

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 449 517**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

A61K 31/4188 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.09.2005 E 05784773 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **27.11.2013 EP 1791840**

54 Título: **Compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos**

30 Prioridad:

14.09.2004 DE 102004044884

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

20.03.2014

73 Titular/es:

**GRÜNENTHAL GMBH (100.0%)
Zieglerstrasse 6
52078 Aachen , DE**

72 Inventor/es:

**KÜHNERT, SVEN;
OBERBÖRSCH, STEFAN;
SUNDERMANN, CORINNA;
HAURAND, MICHAEL;
JOSTOCK, RUTH;
SCHIENE, KLAUS;
TZSCHENTKE, THOMAS;
CHRISTOPH, THOMAS;
KAULARTZ, DAGMAR y
ZEMOLKA, SASKIA**

74 Agente/Representante:

AZNÁREZ URBIETA, Pablo

ES 2 449 517 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos.

La presente invención se refiere a compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos, a procedimientos para su preparación, a composiciones farmacéuticas que los contienen y a su utilización para la preparación medicamentos.

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

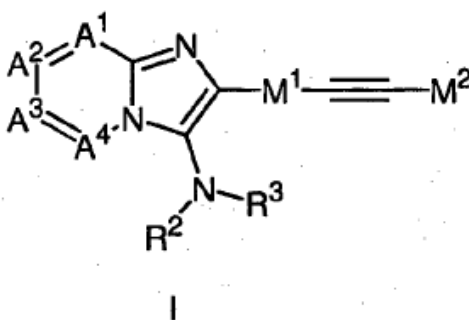
10 Los opioides clásicos, como la morfina, son eficaces en la terapia del dolor fuerte a muy fuerte; sin embargo, con frecuencia provocan efectos secundarios no deseados, por ejemplo depresión respiratoria, vómitos, sedación, estreñimiento y desarrollo de tolerancia. Además, a menudo no son lo suficientemente eficaces frente a dolores neuropáticos, los cuales sufren en especial los pacientes con tumores.

Los documentos WO 02/080911, DE 19948438 y WO 02/130428 describen compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos.

15 Un objetivo de la presente invención era proporcionar nuevos compuestos que fueran especialmente adecuados como principios activos farmacéuticos para medicamentos, preferentemente para medicamentos destinados al tratamiento del dolor.

20 Sorprendentemente, se ha observado que los compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos de la fórmula general I, mostrada más adelante, son adecuados para la regulación de los receptores mGluR5 (mGluR5 = receptor metabotrópico de glutamato 5) y, por ello, son especialmente adecuados como principios activos en medicamentos para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos o enfermedades relacionadas con estos procesos o receptores.

Un objeto de la presente invención son los compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos de fórmula general I:



donde

25 A¹ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1b},

A³ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1d};

30 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno, un grupo halógeno; -NO₂; -CN; -NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -NH-C(=O)-R⁷; -C(=O)-R⁸; -C(=O)-NH₂; -C(=O)-NHR⁹; -C(=O)-NR¹⁰R¹¹; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2, 3, 4 ó 5; -O-C(=O)-R¹⁴; -(CH₂)_n-O-C(=O)-R¹⁵ con n = 1, 2, 3, 4 ó 5; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2, 3, 4 ó 5; -SR¹⁸; -(CH₂)_p-S(=O)_t-R¹⁹ con p = 1, 2, 3, 4 ó 5 y t = 0, 1 ó 2; -NH-S(=O)₂-R²⁶R²⁷; -S(=O)₂-NR²⁸R²⁹; -SF₅; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente incluye al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alqueno lineal o ramificado y/o

35 que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o un

- grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido y que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- 5 o, en cada caso, R^{1a} y R^{1b} junto con el enlace C-C, forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;
- o, en cada caso, R^{1b} y R^{1c} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;
- o, en cada caso, R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;
- 10 R² y R³, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-O-R²²; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-NHR²⁴; -(CH₂)_s-C(=O)-NHR²⁵ con s = 1, 2, 3, 4 ó 5; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o
- 15 que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno, forman un grupo heterocicloalifático saturado o insaturado, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo y que puede estar
- 20 condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁴ y R¹⁵, independientemente entre sí, representan un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- 25 R⁸, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹, independientemente entre sí, representan un grupo hidrógeno; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido por un grupo alquileo lineal o ramificado y/o condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- 30 M¹ representa un grupo arilo o heteroarilo, que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- M² representa un grupo arilo o heteroarilo, que puede estar no sustituido o al menos monosustituido y, en cada caso, puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;
- en cada caso en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en especial de enantiómeros o diastereómeros, de racematos, o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier
- 35 proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes o en forma de solvatos correspondientes.
- Cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d} y R² a R²⁹ representan un grupo alifático saturado o insaturado, es decir un grupo alquilo, alqueno o alquino, que está sustituido una o más veces, preferentemente éste se sustituye con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientes entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, -NO₂, -CN, -OH, -SH y -NH₂. Los grupos alqueno tienen al menos uno, preferentemente 1, 2, 3 ó 4 enlaces
- 40 dobles C-C y los grupos alquino al menos uno, preferentemente, 1, 2, 3 ó 4 enlaces triples C-C.
- Como grupos alquilo, alqueno y alquino adecuados mono- o polisustituidos se pueden mencionar, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, 2-pentilo, 3-pentilo, isopentilo, neopentilo, n-hexilo, 2-hexilo, 3-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, -C(H)(n-C₃H₇)₂, -CH₂-CH₂-C(H)(CH₃)-(CH₂)₃-CH₃, 1,1,3,3-tetrametilbutilo, 1,1-dimetilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, vinilo, etinilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, hexenilo, hexinilo, -CH=CH-CH=CH-CH₃ y -CH₂-CH₂-CH=CH₂.
- 45 Como grupos alquilo y alqueno sustituidos adecuados se mencionan, por ejemplo, trifluorometilo, difluorometilo, monofluorometilo, -(CH₂)-OH, -(CH₂)-NH₂, -(CH₂)-CN, -(CH₂)-(CF₃), -(CH₂)-(CHF₂), -(CH₂)-(CH₂F), -(CH₂)-(CH₂)-OH, -(CH₂)-(CH₂)-NH₂, -(CH₂)-(CH₂)-CN, -(CF₂)-(CF₃), -(CH₂)-(CH₂)-(CF₃), -CH=CH-(CH₂)-OH, -CH=CH-(CH₂)-NH₂, -CH=CH-
- 50 CN y -(CH₂)-(CH₂)-(CH₂)-OH.

5 Cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ representan un grupo cicloalifático o incluyen un grupo cicloalifático mono o polisustituido, preferentemente éste está sustituidos en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientes entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-CF₃, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -N(H)alquilo(C₁₋₅), -NO₂, -S-CF₃, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-N(H)alquilo(C₁₋₅) y fenilo; donde los grupos alquilo(C₁₋₅) mencionados pueden ser en cada caso lineales o ramificados y los grupos fenilos pueden estar en cada caso no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entr el grupo consistente en F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi.

15 Preferentemente, los sustituyentes se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -(CH₂)₂-O-CH₃, -(CH₂)₂-O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -NO₂, -CF₃, -SF₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -NH-S(=O)₂-CH₃, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃ y fenilo, pudiendo el grupo fenilo estar sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo consistente en F, Cl, Br, metilo y metoxi.

20 Cuando los grupos cicloalifáticos presentan uno o más heteroátomos como miembros del anillo, éstos tienen preferentemente en cada caso 1, 2 ó 3 heteroátomos como miembro(s) el anillo, los cuales se seleccionan, independientemente, de entre el grupo consistente en nitrógeno, oxígeno y azufre.

25 Como ejemplos de grupos cicloalifáticos que pueden estar mono- o polisustituidos se pueden citar ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo, ciclodecilo, cicloyecilo, ciclododecilo, cicloheptilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, oxiranilo, aziridinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidrotienilo, pirrolidinilo, isoxazolidinilo, isotioazolidinilo, pirazolidinilo, oxazolidinilo, tiazolidinilo, imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidinilo, 1,2,4-tiadiazolidinilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-tiadiazolidinilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofurilo, 2,5-dihidrofurilo, 2,3-dihidrotienilo, 2,5-dihidrotienilo, 2,3-dihidropirrolilo, 2,5-dihidropirrolilo, 2,3-dihidroisoxazolilo, 4,5-dihidroisoxazolilo, 2,5-dihidroisotiazolilo, 2,3-dihidropirazolilo, 4,5-dihidropirazolilo, 2,5-dihidropirazolilo, 2,3-dihidrooxazolilo, 4,5-dihidrooxazolilo, 2,5-dihidrooxazolilo, 2,3-dihidrotiazolilo, 4,5-dihidrotiazolilo, 2,5-dihidrotiazolilo, 2,3-dihidroimidazolilo, 4,5-dihidroimidazolilo, 2,5-dihidroimidazolilo, morfolinilo, piperidinilo, piperazinilo, azocanilo, tetrahidropiridazinilo, tetrahidropirimidinilo, tetrahidropirazinilo, 1,3,5-tetrahidrotriazinilo, 1,2,4-tetrahidrotriazin-1-ilo, 1,2,4-tetrahidrotriazin-3-ilo, 1,3-dihidrooxazinilo, 1,3-ditian-2-ilo, tetrahidropiranilo, 1,3-dioxolan-2-ilo, 3,4,5,6-tetrahidropiridin-2-ilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridin-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidropiridin-1-ilo, 1,2-dihidropiridin-1-ilo, 1,4-dihidropiridin-1-ilo, 4H-1,3-tiazinilo, 1,3-dihidrooxazin-2-ilo, azepanilo, 1,4-diazepanilo, tiomorfolinilo y ditiolanilo.

35 En particular, como grupos cicloalifáticos que pueden estar mono- o polisustituidos se mencionan ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, imidazolidinilo, tetrahidrofuranilo (tetrahidrofurilo), piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tetrahidrotiofenilo, tetrahidropiranilo, tiomorfolinilo, dioxolanilo, azepanilo, diazepanilo, azocanilo y ditiolanilo.

40 Cuando el grupo cicloalifático está condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico no sustituido o al menos monosustituido, éste se selecciona de entre el grupo consistente en 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioxinilo; 3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]-oxazinilo; benzo[1,3]dioxolilo; 1,2,3,4-tetrahidroquinazolinilo; indanilo; 1,2,3,4-tetrahidronaftilo; 1H-indenilo; 1,2,3,4-tetrahidroquinolinilo; 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo; 2,3-dihidro-1H-indolilo, 2,3-dihidro-1H-isoindolilo y decahidroisoquinolinilo.

45 Cuando los sustituyentes R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos como miembros del anillo, forman un grupo heterocicloalifático saturado o insaturado, mono- o polisustituido, preferentemente, éste está sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-CF₃, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -N(H)alquilo(C₁₋₅), -NO₂, -S-CF₃, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-N(H)alquilo(C₁₋₅) y fenilo; pudiendo en cada caso los grupo alquilo(C₁₋₅) ser lineales o ramificados y en cada caso los grupos fenilo estar no sustituidos o sustituidos con 1, 2 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo condistente en F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi.

55 En particular, los sustituyentes se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, -OH,

5 oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -(CH₂)-O-CH₃, -(CH₂)-O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -NO₂, -CF₃, -SF₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -NH-S(=O)₂-CH₃, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃ y fenilo, pudiendo el fenilo estar sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, metilo y metoxi.

Cuando los grupos heterocicloalifáticos presentan uno o más heteroátomos adicionales como miembros del anillo, preferentemente en cada caso 1, 2, 3, 4 ó 5, en especial 1, 2 ó 3 heteroátomos como miembro(s) del anillo, éstos se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en nitrógeno, oxígeno y azufre.

10 Como grupos heterocicloalifáticos adecuados que pueden estar mono- o polisustituídos se pueden citar, por ejemplo, imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y azocanilo.

Cuando el grupo heterocicloalifático está condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico no sustituido o al menos monosustituido, éste se selecciona adecuadamente de entre el grupo consistente en 3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazinilo, 1,2,3,4-tetrahydroquinazolinilo, 1,2,3,4-tetrahydroquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahydroisoquinolinilo, 2,3-dihidro-1H-indolilo, 2,3-dihidro-1H-isoindolilo y decahidroisoquinolinilo, no sustituidos o al menos monosustituídos

15 Cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² representan un grupo arilo o heteroarilo o incluyen un grupo arilo o heteroarilo, mono- o polisustituido, preferentemente éste está sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en halógeno, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)-OH, -(CH₂)-O-alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquinilo(C₂₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N-(alquilo(C₁₋₅))₂, -CH₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-N-(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH, -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -Si(fenil)₂[alquilo(C₁₋₅)], pirazolilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi, bencilo y fenetilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3, ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo, etilo, metoxi y etoxi.

30 Son especialmente preferentes los sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, -CH₂-OH, -CH₂-O-CH₃, -CH₂-O-C₂H₅, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, pirazolilo, pirrolilo, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -S(=O)₂-N(CH₃)₂, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH, -NH-S(=O)₂-CH₃, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-C(CH₃)₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -O-C(=O)-fenilo, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-N(CH₃)₂, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], fenilo, 1,3-dioxolanilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi y bencilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo y metoxi.

Como grupos arilo adecuados pueden citarse, por ejemplo, fenilo, 1-naftilo, 2-naftilo y antraceno.

40 Cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² representan un grupo heteroarilo o incluyen un grupo heteroarilo, preferentemente sus heteroátomos se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre. Preferentemente el grupo heteroarilo incluye en cada caso 1, 2, 3, 4 ó 5, en particular 1, 2 ó 3 heteroátomos.

45 Como grupos heteroarilo adecuados se pueden mencionar, por ejemplo, furilo (furanilo), tienilo (tiofenilo), pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, pirrolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piranilo, diazinilo, triazinilo, tetrazinilo, tetrazolilo, purinilo, ditiazolilo y pentazolilo.

50 Cuando el grupo heteroarilo está condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico no sustituido o al menos monosustituido, los grupos heteroarilo adecuados se pueden seleccionar de entre el grupo compuesto por indolilo, isoindolilo, benzo[b]furanilo, isobenzo[b]furanilo, indazolilo, indolizínilo, quinolinilo, isoquinolinilo, quinazolinilo, benzo[b]tiofenilo e isobenzo[b]tiofenilo, no sustituidos o al menos monosustituídos.

5 Cuando los sustituyentes R^{1a} y R^{1b} ó R^{1b} y R^{1c} ó R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado mono- o polisustituido, preferentemente éste está sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por halógeno, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N-(alquilo(C₁₋₅))₂, -CH₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-N-(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -Si(fenil)₂[alquilo(C₁₋₅)], pirazolilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi, bencilo y fenetilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo, etilo, metoxi y etoxi.

15 De forma especialmente preferente, los sustituyentes están sustituidos, independientemente entre sí, en cada caso cada con sustituyentes seleccionados del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, -CH₂-O-CH₃, -CH₂-O-C₂H₅, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, pirazolilo, pirrolilo, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-CH₃, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-C(CH₃)₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -O-C(=O)-fenilo, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-N(CH₃)₂, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], fenilo, (1,3)-dioxolanilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi y bencilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos estar en cada caso sustituidos con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo y metoxi.

25 En el contexto de la presente invención, por "sistema de anillo mono- o policíclico" se entienden grupos hidrocarburos mono- o policíclicos saturados, insaturados o aromáticos y que opcionalmente pueden tener uno o más heteroátomos como miembros del anillo. Este sistema mono- o policíclico puede estar condensado (fusionado) con un grupo cicloalifático, con un grupo arilo o con un grupo heteroarilo, por ejemplo. Cuando esté presente un sistema de anillo policíclico, por ejemplo un sistema de anillo bicíclico, los distintos anillos pueden tener, independientemente entre sí, un grado de saturación diferente, es decir puede ser saturado, insaturado o aromático. Preferentemente los heteroátomos de cada anillo se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre. Preferentemente, el anillo contiene 0, 1, 2 ó 3 heteroátomos. Los anillos respectivos del sistema de anillo policíclico son preferentemente de 5, 6 ó 7 miembros, en especial de 5 ó 6 miembros.

