C6 sustituido con halógeno,

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

35

(34) un grupo imidazolidinilo que puede tener de 1 a 2 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo y un grupo alquilo C1-C6,

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

(36) un grupo imidazolilo,

40

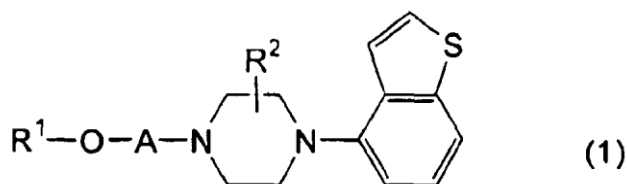
(39) un grupo piperidilo que puede tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alquil C1-C6 fenilsulfonilo, un grupo oxo, un grupo hidroxilo, y un grupo amino que puede tener de 1 a 2 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 carbonilo y un grupo alcanoil C1-C6-amino-alcanóilo C1-C6,

(61) un grupo piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un grupo oxo, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcanóilo C1-C6 y un grupo alcoxycarbonilo C1-C6, y

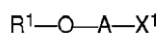
45

(62) un grupo morfolinilo.

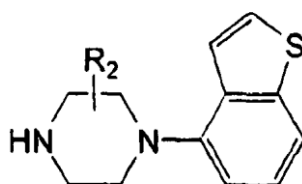
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en el que R¹ representa (I) un grupo ciclohexilo, y, en el grupo cicloalquilo C5-C6 representado por R¹, pueden estar presentes de 1 a 3 grupos seleccionados entre el grupo que consiste en (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) y (62) que se han definido en la reivindicación 4 como uno o más sustituyentes.
- 5 6. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, un compuesto heterocíclico de fórmula (1), o una sal del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
7. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1), o una sal del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, para su uso como un fármaco.
- 10 8. Un compuesto heterocíclico de la fórmula (1), o una sal del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, para su uso en un método para el tratamiento o prevención de un trastorno del sistema nervioso central.
9. El compuesto para su uso de acuerdo con la reivindicación 8, en el que el trastorno del sistema nervioso central se selecciona del grupo que consiste en esquizofrenia; esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; perturbación emocional; trastorno psicótico; trastorno anímico; trastorno bipolar de tipo I; trastorno bipolar de tipo II; depresión; depresión endógena; depresión principal; melancolía y depresión refractaria; trastorno distímico; trastorno ciclotímico; ataque de pánico; trastorno por pánico; agorafobia; fobia social; trastorno obsesivo compulsivo; trastorno por estrés postraumático; trastorno por ansiedad generalizada; trastorno por estrés agudo; histeria; trastorno por somatización; trastorno por 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; trastornos del sueño; trastorno de adaptación; alcoholismo; intoxicación alcohólica; drogadicción; intoxicación por estimulantes; narcotismo; anhedonía; anhedonía iatrogénica; anhedonía de una causa psicótica o mental; anhedonía asociada con depresión; anhedonía asociada con esquizofrenia; delirio; deterioro cognitivo; deterioro cognitivo asociado con la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y otras enfermedades neurodegenerativas; deterioro cognitivo causado por la enfermedad de Alzheimer; enfermedad de Parkinson y enfermedades neurodegenerativas asociadas; deterioro cognitivo de esquizofrenia; deterioro cognitivo causado por esquizofrenia refractaria, intratable o crónica; vómitos, cinetosis; obesidad; migraña; dolor (dolencia); retraso mental; trastorno de autismo (autismo); trastorno de Tourette; trastornos por tics; trastorno de hiperactividad/déficit de atención; trastorno conductual y síndrome de Down.
- 15
- 20
- 25
- 30 10. Un proceso para producir un compuesto heterocíclico representado por la fórmula (1):



[en la que R¹, R² y A son los mismos que se han definido en la reivindicación 1] o una sal del mismo, caracterizado porque comprende una reacción de un compuesto representado por la fórmula:



- 35 [en la que R¹ y A son los mismos que se han definido anteriormente, y X¹ representa un átomo de halógeno o un grupo que provoca una reacción de sustitución igual que en un átomo de halógeno] o una sal del mismo con un compuesto representado por la fórmula:



[en la que R₂ es el mismo que se ha definido anteriormente] o una sal del mismo.