35 Cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² presentan un sistema de anillo mono- o policíclico mono- o polisustituido, éste puede estar sustituido en cada caso, preferentemente, con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por halógeno, -CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N(alquilo(C₁₋₅))(alquilo(C₁₋₅)), -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi y bencilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi.

45 Con especial preferencia, los sustituyentes se seleccionan, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, neopentilo, etenilo, propenilo, etinilo, propinilo, -CH₂-O-CH₃, -CH₂-O-C₂H₅, -OH, -SH, -NH₂, oxo, tioxo, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -S(=O)-CH₃, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, pirazolilo, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -CH₂-O-C(=O)-Fenilo, -NH-S(=O)₂-CH₃, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -O-C(=O)-fenilo, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-N(CH₃)₂, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi y bencilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, metilo y metoxi.

55 Cuando uno de los sustituyentes anteriormente mencionados R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d} y R² a R²⁹ presente un grupo alqueno lineal o ramificado, éste preferentemente se selecciona del grupo compuesto por -(CH₂)-, -(CH₂)₂-, -C(H)(CH₃)-, -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅- y -C(C₂H₅)(H)-.

El experto en la materia entenderá que cada uno de los compuestos imidazo-3-il-amina de fórmula general I sustituidos de acuerdo con la presente invención puede existir en forma de tautómeros, que son también objeto de la presente invención, y éstos también pueden encontrarse como principios activos en los medicamentos descritos más adelante.

Son preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de fórmula general I donde:

- 5 A¹ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1a},
 A² representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1b},
 A³ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1c},
 A⁴ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1d};
- 10 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d} representan, independientemente entre sí, en cada caso un grupo hidrógeno, un grupo halógeno; -NO₂; -CN; -NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -NH-C(=O)-R⁷; -C(=O)-R⁸; -C(=O)-NH₂; -C(=O)-NHR⁹; -C(=O)-NR¹⁰R¹¹; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2, 3, 4 ó 5; -O-C(=O)-R¹⁴; -(CH₂)_n-O-C(=O)-R¹⁵ con n = 1, 2, 3, 4 ó 5; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-OR¹⁷ con o = 1, 2, 3; 4 ó 5; -SR¹⁸; -(CH₂)_p-S(=O)_t-R¹⁹ con p = 1, 2, 3, 4 ó 5 con t = 0, 1 ó 2; -NH-S(=O)₂-R²⁶R²⁷; -S(=O)₂-NR²⁶R²⁹; -SF₅; un grupo alifático(C₁₋₁₀) lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático(C₃₋₈) saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente presenta al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido que puede estar unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado;
- 15 o, en cada caso, R^{1a} y R^{1b} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;
- 20 o, en cada caso, R^{1b} y R^{1c} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;
- o, en cada caso, R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;
- 25 R² y R³ representan, independientemente entre sí, en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-O-R²²; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-NHR²⁴; -(CH₂)_s-C(=O)-NHR²⁵ con s = 1, 2, 3, 4 ó 5; un grupo alifático(C₁₋₁₀) lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático(C₄₋₈) saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente presenta al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido que puede estar unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado;
- 30 o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno como miembro del anillo, forman un grupo heterocicloalifático(C₄₋₁₀) saturado o insaturado, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo y que está condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico no sustituido o al menos monosustituido;
- 35 R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁴ y R¹⁵ representan, independientemente entre sí, un grupo alifático(C₁₋₄) lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado;
- 40 R⁸, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹, representan, independientemente entre sí, un grupo hidrógeno; un grupo alifático(C₁₋₄) lineal o ramificado, saturado o insaturado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido por un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado;
- M¹ representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede sustituirse con al menos un sustituyente adicional y, opcionalmente, puede condensarse con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los anillos del sistema de anillo tienen 5, 6 ó 7 miembros, respectivamente; y
- 45 M² representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede estar no sustituido o al menos monosustituido y que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los anillos del sistema de anillos tienen 5, 6 ó 7 miembros;

donde

los grupos cicloalifáticos mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

los grupos heterocicloalifáticos mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

- 5 los anillos del sistema de anillo mono- o policíclico pueden presentar en cada caso opcionalmente 0, 1, 2 ó 3 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre; y

los grupos heteroarilo mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

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

Son especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde

- 15 A^1 representa un grupo C-R^{1a},
 A^2 representa un grupo C-R^{1b},
 A^3 representa un grupo C-R^{1c},
 A^4 representa un grupo C-R^{1d};
- o
- 20 A^1 representa un átomo de nitrógeno,
 A^2 representa un grupo C-R^{1b},
 A^3 representa un grupo C-R^{1c},
 A^4 representa un grupo C-R^{1d};
- o bien
- 25 A^1 representa un grupo C-R^{1a},
 A^2 representa un átomo de nitrógeno,
 A^3 representa un grupo C-R^{1c},
 A^4 representa un grupo C-R^{1d};
- o bien
- 30 A^1 representa un grupo C-R^{1a},
 A^2 representa un grupo C-R^{1b},
 A^3 representa un átomo de nitrógeno,
 A^4 representa un grupo C-R^{1d};
- o bien
- 35 A^1 representa un grupo C-R^{1a},
 A^2 representa un grupo C-R^{1b},
 A^3 representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un átomo de nitrógeno;

o bien

A¹ y A³ representan cada uno un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

5 A⁴ representa grupo C-R^{1d};

y donde el resto de los grupos R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹, M¹ y M² tienen el significado mencionado,

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

Son particularmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

15 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

20 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno,

25 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

30 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un átomo de nitrógeno;

y donde el resto de los grupos R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹, M¹ y M² tienen el significado mencionado,

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

Son muy especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

5 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno,

10 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

15 A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

y donde el resto de los grupos R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹, M¹ y M² tienen el significado mencionado,

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

20 Son particularmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan -H; -F; -Cl, -Br; -I; -NO₂; -CN; -CF₃; -SF₅; -NH₂; -S(=O)₂-NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2 ó 3; -O-C(=O)-R¹⁴; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2 ó 3; o un grupo alquilo(C₁₋₁₀) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileno(C₁₋₄) lineal o ramificado;

25 preferentemente R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan -H; -F; -Cl, -Br; -I; -NO₂; -CN; -CF₃; -SF₅; -NH₂; -S(=O)₂-NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2 ó 3; -O-C(=O)-R¹⁴; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2 ó 3; o un grupo alquilo lineal o ramificado seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, furanilo, tiofenilo y piridinilo, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, y en caso dado unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃;

30 con especial preferencia R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan -H; -F; -Cl, -Br; -CF₃; -CN; -SF₅; -C(=O)-OR¹²; -S(=O)₂-NH₂; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1 ó 2; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1 ó 2; un grupo alquilo lineal o ramificado seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo fenilo, no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, y en caso dado unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃;

35 con particular preferencia R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan -H; -F; -Cl, -Br; -CF₃; -CN; -SF₅; -S(=O)₂-NH₂; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1; un grupo alquilo lineal o ramificado seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo fenilo no sustituido, en caso dado unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃;

y los grupos A^1, A^2, A^3, A^4, R^2 a R^{29}, M^1 y M^2 restantes tienen el significado mencionado,

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

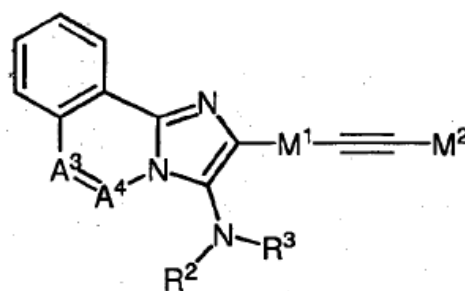
5

Son muy particularmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde R^{1a} y R^{1b} o R^{1b} y R^{1c} o R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, que puede estar sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅.

10 y los grupos A^1, A^2, A^3, A^4, R^2 a R^{29}, M^1 y M^2 restantes tienen el significado mencionado,

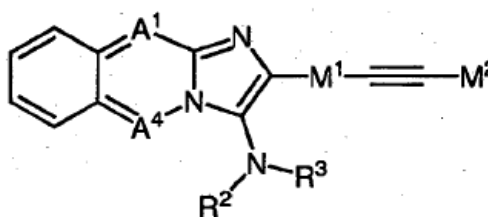
en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en especial de enantiómeros o diastereómeros, de racematos, o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes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

15 El experto entenderá que cuando R^{1a} y R^{1b} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, resulta la siguiente fórmula general Ia:



Ia

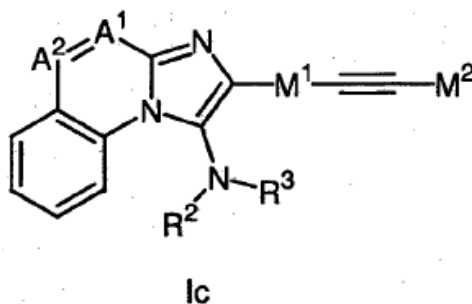
El experto entenderá que cuando R^{1b} y R^{1c} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, resulta la siguiente fórmula general Ib:



Ib

20

El experto entenderá que cuando R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, resulta la siguiente fórmula general Ic:



Se prefieren en particular los compuestos imidazo-3-il-amina de la fórmula general I mostrada donde R^2 y R^3 , independientemente entre sí, representan un grupo hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-C(=O)-NHR^{24}$; un grupo alquilo(C_{1-16}) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C_{4-8}) no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros no sustituido o al menos monosustituido que puede unirse a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado;

en especial, R^2 y R^3 representan, independientemente entre sí, en cada caso un grupo hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1, 2$ ó 3 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1, 2$ ó 3 ; un grupo alquilo(C_{1-10}) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C_{4-8}) no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y que opcionalmente se une a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, tiofenilo, furanilo y piridinilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y unido opcionalmente a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado;

en particular R^2 y R^3 representan, independientemente entre sí, un grupo hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1$ ó 2 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1$ ó 2 ; un grupo alquilo seleccionado de entre metilo; etilo; propilo; isopropilo; n-butilo; tert-butilo; sec-butilo; isobutilo; n-pentilo; n-hexilo; n-heptilo; n-octilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo; un grupo ciclopentilo o ciclohexilo no sustituido, que puede estar unido mediante un grupo $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$ ó $-(CH_2)_3-$; o un grupo fenilo o piridinilo no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$, $-C(H)(CH_3)-$ ó $-(CH_2)_3$;

y los grupos A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^4 a R^{29} , M^1 y M^2 restantes tienen el significado mencionado,

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

Son especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina de la fórmula general I mostrada donde uno de los grupos R^2 y R^3 representa hidrógeno o un grupo alquilo(C_{1-16}) lineal o ramificado, y el otro representa hidrógeno, $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-C(=O)-NHR^{24}$; un grupo alquilo(C_{1-16}) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C_{4-8}) no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado;

en particular uno de los dos grupos R^2 y R^3 es hidrógeno o un grupo alquilo(C_{1-10}) lineal o ramificado y el otro representa hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1, 2$ ó 3 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1, 2$ ó 3 ; un grupo alquilo(C_{1-10}) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C_{4-8}) no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, opcionalmente unido a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre fenilo, tiofenilo, furanilo y piridinilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de entre F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅ y en caso dado unido a través de un grupo alquileno(C_{1-3}) lineal o ramificado;

con especial preferencia, uno de los dos grupos R^2 y R^3 es hidrógeno o un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo; etilo; propilo; isopropilo; n-butilo; tert-butilo; sec-butilo; isobutilo; n-pentilo; n-hexilo; n-heptilo; n-octilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo; y el otro grupo representa hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1$ ó 2 ; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1$ ó 2 ; alquilo seleccionado de entre metilo; etilo; propilo; isopropilo; n-butilo; tert-butilo; sec-butilo; isobutilo; n-pentilo; n-hexilo; n-heptilo; n-octilo; 1,1,3,3-tetrametilbutilo, 1,1-dimetilpentilo y 1,1-dimetilbutilo; un grupo ciclopentilo o ciclohexilo no sustituido, que puede unirse a través de un grupo $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$ ó $-(CH_2)_3-$; o un grupo fenilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 2-furanilo, 3-furanilo, 2-tiofenilo ó 3-tiofenilo, no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$, $-C(H)(CH_3)-$ ó $-(CH_2)_3-$;

y los grupos A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^4 a R^{29} , M^1 y M^2 restantes tienen el significado mencionado,

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

También son preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde R^2 y R^3 junto con el átomo de nitrógeno, como miembro del anillo, forman un grupo seleccionados de entre el grupo compuesto por imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y azocanilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃;

preferentemente R^2 y R^3 junto con el átomo de nitrógeno, como miembro del anillo, forman un grupo seleccionado de entre imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y azocanilo;

y los grupos A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^4 a R^{29} , M^1 y M^2 restantes tienen el significado mencionado,

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

Son especial preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina de la fórmula general I mostrada donde R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{14} y R^{15} representan independientemente entre sí, un grupo alquilo(C₁₋₄) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquilen(C₁₋₅) lineal o ramificado;

preferentemente R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{14} y R^{15} , independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado de entre metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquilen(C₁₋₃) lineal o ramificado;

en especial R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{14} y R^{15} , independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado de entre metilo, etilo, n-propilo e isopropilo; o un grupo fenilo no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, opcionalmente unido a través de un grupo $-(CH_2)-$, $-(CH_2)_2-$ ó $-(CH_2)_3-$;

y los grupos A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 , R^3 , R^8 , R^{12} , R^{13} y R^{16} a R^{29} , M^1 y M^2 restantes tienen el significado ya mencionado,

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

Son especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina de la fórmula general I mostrada donde $R^8, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}, R^{23}, R^{24}, R^{25}, R^{26}, R^{27}, R^{28}$ y R^{29} representan, independientemente entre sí, hidrógeno; un grupo alquilo(C_{1-8}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que se puede unir a través de un grupo alquileo(C_{1-5}) lineal o ramificado;

5 en particular $R^8, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}, R^{23}, R^{24}, R^{25}, R^{26}, R^{27}, R^{28}$ y R^{29} representan, independientemente entre sí, hidrógeno; un grupo alquilo(C_{1-4}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, que se puede unir a través de un grupo alquileo(C_{1-3}) lineal o ramificado;

10 con especial preferencia $R^8, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}, R^{23}, R^{24}, R^{25}, R^{26}, R^{27}, R^{28}$ y R^{29} , independientemente entre sí, representan hidrógeno; un grupo alquilo seleccionado de entre metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo; o un grupo fenilo no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

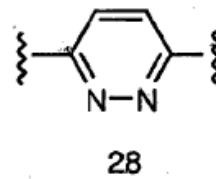
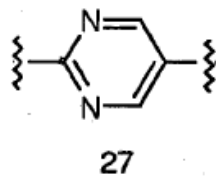
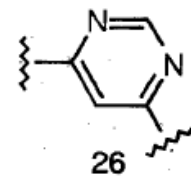
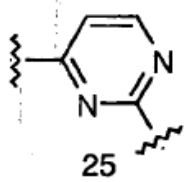
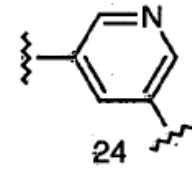
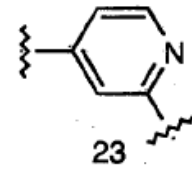
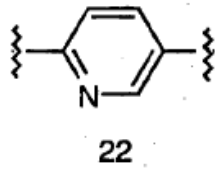
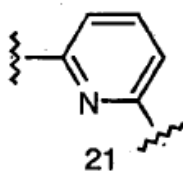
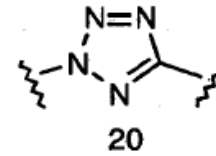
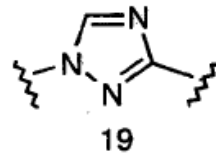
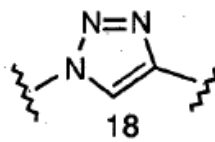
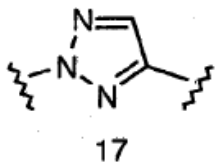
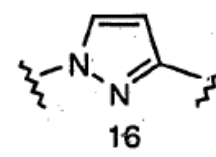
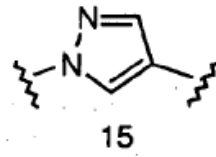
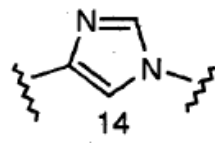
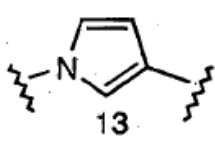
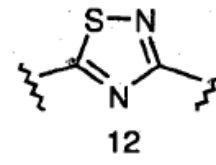
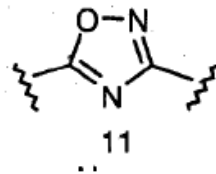
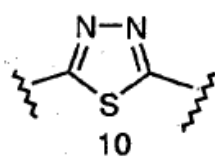
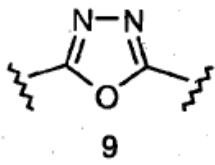
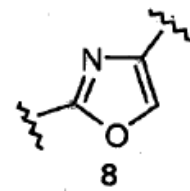
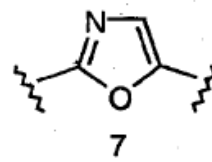
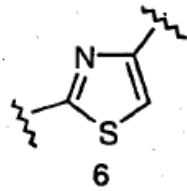
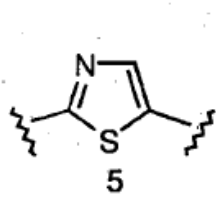
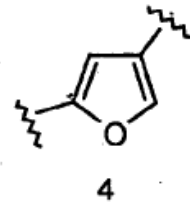
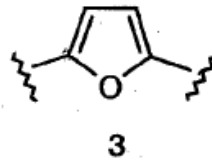
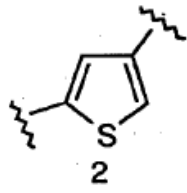
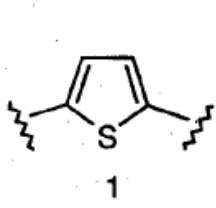
15 y los grupos $A^1, A^2, A^3, A^4, R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^2$ a R^7, R^9 a R^{11}, R^{14} y R^{15}, M^1 y M^2 restantes tienen el significado ya mencionado,

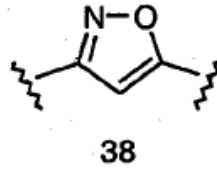
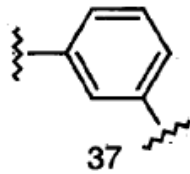
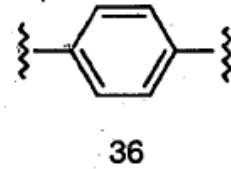
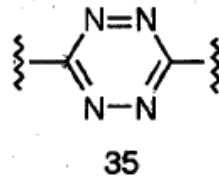
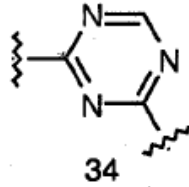
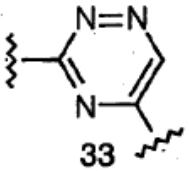
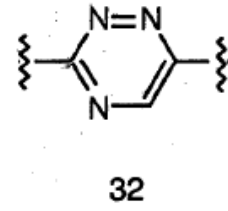
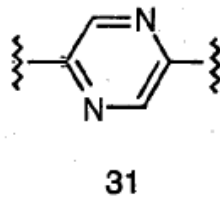
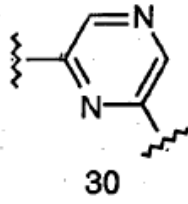
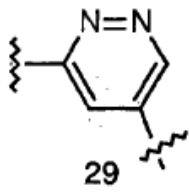
en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en especial de enantiómeros o diastereómeros, de racematos, o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla, o en cada caso en forma de sales correspondientes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

20 También son preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde M^1 representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional, donde el grupo heteroarilo presenta opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo que se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

25 En especial M^1 representa un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre fenilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, diazinilo, triazinilo, tetrazinilo y tetrazolilo, que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional;

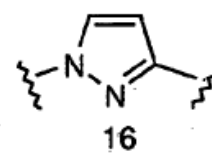
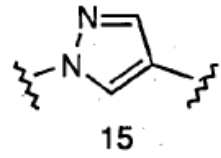
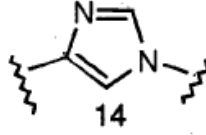
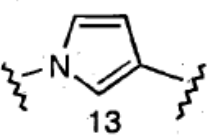
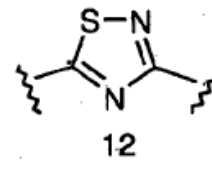
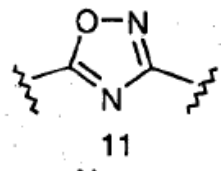
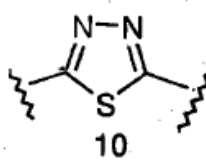
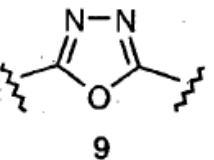
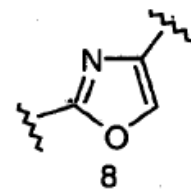
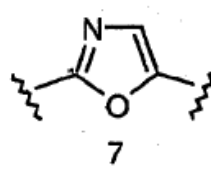
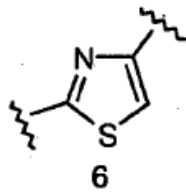
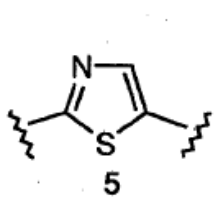
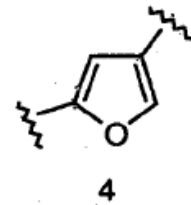
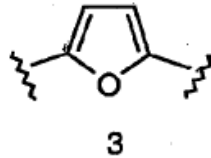
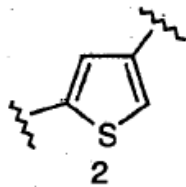
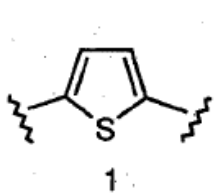
con especial preferencia M^1 representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 38 siguientes:



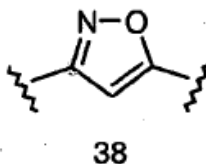
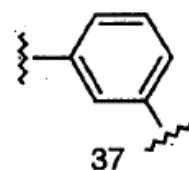
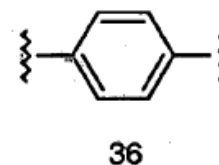
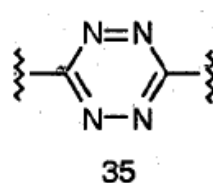
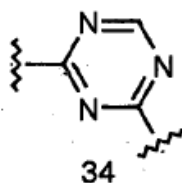
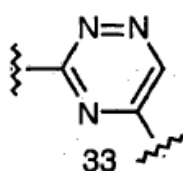
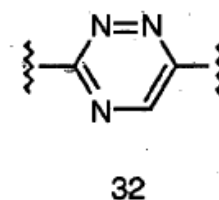
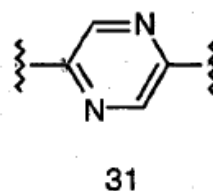
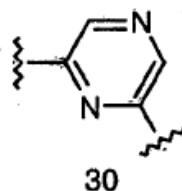
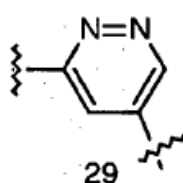
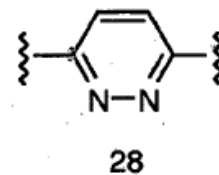
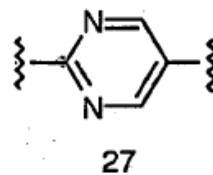
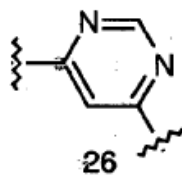
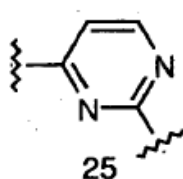
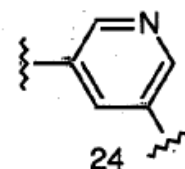
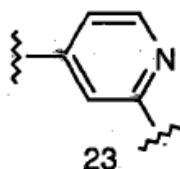
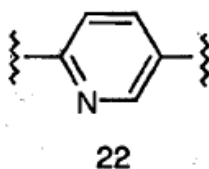
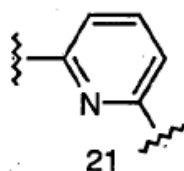
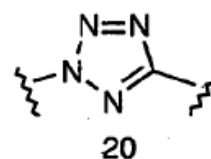
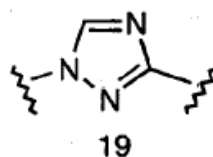
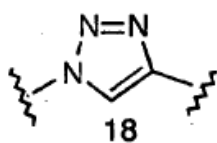
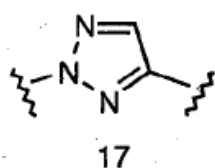


preferentemente unido en el sentido según las posiciones mostradas en la estructura básica y que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional;

con mayor preferencia M¹ representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 38:

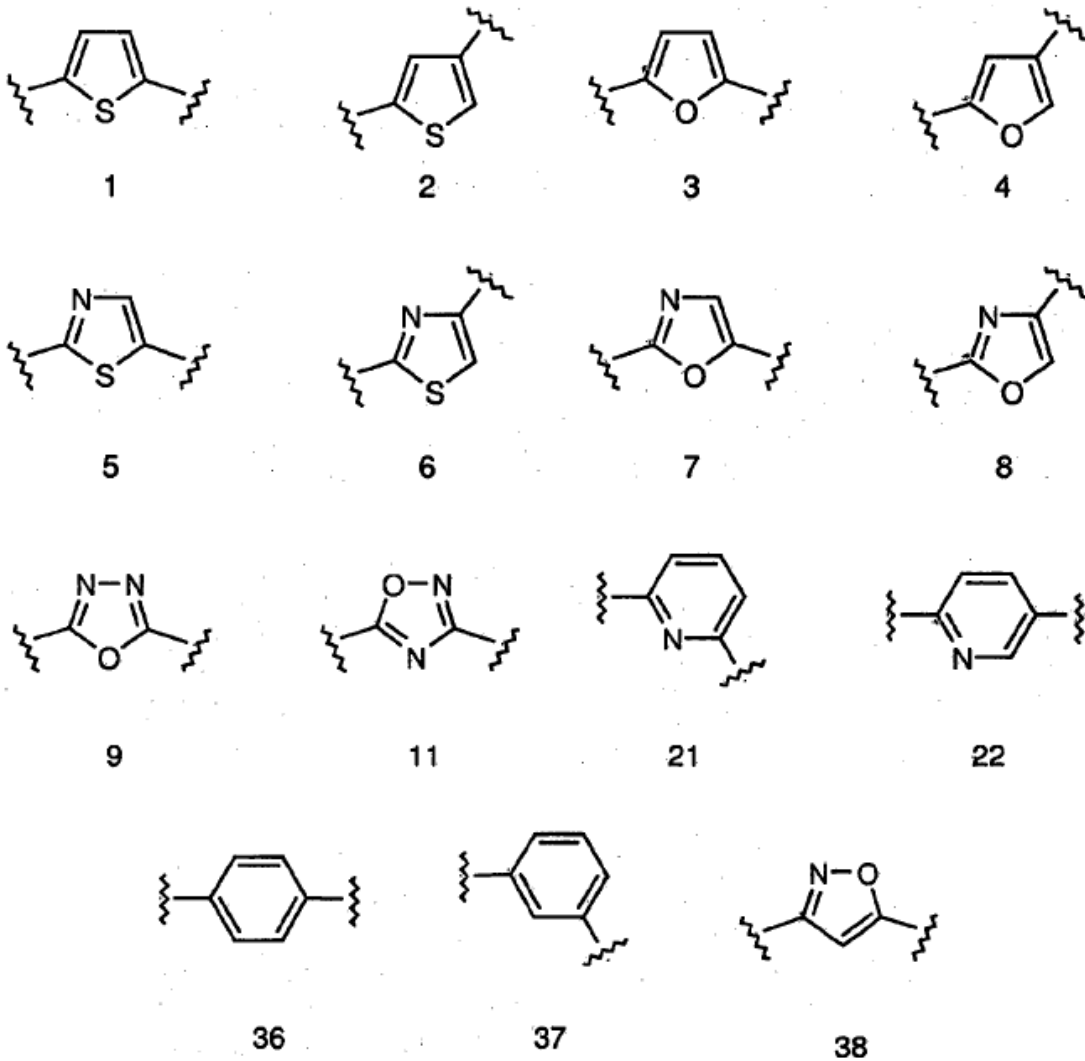


5



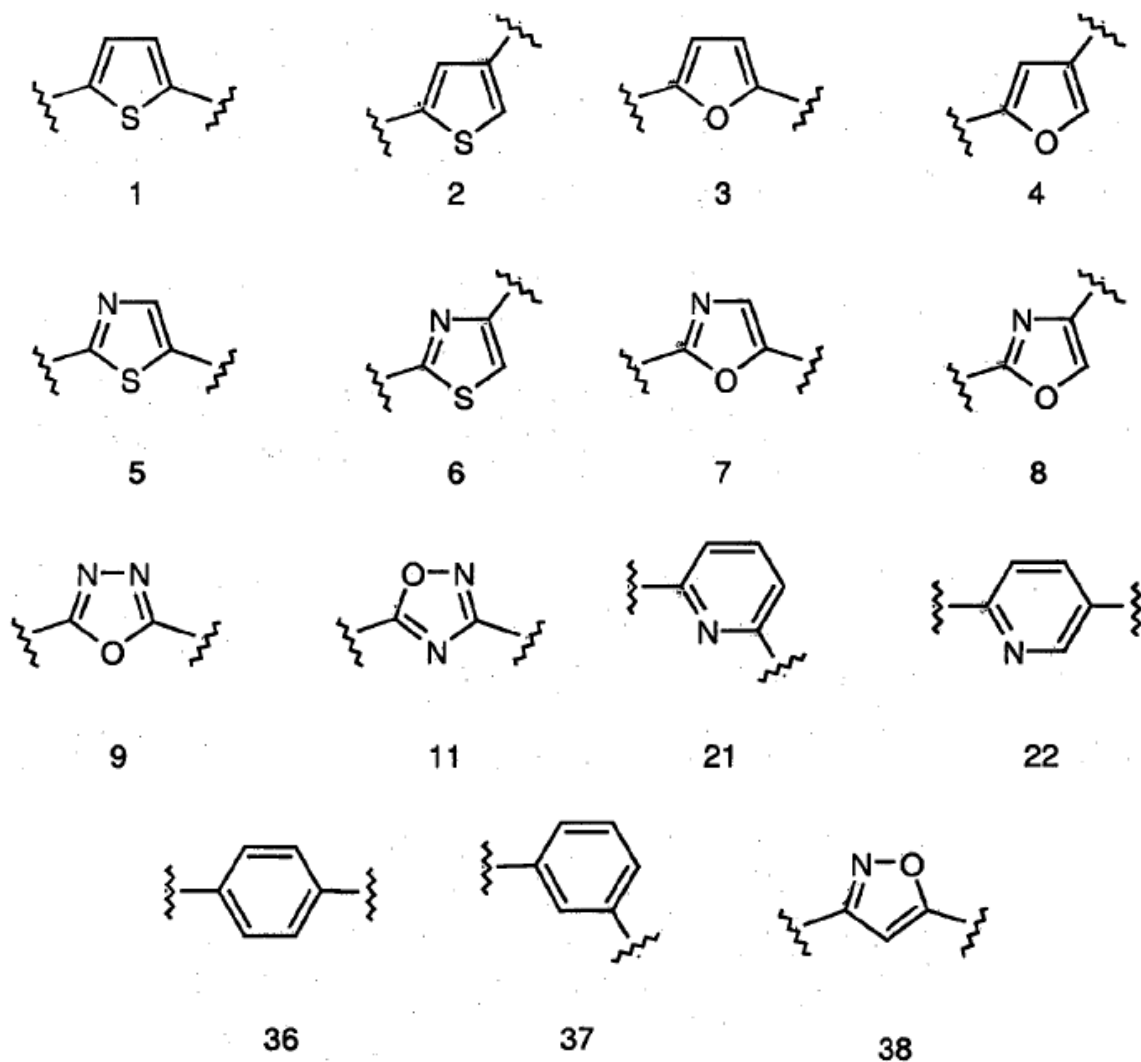
5 preferentemente unido en el sentido según las posiciones mostradas en la estructura básica y que puede estar opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes adicionales seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -C(=O)-CH₃ y -C(=O)-C₂H₅;

con particular preferencia, M¹ representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 9, 11, 21, 22 y 36 a 38:



preferentemete unido en el sentido según las posiciones mostradas en la estructura básica y que puede estar opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes adicionales seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -C(=O)-CH₃ y -C(=O)-C₂H₅;

Sin embargo preferentemente M¹ representa un grupo seleccionado del grupo compuesto por los grupos 1 a 9, 11, 21, 22 y 36 a 38:



preferentemente unido en el sentido según las posiciones mostradas en la estructura básica y que puede estar opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes adicionales seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-CF₃;

y los grupos A¹, A², A³, A⁴, R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M² restantes tienen el significado ya mencionado,

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

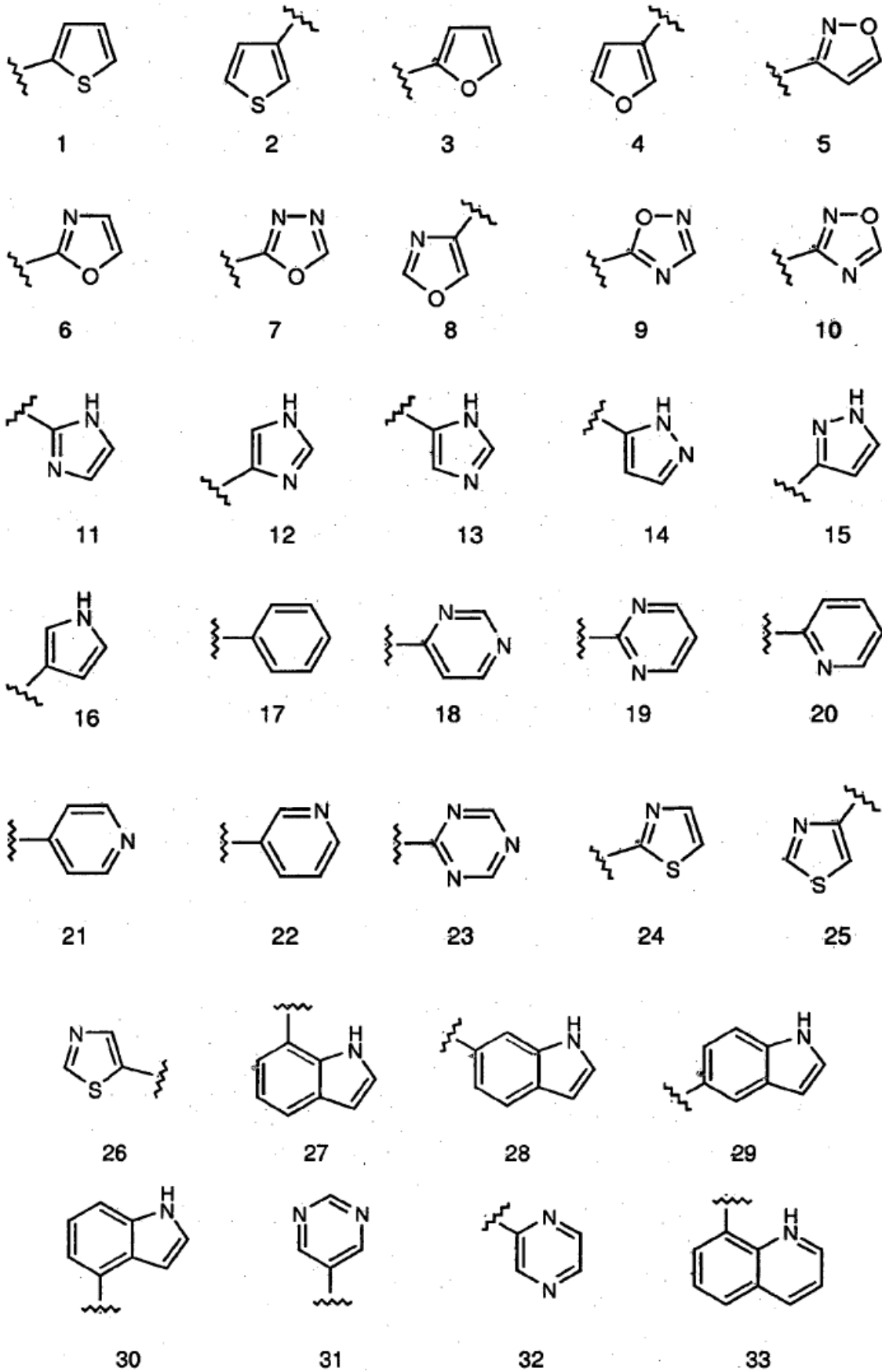
Son particularmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general I mostrada donde M² representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, donde el grupo heteroarilo presenta opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre; y donde el grupo arilo o heteroarilo se puede condensar con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, en cuyo caso los anillos del sistema de anillo tienen 5 ó 6 miembros y pueden presentar en cada caso 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

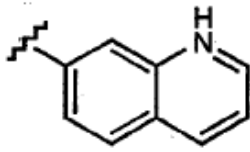
preferentemente M² representa un grupo seleccionado del grupo compuesto por fenilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, diazinilo, triazinilo, tetrazinilo, tetrazolilo, pentazolilo, imidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, naftilo, indolilo, isoindolilo,

benzofuranilo, isobenzofuranilo, benzotiofenilo e isobenzotiofenilo, donde el grupo puede estar no sustituido o al menos monosustituido;

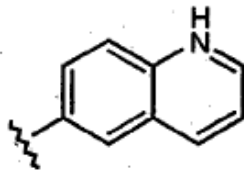
5 en especial M² representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, piridinilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, diazinilo, triazinilo, tetrazinilo, tetrazolilo, pentazolilo, imidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, naftilo, indolilo, isoindolilo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, benzotiofenilo e isobenzotiofenilo; donde el grupo respectivo puede estar no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -N(C₂H₅)₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H, -S-CF₃, -SH, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂;

con mayor preferencia M² representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 36:

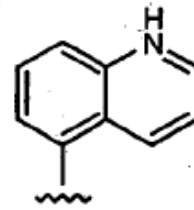




34



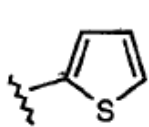
35



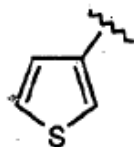
36

5 que se une según la posición mostrada en la estructura básica, pudiendo el grupo respectivo estar no sustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -N(C₂H₅)₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -C(=O)-H, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂;

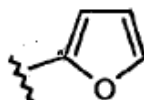
sin embargo preferentemente M² representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 36:



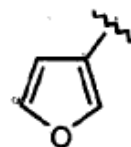
1



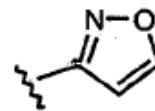
2



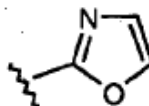
3



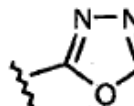
4



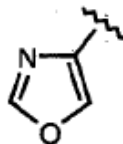
5



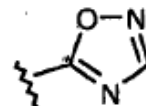
6



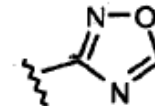
7



8

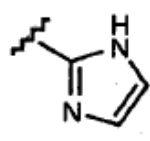


9

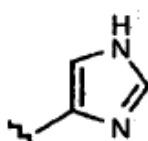


10

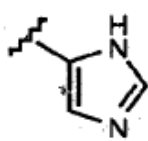
10



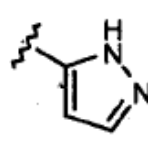
11



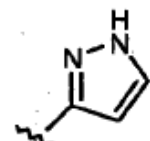
12



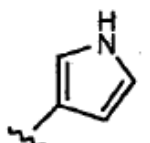
13



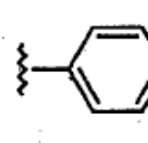
14



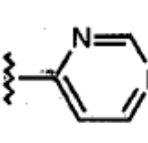
15



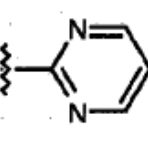
16



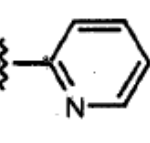
17



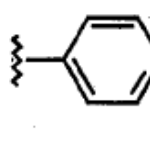
18



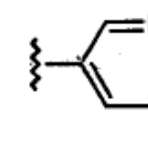
19



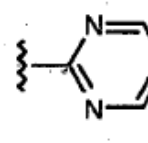
20



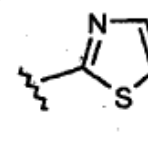
21



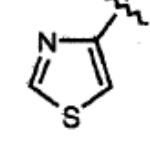
22



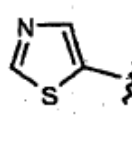
23



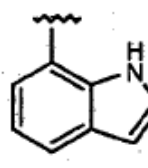
24



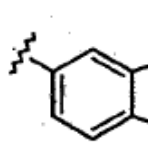
25



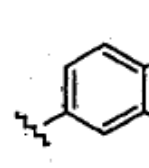
26



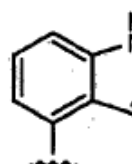
27



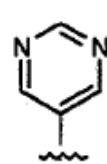
28



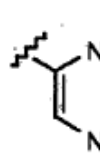
29



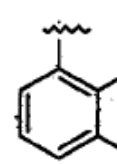
30



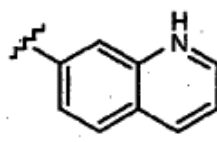
31



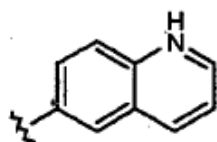
32



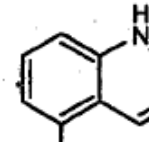
33



34



35



36

5 que se une según la posición mostrada en la estructura básica, pudiendo el grupo respectivo puede no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, iso-propilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -O-CF₃, -C(=O)-H, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], -NO₂, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃,

C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂;

y los grupos A¹, A², A³, A⁴, R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ restantes tienen el significado ya mencionado,

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

Son especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina de fórmula general I donde:

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

- 10 A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c} y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

- 15 A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c} y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

- 20 A² representa un átomo de nitrógeno,

A³ representa un grupo C-R^{1c} y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

- 25 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan en cada caso -H; -F; -Cl, -Br; -I; -NO₂; -CN; -CF₃; -SF₅; -NH₂; -S(=O)-NH₂, -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2 ó 3; -O-C(=O)-R¹⁴; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-OR¹⁷ con o = 1, 2 ó 3; un grupo alquilo lineal o ramificado seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, furanilo, tiofenilo y piridinilo, en cada caso no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -

- 30 (CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;
- o en cada caso R^{1a} y R^{1b} ó R^{1b} y R^{1c} ó R^{1c} y R^{1d}, junto con el enlace C-C, forman un grupo fenilo fusionado, que puede estar sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅;

- 35 R² y R³, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2 ó 3; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2 ó 3; un grupo alquilo(C₁₋₁₀) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C₄₋₈) no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, opcionalmente unido a través de un grupo alquilenol(C₁₋₃) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, tiofenilo, furanilo y piridinilo, no sustituido u
- 40 opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo alquilenol(C₁₋₃) lineal o ramificado;

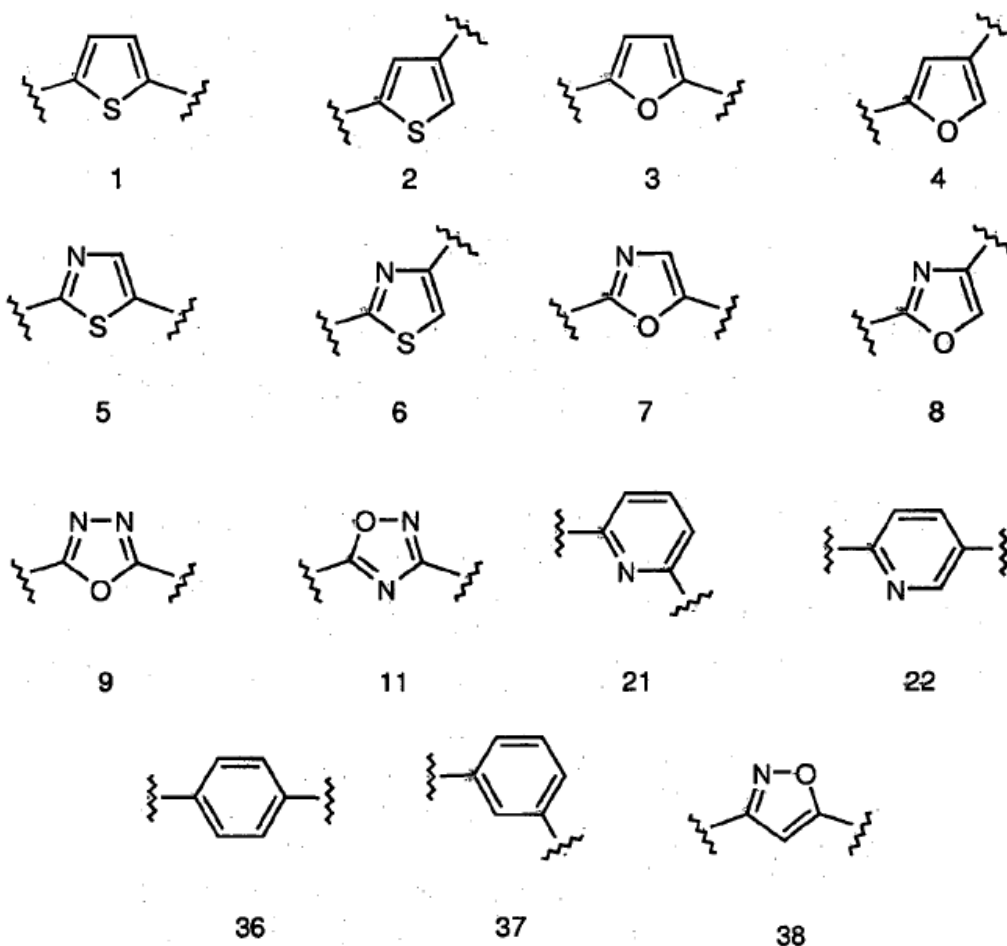
o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno como miembro del anillo, forman un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y

- 5 azocanilo, no sustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃;

R⁴, R⁵, R⁶ y R¹⁴, independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado de entre metilo, etilo, n-propilo e isopropilo; o un grupo fenilo, no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

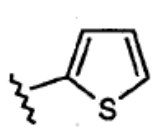
- 10 R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R²⁰, R²¹ y R²³, independientemente entre sí, representan hidrógeno; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo; o un grupo fenilo no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

- 15 M¹ representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 9, 11, 21, 22 y 36 a 38:

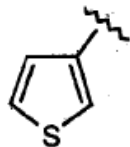


- 20 que se puede unir según la posición mostrada con línea ondulada al biciclo y al átomo de carbono del triple enlace, opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CH, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-CF₃; y

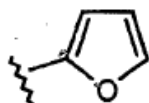
M² representa un grupo seleccionado de entre los grupos 1 a 36:



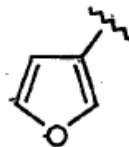
1



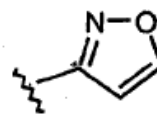
2



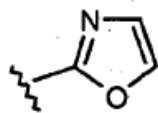
3



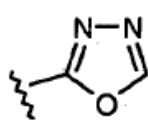
4



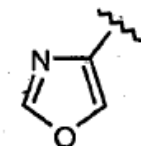
5



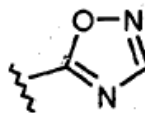
6



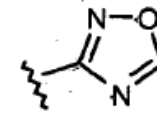
7



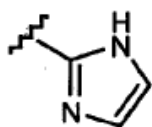
8



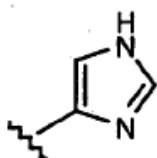
9



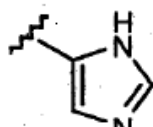
10



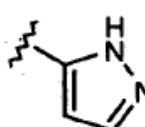
11



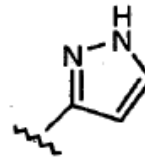
12



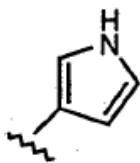
13



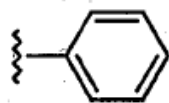
14



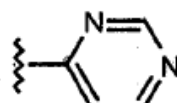
15



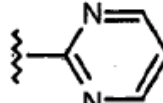
16



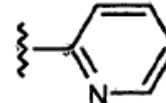
17



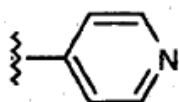
18



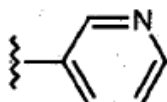
19



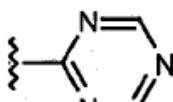
20



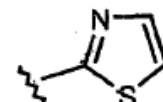
21



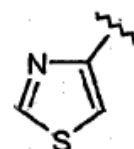
22



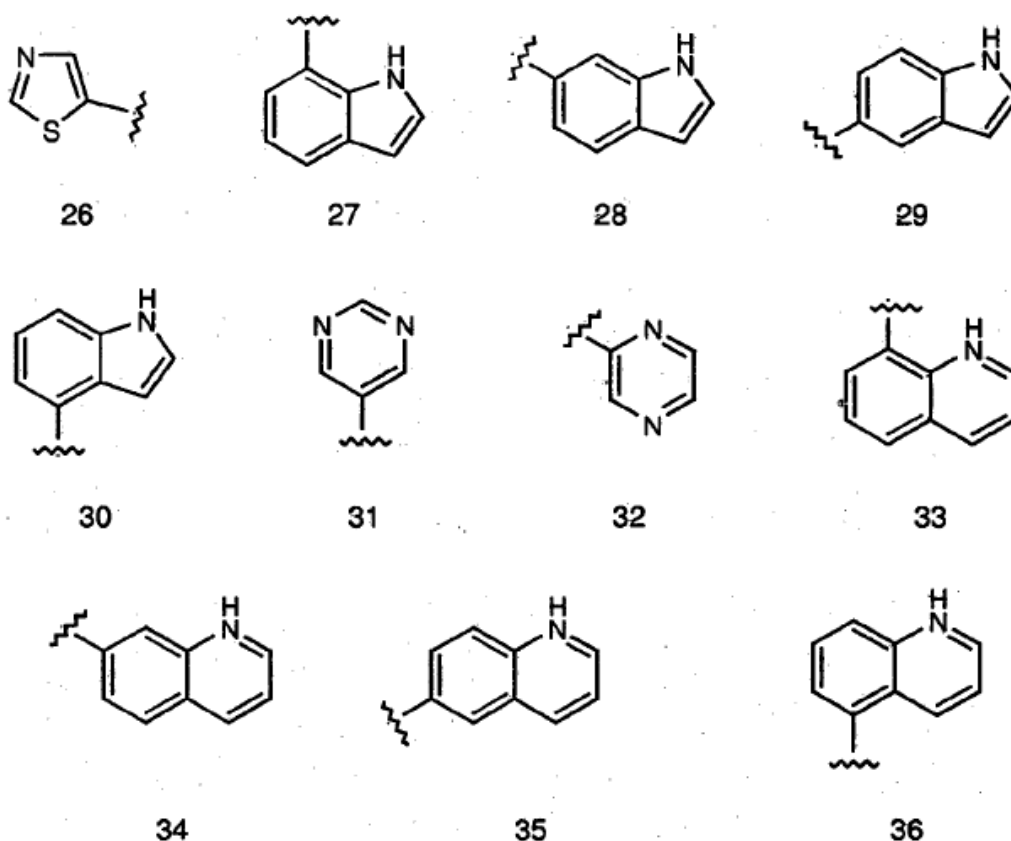
23



24



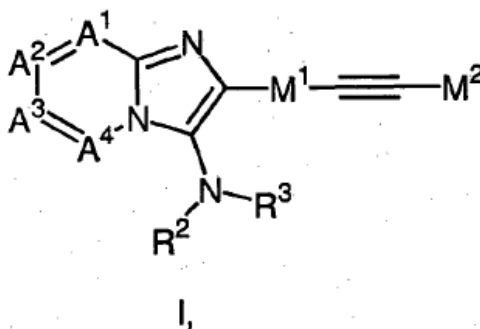
25



5 que se puede unir en cualquier posición según la línea ondulada con el biciclo y el átomo de carbono del triple enlace, no sustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -O-CF₃, -C(=O)-H, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], -NO₂, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -S(=O)₂-N(CH₃)₂, -NH-S(=O)₂-OH y -NH-C(=NH)-NH₂;

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

Son muy especialmente preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de fórmula general I



15 donde:

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c}, y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

o

5 A¹ representa un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c}, y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

o

10 A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno,

A³ representa un grupo C-R^{1c}, y

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

15 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, en cada caso independientemente entre sí, representan hidrógeno, -OR¹⁶; -F; -Cl, -Br; -CF₃, -CN; -S(=O)₂-NH₂; -C(=O)-OR¹², un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo y tert-butilo; un grupo fenilo; un grupo bencilo; un grupo fenetilo o un grupo (3-fenil)prop-1-ilo;

o en cada caso R^{1a} y R^{1b} forman un grupo fenilo fusionado y no sustituido junto con el enlace C-C al cual se unen;

o en cada caso R^{1c} y R^{1d} forman un grupo fenilo fusionado y no sustituido junto con el enlace C-C al cual se unen;

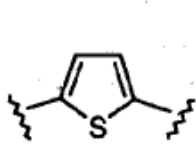
20 R² y R³, independientemente entre sí, en cada caso representan hidrógeno, -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1; un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, tert-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, 1,1,3,3-tetrametilbutilo; 1,1-dimetilpentilo y 1,2-dimetilbutilo; un grupo ciclohexilo o ciclopentilo no sustituido, en cada caso unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- o -(CH₂)₃; o un grupo fenilo, piridinilo, tiofenilo o furanilo, en cada caso no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y unido opcionalmente a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂-, -(CH(CH₃))- o -(CH₂)₃,

o R² y R³ junto con el átomo de nitrógeno al que se unen, como miembro del anillo, forman un grupo heterocicloalifático seleccionado del grupo formado por pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo y morfolinilo,

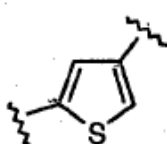
30 R¹² representa hidrógeno o un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo;

R¹⁶, R²⁰, R²¹ y R²³, en cada caso independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo, o un grupo fenilo que, en vlcada caso, está no sustituido o sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, metilo, etilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y, opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂),

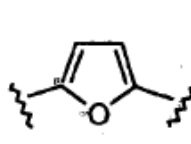
35 M¹ representa un grupo seleccionado del grupo formado por los grupos 1 a 6, 21, 22, 36 y 37:



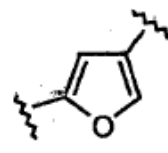
1



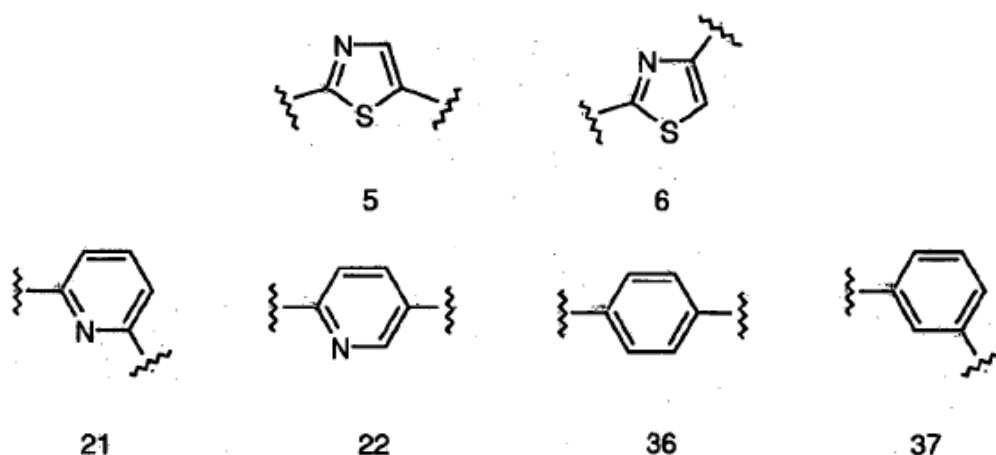
2



3



4



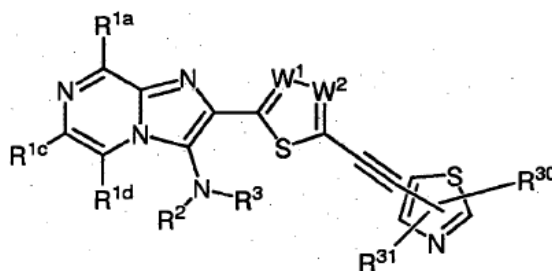
5 donde dicho grupo puede estar unido en la dirección deseada a las posiciones caracterizadas en la estructura básica y opcionalmente está sustituido con 1 ó 2 sustituyentes adicionales, que se pueden seleccionar, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-CF₃,

y

10 M² representa un grupo seleccionado del grupo formado por fenilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 4-indolilo, 5-indolilo, 6-indolilo, 7-indolilo, 2-tiofenilo, 3-tiofenilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 5-quinolinilo, 6-quinolinilo, 7-quinolinilo y 8-quinolinilo, donde el grupo correspondiente está no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH; -S(=O)₂-N(CH₃)₂ y -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃],

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

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general Id:



Id,

donde

R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ en cada caso tienen los significados indicados anteriormente;

25 W¹ representa C y W² representa C,

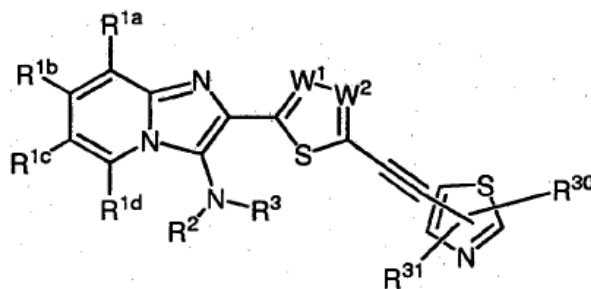
o W¹ representa C y W² representa N,

o W^1 representa N y W^2 representa C, y

5 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (Ie):



Ie,

10

donde

en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^1 representa C y W^2 representa C,

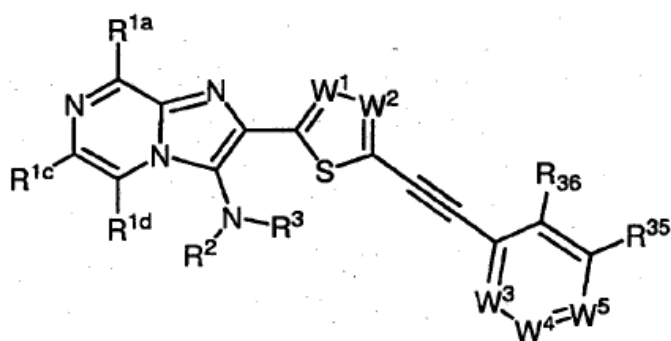
o W^1 representa C y W^2 representa N,

15 o W^1 representa N y W^2 representa C, y

20 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (If):



If

donde

en cada caso R^{1a} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^1 representa C y W^2 representa C,

5 o W^1 representa C y W^2 representa N,

o W^1 representa N y W^2 representa C,

W^3 representa C- R^{32} ; W^4 representa C- R^{33} y W^5 representa C- R^{34} ;

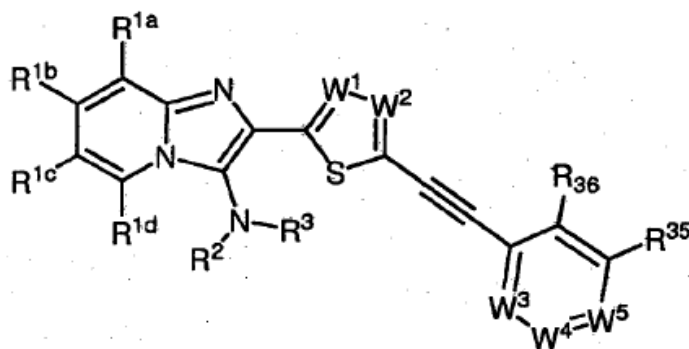
o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos se seleccionan del grupo formado por W^3 , W^4 y W^5 representa C- R^{32} o C- R^{33} ;

10 y R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

15

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (Ig):



Ig

donde

20 en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^1 representa C y W^2 representa C,

o W^1 representa C y W^2 representa N,

o W^1 representa N y W^2 representa C,

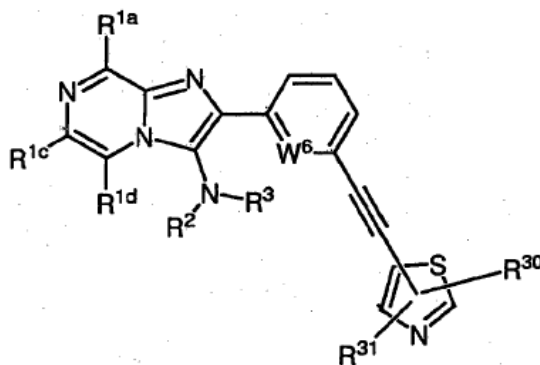
W^3 representa C- R^{32} ; W^4 representa C- R^{33} y W^5 representa C- R^{34} ;

- 5 o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos se seleccionan del grupo formado por W^3 , W^4 y W^5 representa C- R^{32} o C- R^{33} ;

- 10 y R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (Ih):



Ih,

15

donde

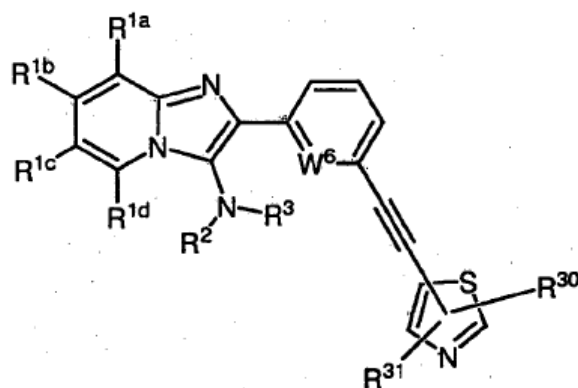
en cada caso R^{1a} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^6 representa C o N; y

- 20 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, (1,3)-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

- 25 en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (Ik):



Ik,

donde

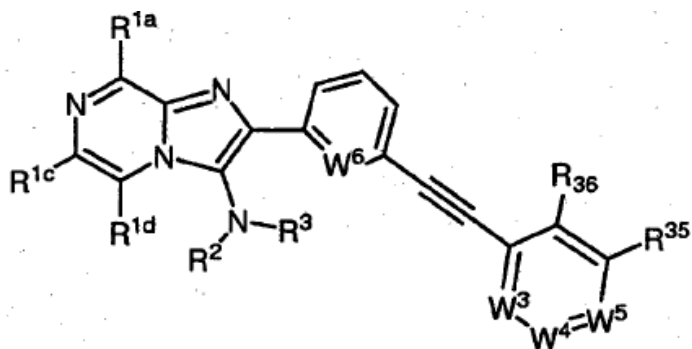
en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^6 representa C o N; y

- 5 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,
- 10

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (Im):



Im

donde

- 15 en cada caso R^{1a} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen el significado que se indica en la reivindicación 14;

W^6 representa C o N,

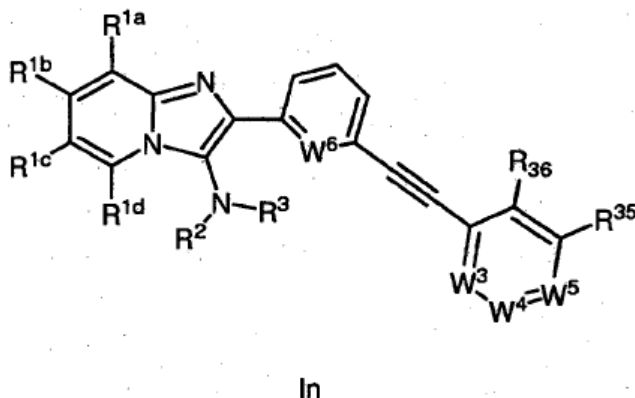
W^3 representa C-R³²; W^4 representa C-R³³ y W^5 representa C-R³⁴;

o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos se seleccionan del grupo formado por W^3 , W^4 y W^5 representa C-R³² o C-R³³;

5 y R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son muy especialmente preferentes los compuestos de fórmula general (In):



10 donde

en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados anteriormente;

W^6 representa C o N,

W^3 representa C- R^{32} ; W^4 representa C- R^{33} y W^5 representa C- R^{34} ;

15 o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos se seleccionan del grupo formado por W^3 , W^4 y W^5 representa C- R^{32} o C- R^{33} ;

20 y R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

Son particular preferentes los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de fórmula general (I) seleccionados del grupo formado por:

- 25 [1] ciclopentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
 [2] ciclohexilmetil-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [3] ciclohexilmetil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [4] ciclohexilmetil-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [5] ciclohexilmetil-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 30 [6] ciclohexilmetil-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [7] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]ciclohexilmetil-amina,

- [8] ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
[9] ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
[10] (4-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[11] (4-metoxibencil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
5 [12] (4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[13] (4-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[14] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina,
[15] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina,
[16] (4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
10 [17] (4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
[18] tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
[19] tert-butil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[20] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina,
[21] (3-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
15 [22] (3-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[23] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina,
[24] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina,
[25] (3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[26] (3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
20 [27] [6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
[28] [7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
[29] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
[30] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
[31] (1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
25 [32] (2-clorobencil)-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[33] (3-cloro-4-fluorofenil)-[7-fenil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[34] (4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
[35] [8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
[36] [7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
30 [37] (2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[38] (2-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[39] (2-clorobencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
[40] (2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
[41] (3-metoxifenil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
35 [42] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina,
[43] (3-metoxifenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,

- [44] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-metoxibencil)-amina,
- [45] (2-clorobencil)-[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [46] [7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-cloro-4-fluorofenil)-amina,
- [47] (3-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
- 5 [48] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina,
- [49] [7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina,
- [50] (2,4-difluorofenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-7-(3-fenilpropil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [51] (4-fluorobencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [52] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-fluorobencil)-amina,
- 10 [53] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina,
- [54] [7-isopropil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina,
- [55] tert-butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [56] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [57] butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- 15 [59] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [60] [2-(5-piridiniltiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [61] [2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [62] [6-cloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [63] [6,8-dicloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- 20 [64] [2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [65] dimetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [66] metil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [67] N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]acetamida,
- [68] etil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- 25 [69] propil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [70] butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [71] (2-metilpropil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [72] pentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [73] {(metoxicarbonilmetil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amino}acetato de metilo,
- 30 [74] bencil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [75] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamino]acetato de metilo,
- [76] tert-butil-[2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [77] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [78] N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-benzamida,
- 35 [79] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-bis-piridin-3-ilmetil-amina,
- [80] 2,2-dimetil-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]propionamida,

- [81] 3-metoxi-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]benzamida,
- [82] tert-butil-[2-(5-piridin-3-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [83] 2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina,
- [84] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo,
- 5 [85] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- [86] 2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [87] N-ciclohexil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [88] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(piperidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina,
- [89] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 10 [90] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]piridin-6-carboxilato de metilo,
- [91] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [92] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [93] N,N-dietil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [94] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 15 [95] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [96] 8-bromo-N-tert-butil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [97] N-tert-butil-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [98] N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [99] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(pirrolidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina, clorhidrato,
- 20 [100] N-tert-butil-2-(5-((4-fluorofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [101] N-tert-butil-7-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [102] N-tert-butil-5-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [103] 8-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [104] N-tert-butil-2-(5-((3-fluorofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 25 [105] N-tert-butil-2-(5-((2-fluorofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [106] 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo,
- [107] N-terr-butil-2-(5-(pirazin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [108] 2-(5-((4-aminofenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [109] N-isopropil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 30 [110] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [111] N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [112] N-tert-butil-2-(5-((2-metoxifenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [113] N-tert-butil-2-(5-((3-metoxifenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [114] N-tert-butil-2-(5-((4-metoxifenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 35 [115] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]quinolin-1-amina,
- [116] N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,

- [117] N-tert-butil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etnil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [118] N-tert-butil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [119] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [120] ácido 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxílico,
- 5 [121] 4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)fenol, clorhidrato,
- [122] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)fenol,
- [123] 2-(5-((3-aminofenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [124] 2-(5-((2-aminofenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [125] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[2,1-a]isoquinolin-3-amina,
- 10 [126] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [127] N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [128] 2-(5-((6-aminopiridin-3-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [129] N-tert-butil-2-(5-(pirimidin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [130] N-tert-butil-2-(5-((4-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 15 [131] N-tert-butil-2-(5-((5-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [132] N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
- [133] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [134] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [135] N-tert-butil-2-(5-((5-metiltiofen-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 20 [136] 2-(5-((6-aminopiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [137] N-tert-butil-2-(5-((3-metiltiofen-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [138] N-tert-butil-2-(4-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [139] N-tert-butil-2-(5-(m-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [140] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzonitrilo, clorhidrato,
- 25 [141] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- [142] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [143] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [144] 4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzonitrilo, clorhidrato,
- [145] 2-(5-((1H-indol-6-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 30 [146] N-tert-butil-2-(2-(feniletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [147] N-tert-butil-2-(5-(quinolin-6-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina clorhidrato,
- [148] 2-(5-((3-(1H-pirrol-1-il)fenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [149] 2-(5-((1H-indol-4-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [150] N-tert-butil-2-(5-((3-nitrofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 35 [151] N-tert-butil-2-(5-((4-nitrofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [152] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,

- [153] 2-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)fenol,
- [154] 2-(5-((3-(aminometil)fenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [155] 2-(5-(bifenil-3-iletinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [156] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 5 [157] N-tert-butil-2-(5-((3-(dimetilamino)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [158] N-tert-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [159] N-tert-butil-2-(5-((3-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [160] N-tert-butil-2-(5-((3-(metilamino)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [161] N-tert-butil-2-(5-(p-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 10 [162] N-tert-butil-2-(5-(o-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [163] N-tert-butil-2-(4-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [164] N-tert-butil-2-(4-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [165] N-tert-butil-2-(5-((6-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [166] N-tert-butil-2-(5-((2-nitrofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 15 [167] N-tert-butil-8-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [168] N-tert-butil-2-(5-((6-metoxipiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [169] N-tert-butil-2-(5-((5-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [170] 2-(4-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)-2-(feniletinil)fenil)-acetnitrilo,
- [171] N-tert-butil-2-(5-((5-metoxipiridin-3-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 20 [172] 5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-nicotinonitrilo, clorhidrato,
- [173] N-tert-butil-2-(5-((3-(metiltio)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [174] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)benzoato de metilo,
- [175] N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [176] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 25 [177] N-tert-butil-2-(2-(piridin-4-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [178] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzaldehído,
- [179] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-4-fluorobenzonitrilo,
- [180] N-tert-butil-2-(5-((3-(trifluorometil)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [181] N-tert-butil-2-(2-(piridin-2-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 30 [182] N-tert-butil-2-(3-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [183] N-tert-butil-2-(3-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [184] N-tert-butil-2-(5-((3-vinilfenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [185] 2-(5-((1H-imidazol-4-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [186] N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 35 [187] N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [188] N-tert-butil-2-(5-((2-(tert-butildifenilsilil)tiazol-5-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [189] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzotrilo,
- [190] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [191] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-5-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [192] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
- 5 [193] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etnil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [194] 5,7-dimetil-N-fenetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- [195] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- [196] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- [197] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- 10 [198] N-(4-clorobencil)-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [199] N-(3-metoxifenetil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [200] N-(2-metilhexan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [201] N-fenetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [202] N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 15 [203] 2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [204] N-(4-clorobencil)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [205] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [206] N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [207] N-(2-metoxibencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 20 [208] N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [209] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [210] 8-bromo-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etnil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [211] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [212] N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 25 [213] N-(1-feniletil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [214] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [215] 8-bromo-N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [216] N-ciclopentil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [217] N-(3-metoxifenetil)-7-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- 30 [218] 8-(benciloxi)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [219] 8-(benciloxi)-N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [220] 8-(benciloxi)-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [221] 6-cloro-N-(4-fluorobencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [222] 6-bromo-N-butil-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 35 [223] N-(furan-2-il)-8-metil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [224] N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [225] N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)-7-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [226] 5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(3-(trifluorometil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [227] 6-bromo-N-(4-clorofenetil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [228] N-(4-clorofenetil)-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 5 [229] N-fenetil-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [230] N-(4-clorobencil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [231] 6-bromo-N-(4-clorobencil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [232] 8-bromo-N-(4-clorobencil)-6-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [233] N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-5-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [234] 6-bromo-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [235] 7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [236] 6,8-dibromo-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [237] 6-bromo-N-(2,6-dimetilfenil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [238] N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 15 [239] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [240] N-ciclopentil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [241] 8-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [242] N-(4-fluorofenil)-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [243] N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 20 [244] N-ciclohexil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [245] N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [246] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [247] N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [248] 2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 25 [249] N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [250] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [251] N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [252] N-(4-fluorofenil)-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [253] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 30 [254] N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [255] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [256] 2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [257] N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [258] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 35 [259] N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [260] N-ciclopentil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

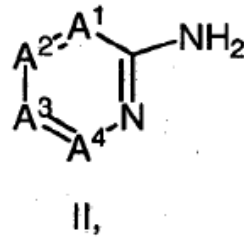
- [261] N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [262] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [263] N-(4-fluorofenil)-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [264] N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 5 [265] N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [266] N-(4-fluorofenil)-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [267] N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [268] N-tert-butil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [269] N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [270] 6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [271] 6-metil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [272] N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [273] N-ciclohexil-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [274] N-ciclohexil-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 15 [275] 7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [276] N-tert-butil-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [277] N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [278] N-tert-butil-7-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [279] N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 20 [280] N-ciclohexil-8-metil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [281] N-ciclopentil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [282] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [283] N-ciclohexil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [284] 2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 25 [285] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [286] N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [287] N-(4-fluorofenil)-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [288] N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [289] 2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 30 [290] N-tert-butil-5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [291] 5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [292] N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [293] N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [294] N-ciclopentil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 35 [295] N-tert-butil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [296] N-(4-fluorofenil)-8-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [297] N-ciclohexil-8-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [298] N-ciclohexil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [299] 7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [300] N-ciclohexil-7-etil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 5 [301] N-ciclopentil-7-etil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [302] N-ciclopentil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [303] N-tert-butil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [304] N-tert-butil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [305] 7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 10 [306] N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [307] N-tert-butil-7-isopropil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [308] N-ciclohexil-7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [309] N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [310] 6-cloro-N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 15 [311] N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [312] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [313] 6-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [314] N-tert-butil-6-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [315] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 20 [316] N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [317] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [318] 6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [319] 6-cloro-N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [320] N-tert-butil-6-cloro-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 25 [321] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato,
- [322] N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [323] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato,
- [324] [2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-amina,
- [325] tert-butil-[2-(5-pirimidin-2-iletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato,
- 30 [326] {2-[5-(3-aminopiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-tert-butil-amina,
- [327] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [328] tert-butil-[2-(2-piridin-2-iletinil-tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [329] tert-butil-{2-[5-(6-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
- [330] tert-butil-{2-[5-(3-cloro-5-fluorofeniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
- 35 [331] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina, clorhidrato,
- [332] tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato,

- [333] tert-butil-{2-[5-(3-trifluorometoxi-feniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]pirazin-3-il}-amina,
 [334] tert-butil-{2-[5-(3-[1,3]dioxolan-2-il-feniletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina,
 [335] tert-butil-{2-[5-(3,5-dimetil-feniletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [336] tert-butil-{2-[5-(3-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 5 [337] tert-butil-{2-[5-(3-metil-3H-imidazol-4-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [338] tert-butil-{2-[5-(5-clorotiofen-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [339] tert-butil-{2-[5-(5-metil-piridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [340] 1-{3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}-etanona, clorhidrato,
 [341] {3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}-metanol, clorhidrato,
 10 [342] N-tert-butil-2-(5-((3-metoxipiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [343] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [344] 5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-2-fluorobenzonitrilo, clorhidrato,
 [345] N-tert-butil-2-(5-((3,4-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [346] N-tert-butil-2-(5-((3-(metoximetil)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 15 [347] 2-(5-((3-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [348] N-tert-butil-2-(5-((4-fluoro-3-metilfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [349] N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [350] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [351] N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 20 [352] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzenosulfonamida, clorhidrato,
 [353] ácido 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-benzoico,
 [354] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzamida, clorhidrato,
 [355] N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)-acetamida,
 [356] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 25 [357] N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [358] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [359] (6-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)piridin-2-il)metanol,
 [360] N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)-metanosulfonamida,
 [361] N-tert-butil-8-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 30 [362] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [363] N-tert-butil-2-(5-((3-clorfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [364] N-tert-butil-2-(5-((2,3-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, y
 [365] N-tert-butil-7-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

y en cada caso sus sales correspondientes, en especial sus clorhidratos y, en cada caso sus correspondientes solvatos.

- 35 Otro objeto de la presente invención es un procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula general (I) anteriormente mostrada, según el cual se hace reaccionar al menos un compuesto de fórmula general (II):

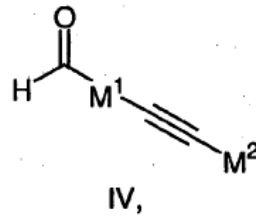


donde A¹, A², A³ y A⁴ tienen los significados descritos anteriormente, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico o al menos en presencia de una sal de un metal de transición, con al menos un isocianuro de fórmula general (III):

5

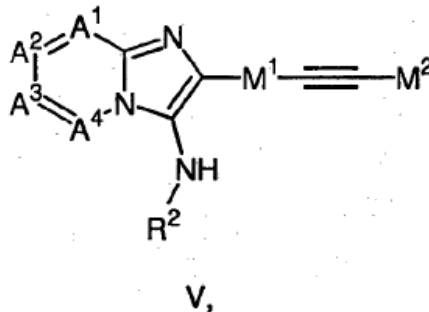


donde R² tiene el significado indicado anteriormente, y con al menos un aldehído de fórmula general (IV):



donde M¹ y M² tienen los significados indicados anteriormente;

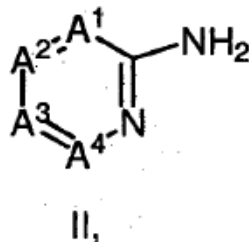
el compuesto obtenido de fórmula general (V):



10

donde A¹, A², A³, A⁴, R², M¹ y M² tienen los significados indicados anteriormente, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en la sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o aísla,

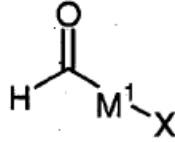
o se hace reaccionar al menos un compuesto de fórmula general (II):



15 donde A¹, A², A³ y A⁴ tienen los significados indicados anteriormente, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico o al menos en presencia de una sal de un metal de transición, con al menos un isocianuro de fórmula general (III):



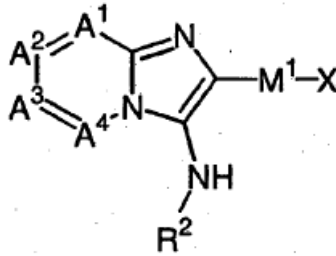
donde R^2 tiene el significado indicado anteriormente, y con al menos un aldehído de fórmula general (VI):



VI,

5 donde M^1 tiene el significado indicado anteriormente y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, en particular cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano;

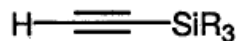
el compuesto obtenido de fórmula general (VII):



VII,

donde $A^1, A^2, A^3, A^4, R^2, M^1$ y X tienen los significados indicados anteriormente, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en la sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o aísla, y

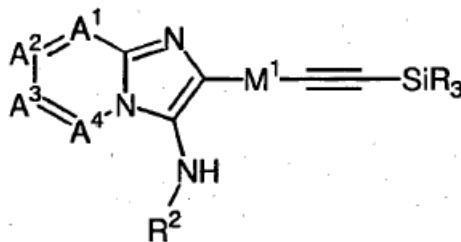
10 por reacción con al menos un acetileno de fórmula general (XI):



XI,

donde R, independientemente entre sí, en cada caso representa un grupo alquilo lineal o ramificado o un grupo fenilo no sustituido,

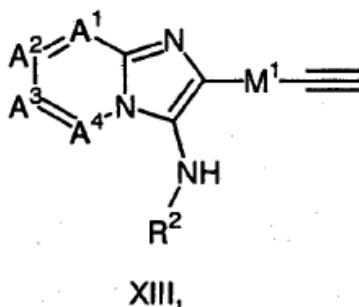
15 se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una sal de cobre (I), preferentemente en presencia de yoduro de cobre (I) y, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general (XII):



XII,

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 y M^1 tienen los significados indicados anteriormente y R, independientemente entre sí, en cada caso representa un grupo alquilo lineal o ramificado o un grupo fenilo no sustituido y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

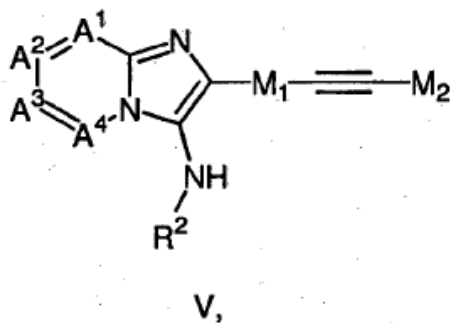
- 5 y al menos un compuesto de fórmula general (XII) se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, opcionalmente en presencia de al menos una sal inorgánica y, opcionalmente, en presencia de al menos una sal de amonio, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general (XIII):



- 10 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 y M^1 tienen los significados citados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

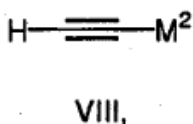
y al menos un compuesto de fórmula general (XIII) y/o al menos un compuesto de fórmula general (XII) se transforma, por reacción con al menos un compuesto de fórmula general M^2-X , donde M^2 tiene el significado indicado anteriormente y X es un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, opcionalmente en presencia de al menos una sal inorgánica y, opcionalmente, en presencia de al menos una sal de amonio, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general (V):

- 15

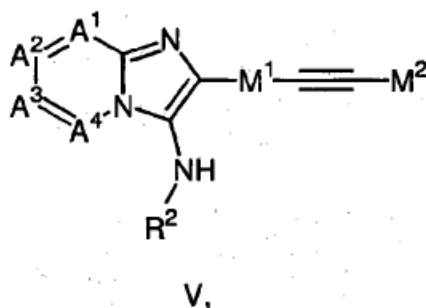


- 20 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , M^1 y M^2 tienen los significados citados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

o un compuesto de fórmula general (VII), por reacción con al menos un acetileno de fórmula general (VIII):



- 25 donde M^2 tiene el significado citado anteriormente, se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una sal de cobre (I), preferentemente en presencia de yoduro de cobre (I) y, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general (V):



donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , M^1 y M^2 tienen los significados citados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

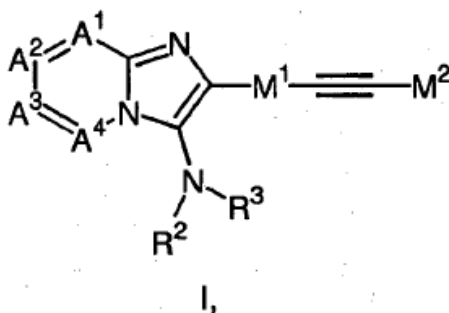
5 y, opcionalmente, el compuesto de fórmula general (V), por reacción con al menos un compuesto de fórmula general R^3-X , donde R^3 tiene el significado indicado anteriormente y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos un sal hidruro metálico,

10 o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-OH$, donde R^{20} tiene el significado indicado anteriormente, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos un medio de acoplamiento,

15 o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-X$, donde R^{20} tiene el significado indicado anteriormente y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica,

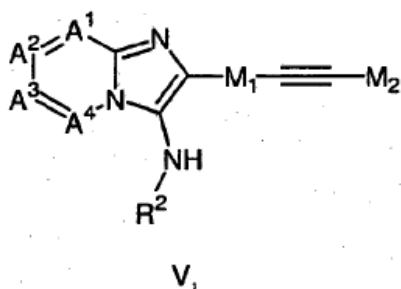
o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-H$, donde R^{20} tiene el significado indicado anteriormente, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor,

se transforma en un compuesto de fórmula general (I), opcionalmente en forma de una sal correspondiente

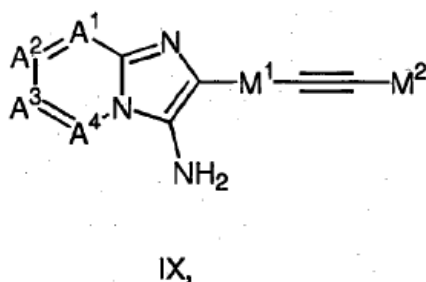


20 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados anteriormente y, opcionalmente, dicho compuesto se purifica y/o aísla.

Es también objeto de la presente invención un procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula (I) antes citada, según el cual al menos un compuesto de fórmula general (V):



donde A¹, A², A³, A⁴, R², M¹ y M² tienen los significados indicados anteriormente, se hace reaccionar, opcionalmente en un medio de reacción en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico y el compuesto obtenido de fórmula general (IX):



5

donde A¹, A², A³, A⁴, M¹ y M² tienen los significados indicados anteriormente, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una correspondiente sal y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla y

10

se hace reaccionar en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos un sal hidruro metálico, con al menos un compuesto de fórmula general R³-X, donde R³ tiene el significado indicado anteriormente y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy preferentemente cloro, o

se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica y/u, opcionalmente, en presencia de al menos un medio de acoplamiento, con al menos un compuesto de fórmula general R²⁰-C(=O)-OH, donde R²⁰ tiene el significado indicado anteriormente, o

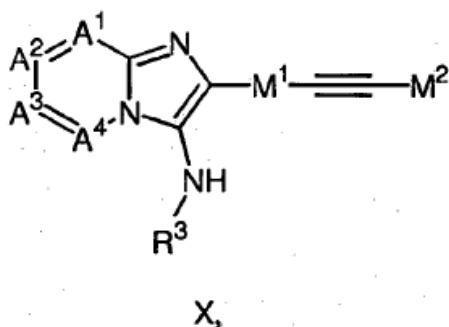
15

se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, con al menos un compuesto de fórmula general R²⁰-C(=O)-X, donde R²⁰ tiene el significado indicado anteriormente y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy preferentemente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, o

20

se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor, con al menos un compuesto de fórmula general R²⁰-C(=O)-H, donde R²⁰ tiene el significado indicado anteriormente,

y se transforma en el compuesto correspondiente de fórmula general (X), opcionalmente en la forma de su correspondiente sal,



donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados anteriormente y este compuesto, opcionalmente, se purifica y/o aísla,

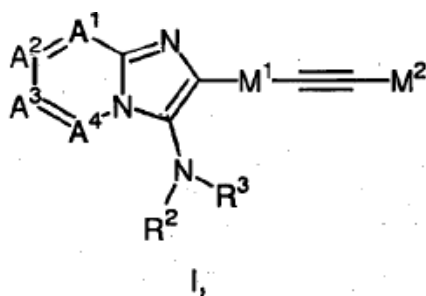
- 5 y, opcionalmente, el compuesto de fórmula general (X) se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general R^2-X , donde R^2 tiene el significado anteriormente señalado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy preferentemente cloro, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una sal de hidruro metálico, u

opcionalmente, el compuesto de fórmula general (X) se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-OH$, donde R^{20} tiene el significado anteriormente señalado, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica y/o en presencia de al menos un medio de acoplamiento, o

- 10 el compuesto de fórmula general (X) se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-X$, donde R^{20} tiene el significado anteriormente señalado y X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy preferentemente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, o

- 15 el compuesto de fórmula general (X) se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-H$, donde R^{20} tiene el significado anteriormente señalado, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor,

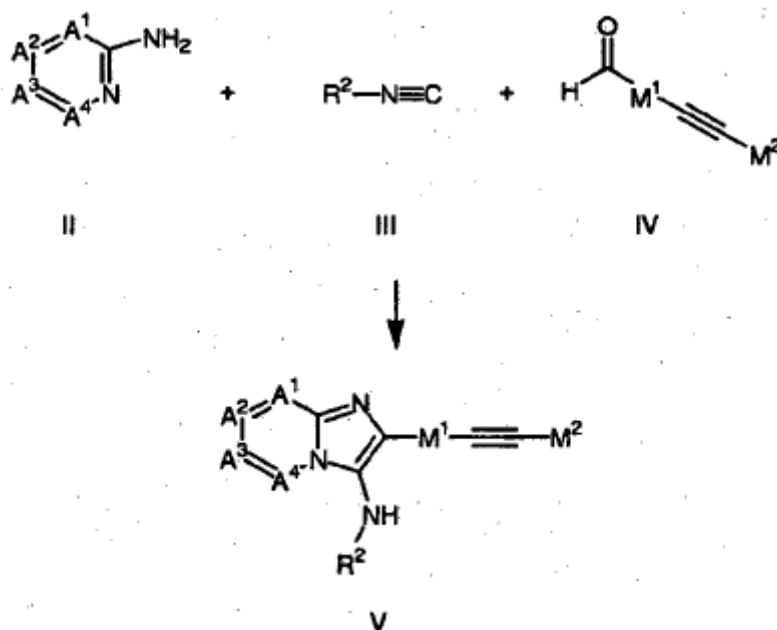
y se transforma en el compuesto de fórmula general (I), opcionalmente en la forma de una correspondiente sal,



- 20 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados anteriormente y este compuesto, opcionalmente, se purifica y/o aísla.

Los procedimientos según la invención para la preparación de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I) anteriormente mostrada también se indican en los siguientes Esquemas 1 a 4.

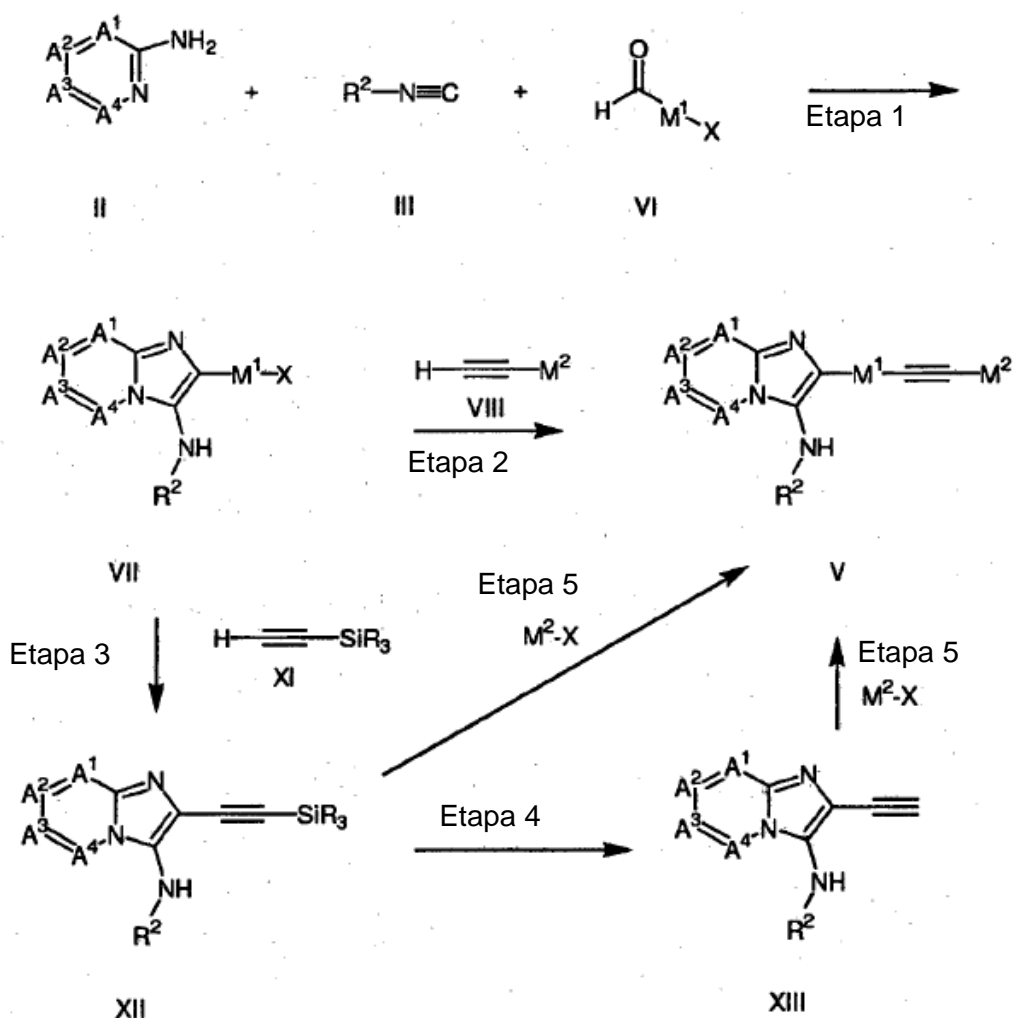
Esquema 1



En una reacción de acoplamiento de tres componentes, se hace reaccionar la amina de fórmula general (II) con un isocianuro de fórmula general (III) y un aldehído de fórmula general (IV) en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por cloroformo, diclorometano, acetonitrilo, metanol y etanol, agregando al menos un ácido orgánico o inorgánico, preferentemente ácido trifluoroacético o ácido perclórico, o incorporando al menos una sal de metal de transición, agregando preferentemente al menos un triflato de metal de transición (sulfonato de trifluorometano de metal de transición), muy preferentemente al menos un triflato de metal de transición seleccionado de entre grupo formado por sulfonato de trifluorometano de escandio (III), sulfonato de trifluorometano de iterbio y sulfonato de trifluorometano de indio (III), preferentemente a temperaturas entre 0 y 150°C, para obtener los compuestos de fórmula general (V).

Otro procedimiento para la preparación de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I) anteriormente señalada se reitera en el Esquema 2.

Esquema 2



En la etapa 1 se hace reaccionar, en una reacción de acoplamiento de tres componentes, la amina de fórmula general (II) con el isocianuro de fórmula general (III) y el aldehído de fórmula general (VI), donde X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por cloroformo, diclorometano, acetonitrilo, metanol y etanol, agregando al menos un ácido orgánico o inorgánico, preferentemente seleccionado del grupo formado por ácido trifluoroacético o ácido perclórico o incorporando al menos una sal de metal de transición, agregando preferentemente al menos un triflato de metal de transición (sulfonato de trifluorometano de metal de transición), donde muy preferentemente se agrega al menos un sulfonato de trifluorometano de metal de transición seleccionado del grupo formado por sulfonato de trifluorometano de escandio (III), sulfonato de trifluorometano de iterbio y sulfonato de trifluorometano de indio (III), preferentemente a temperaturas entre 0 y 150°C, para obtener los compuestos de fórmula general (VII), donde X representa un grupo saliente, preferentemente un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano.

En la etapa 2 se hacen reaccionar los compuestos de indicada fórmula general (VII), donde X representa un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, con el acetileno de fórmula general (VIII) en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, n-butanol, dioxano, cloroformo, diclorometano, piridina, sulfóxido de dimetilo, tolueno, tetrahidrofurano, dimetilformamida, acetonitrilo, dietil éter, agua y mezclas correspondientes, donde el medio de reacción se selecciona muy especialmente del grupo formado por dimetilformamida, acetato de etilo, tetrahidrofurano, agua y mezclas correspondientes; de preferencia, adicionando al menos un catalizador de paladio, preferentemente seleccionado del grupo formado por dicloruro de paladio(II) [PdCl₂], acetato de bis(trifenilfosfin)-paladio(II) [Pd(PPh₃)₂(OAc)₂], cloruro de bis(trifenilfosfin)-paladio(II) [PdCl₂(PPh₃)₂], acetato de paladio(II) [Pd(OAc)₂; Ac = acetato], cloruro de bis(acetonitril)-paladio(II) [(CH₃CN)₂PdCl₂], cloruro de bis(benzonitril)-paladio(II) [(PhCN)₂PdCl₂] y tetraquis(trifenilfosfina)-paladio [(PPh₃)₄Pd], donde el catalizador de paladio se selecciona muy especialmente del grupo formado por Pd(PPh₃)₂(OAc)₂, (PPh₃)₄Pd y PdCl₂(PPh₃)₂, opcionalmente en presencia de al menos una sal de cobre (I), preferentemente en presencia de yoduro de cobre (I), opcionalmente en presencia de al menos una fosfina, en particular

de una fosfina seleccionada del grupo compuesto por trifenilfosfina, tri(tert-butil)fosfina, trifenilarsina y tri(orto-toluil)fosfina, muy especialmente en presencia de trifenilfosfina, opcionalmente mediante la adición de al menos una sal orgánica, de preferencia mediante la adición de cloruro de litio y/o zinc, opcionalmente mediante la adición de al menos una base orgánica, preferentemente de una base orgánica seleccionada del grupo formado por trietilamina, diisopropilamina, diisopropiletilamina y [1,4]-diazabicyclo-[2.2.2]octano y/o incorporando al menos una base inorgánica, preferentemente seleccionada del grupo compuesto por carbonato de potasio, carbonato ácido de sodio y carbonato de cesio, donde especialmente la base orgánica puede ser también el medio de reacción, a temperaturas entre -70 y 300°C, muy preferentemente entre -70 y 150°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (V).

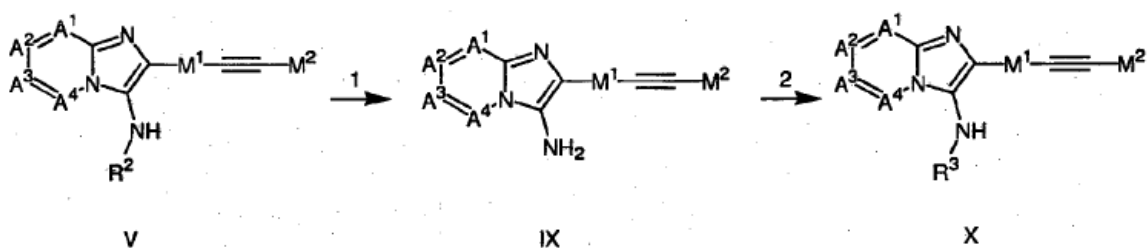
En la etapa 3 se hacen reaccionar los compuestos de la indicada fórmula general (VII) con el compuesto de fórmula general (XI) anteriormente señalada, bajo las condiciones mencionadas en el Esquema 2, etapa 2, para sí transformarse en los compuestos de fórmula general (XII).

En la etapa 4 se hacen reaccionar los compuestos de la anteriormente indicada fórmula general (XII) en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, n-butanol, dioxano, cloroformo, diclorometano, piridina, sulfóxido de dimetilo, tolueno, tetrahidrofurano, dimetilformamida, acetonitrilo, dietil éter, agua y mezclas correspondientes, donde el medio de reacción se selecciona muy especialmente del grupo formado por dimetilformamida, acetato de etilo, tetrahidrofurano, agua y las mezclas correspondientes, opcionalmente en presencia de al menos una base inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una base inorgánica seleccionada del grupo compuesto por carbonato de potasio, hidróxido de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de litio, opcionalmente en presencia de al menos una base inorgánica, preferentemente al menos una base inorgánica seleccionada del grupo formado por trietilamina y piridina, opcionalmente en presencia de al menos una sal inorgánica, preferentemente en presencia de al menos una sal de amonio o en presencia de fluoruro de potasio y/o sodio, muy especialmente en presencia de al menos una sal de amonio seleccionada del grupo formado por fluoruro de tetra-n-butilamonio, yoduro de tetra-n-butilamonio y bromuro de tetra-butilamonio, a temperaturas entre -70 y 300°C, muy preferentemente entre -70 y 150°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (XIII).

En la etapa 5 se hacen reaccionar los compuestos de fórmulas (XII) y (XIII) con los compuestos de fórmula general M^2-X , donde X representa un grupo halógeno o un éster de ácido sulfónico, muy especialmente cloro, bromo o sulfonato de trifluorometano, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por metanol, acetato de etilo, etanol, isopropanol, n-butanol, dioxano, cloroformo, diclorometano, piridina, sulfóxido de dimetilo, tolueno, tetrahidrofurano, dimetilformamida, acetonitrilo, dietil éter, agua y mezclas correspondientes, donde el medio de reacción se selecciona muy especialmente del grupo formado por dimetilformamida, acetato de etilo, tetrahidrofurano, agua y mezclas correspondientes; de preferencia, adicionando al menos un catalizador de paladio, preferentemente seleccionado del grupo formado por dicloruro de paladio(II) $[PdCl_2]$, acetato de bis(trifenilfosfin)-paladio(II) $[Pd(PPh_3)_2(OAc)_2]$, cloruro de bis(trifenilfosfin)-paladio(II) $[PdCl_2(PPh_3)_2]$, acetato de paladio(II) $[Pd(OAc)_2]$; Ac = acetato], cloruro de bis(acetonitril)-paladio(II) $[(CH_3CN)_2PdCl_2]$, cloruro de bis(benzonitril)-paladio(II) $[(PhCN)_2PdCl_2]$ y tetraquis(trifenilfosfina)-paladio $[(PPh_3)_4Pd]$, donde el catalizador de paladio se selecciona muy especialmente del grupo formado por $Pd(PPh_3)_2(OAc)_2$, $(PPh_3)_4Pd$ y $PdCl_2(PPh_3)_2$, opcionalmente en presencia de al menos una sal de cobre (I), preferentemente en presencia de yoduro de cobre (I), opcionalmente en presencia de al menos una fosfina, en particular de una fosfina seleccionada del grupo compuesto por trifenilfosfina, tri(tert-butil)fosfina, trifenilarsina y tri(orto-toluil)fosfina, muy especialmente en presencia de trifenilfosfina, opcionalmente mediante la adición de al menos una sal orgánica, de preferencia mediante la adición de cloruro de litio y/o zinc, opcionalmente en presencia de una sal de amonio o en presencia de fluoruro de potasio y/o sodio, muy especialmente en presencia de al menos una sal de amonio seleccionada del grupo formado por fluoruro de tetra-n-butilamonio, yoduro de tetra-n-butilamonio y bromuro de tetra-butilamonio, opcionalmente mediante la adición de al menos una base orgánica, preferentemente de una base orgánica seleccionada del grupo formado por trietilamina, diisopropilamina, diisopropiletilamina y [1,4]-diazabicyclo-[2.2.2]octano y/o incorporando al menos una base inorgánica, preferentemente seleccionada del grupo compuesto por carbonato de potasio, bicarbonato de sodio y carbonato de cesio, donde especialmente la base orgánica puede ser también el medio de reacción, a temperaturas entre -70 y 300°C, muy preferentemente entre -70 y 150°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (V). La reacción de los compuestos de fórmula general (XII) con los compuestos de fórmula general M^2-X se lleva a cabo preferentemente en presencia de al menos una sal de amonio o en presencia de fluoruro de potasio y/o sodio.

Los compuestos de fórmula general (V) se pueden transformar en los compuestos de fórmula (X) tal como se muestra en el Esquema 3:

Esquema 3



En la etapa 1 se hacen reaccionar los compuestos de fórmula general (V) en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por etanol, metanol y acetona, mediante la adición de al menos un ácido orgánico, preferentemente ácido acético o ácido trifluoroacético y/o mediante la adición de al menos un ácido inorgánico, preferentemente ácido clorhídrico o ácido sulfúrico, a temperaturas entre 0 y 80°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (IX).

En la etapa 2 se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula general (IX) con el ácido carboxílico de fórmula general $R^{20}-(C=O)-OH$, donde R^{20} tiene el significado señalado anteriormente, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por dietil éter, tetrahidrofurano, acetonitrilo, metanol, etanol, dimetilformamida y diclorometano, opcionalmente en presencia de al menos un reactivo de acoplamiento, preferentemente seleccionado del grupo formado por hexafluorofosfato de 1-benzotriazoliloxi-tris(dimetilamino)-fosfonio (BOP), diciclohexilcarbodiimida (DCC), N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida (EDCI), hexafluorofosfato de N-[(dimetilamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridino-1-ilmetileno]-N-metilmetanaminio N-óxido (HATU), hexafluorofosfato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU) e 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAt), opcionalmente en presencia de al menos una base inorgánica, preferentemente seleccionada del grupo compuesto por carbonato de potasio y carbonato de cesio, o en presencia de una base orgánica, preferentemente seleccionada del grupo formado por trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina y diisopropiletilamina, preferentemente a temperaturas entre -70 y 100°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (X).

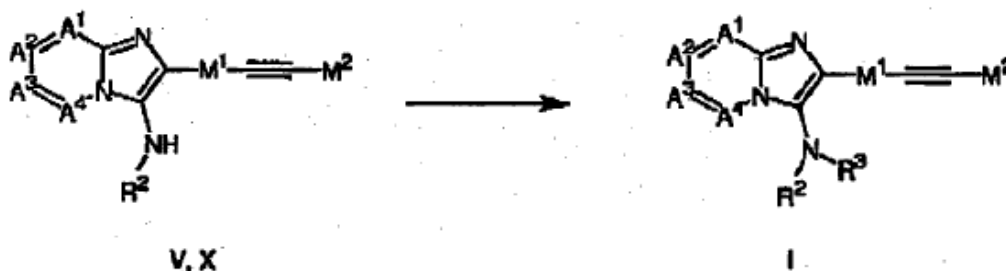
Alternativamente, los compuestos de fórmula general (IX) se hacen reaccionar con derivados de ácido carboxílico o bien con derivados de ácido carbónico de fórmula general $R^{20}-(C=O)-X$, donde X representa un grupo halógeno, especialmente cloro o bromo, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por dietil éter, tetrahidrofurano, acetonitrilo, metanol, etanol, dimetilformamida y diclorometano, con o sin adición de al menos una base orgánica o inorgánica, por ejemplo, trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina o diisopropilamina, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica, preferentemente seleccionada del grupo formado por trietilamina, dimetilaminopiridina, piridina o diisopropilamina, o de una base orgánica, a temperaturas entre -70 y 100°C, preferentemente, transformándose en los compuestos de fórmula general (X).

De otro modo, los compuestos de fórmula general (IX) se hacen reaccionar con los aldehídos de fórmula general $R^{20}-C(=O)-H$, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por dietil éter, tetrahidrofurano, metanol, etanol, diclorometano y tolueno, mediante la adición de al menos un agente reductor, preferentemente seleccionado del grupo formado por borohidruro de sodio, acetoxiborohidruro de sodio o cianoborohidruro de sodio, preferentemente a temperaturas entre -70 y 100°C, transformándose en los compuestos de fórmula general (X).

Asimismo, los compuestos de fórmula general (IX) se pueden hacer reaccionar con los compuestos de fórmula general R^3-X , donde X representa un grupo halógeno, de preferencia cloro, en un medio de reacción, preferentemente seleccionado del grupo formado por tolueno, tetrahidrofurano y dietil éter, mediante la adición de al menos una sal hidruro metálico, preferentemente mediante la adición de al menos una sal hidruro metálico seleccionada del grupo compuesto por hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de litio, a temperaturas preferentemente entre 0 y 40°C, transformándose así en los compuestos de fórmula general (X).

Los compuestos de fórmulas generales (X) y (V) se pueden transformar además en los compuestos de fórmula general (I), tal como se representa en el Esquema 4, donde se pueden utilizar los mismos métodos que se describieron en el Esquema 3, etapa 2.

Esquema 4



Los compuestos de fórmulas (II), (III), (IV) y (VIII), así como las mencionadas fórmulas generales R^2-X , R^3-X , $R^{20}-C(=O)-OH$, $R^{20}-C(=O)-X$ y $R^{20}-C(=O)-H$, se pueden obtener en el comercio y/o se pueden preparar mediante métodos habituales conocidos por el experto.

5 Las reacciones anteriormente descritas se pueden llevar a cabo bajo condiciones usuales, habituales para un experto, por ejemplo, con respecto a la presión o a la secuencia de adición de los componentes. Opcionalmente, el experto puede determinar el desarrollo óptimo del procedimiento bajo las respectivas condiciones mediante sencillos ensayos previos.

10 Los respectivos productos finales e intermedios obtenidos de acuerdo con las reacciones anteriormente descritas pueden ser, ya sea por deseo y/o necesidad, purificados y/o aislados según métodos usuales, conocidos por el experto. Procedimientos adecuados de purificación son, por ejemplo, los procedimientos de extracción y cromatográficos, tales como cromatografía en columna o cromatografía preparativa.

15 Todas las etapas de procedimiento anteriormente descritas, así como también la purificación y/o el aislamiento de los productos finales e intermedios se pueden llevar a cabo parcial o completamente bajo atmósfera de gas inerte, preferentemente bajo atmósfera de nitrógeno.

Según la presente invención, los compuestos imidazol-3-il-amina sustituidos de las fórmulas generales Ia, Ib, Ic, Id, Ie, If, Ig, Ih, Ik, Im y In antes mostradas, que se denominarán en adelante sólo como compuestos de fórmula general (I), así como los correspondientes estereoisómeros, pueden ser aislados en forma de sus bases libres, ácidos libres y también en forma de sales correspondientes, en especial sales fisiológicamente tolerables.

20 Las bases libres de los correspondientes compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la general (I) según la invención, así como los correspondientes estereoisómeros pueden, por ejemplo, convertirse en las correspondientes sales, preferentemente sales fisiológicamente aceptables, mediante la reacción con un ácido orgánico o inorgánico, preferentemente con los ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, metanosulfónico, p-toluensulfónico, carbónico, fórmico, acético, oxálico, succínico, tartárico, mandélico, fumárico, láctico, cítrico, glutámico o aspártico.

25 Las bases libres de los correspondientes compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I), así como los correspondientes estereoisómeros pueden asimismo convertirse en las correspondientes sales fisiológicamente aceptables por medio del ácido libre o con una sal de un sucedáneo de azúcar, por ejemplo, sacarina, ciclamato o acesulfame.

30 Conforme a lo anterior, los ácidos libre de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I) y los correspondientes estereoisómeros pueden convertirse en las correspondientes sales fisiológicamente aceptables por reacción con una base adecuada. A modo de ejemplo se pueden nombrar sales de metales alcalinos, de metales alcalinotérreos o sales de amonio $[NH_xR_{4-x}]^+$, donde $x = 0, 1, 2, 3$ ó 4 y R representa un grupo alquilo(C_{1-4}) lineal o ramificado.

35 Tal como los correspondientes ácidos, bases o sales de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la presente invención, dichos compuestos y sus correspondientes estereoisómeros pueden, opcionalmente, obtenerse en forma de solvatos, preferentemente en forma de hidratos, de acuerdo con métodos conocidos por el experto.

40 Cuando los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I) según la invención se pueden obtener, de acuerdo con la preparación, en forma de mezcla de estereoisómeros, preferentemente en forma de racematos u otras mezclas de sus diversos enantiómeros y/o diastereómeros, tales compuestos pueden separarse y, opcionalmente, aislarse de acuerdo con procedimientos usuales conocidos por el experto. A modo de ejemplo, se citan procedimientos de separación, en especial, cromatografía líquida bajo presión normal o bajo presión elevada, preferentemente procedimientos con MPLC y HPLC, así como procedimientos de cristalización fraccionada. Por ello, especialmente los enantiómeros individuales pueden separarse de las sales diastereoméricas formadas, por ejemplo mediante HPLC en

fase quiral o por cristalización con ácidos quirales, tales como ácido (+)-tartárico, ácido (-)-tartárico o ácido (+)-10-canforsulfónico.

5 Los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la mencionada fórmula general (I) según la invención y los correspondientes estereoisómeros, así como las correspondientes bases, sales y solvatos son toxicológicamente inofensivos y en consecuencia son útiles como principios activos farmacéuticos en medicamentos.

10 Por ello, otro objeto de la presente invención son composiciones farmacéuticas que contienen al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de la anteriormente mencionada fórmula general (I) según la invención, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, especialmente de enantiómeros o diastereómeros, de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla o en cada caso en forma de sus sales o en forma de sus solvatos, así como, opcionalmente, una o varias sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables.

La composición farmacéutica según la invención es útil para regular el receptor mGluR5, especialmente para inhibirlo, y para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos y/o enfermedades que son mediadas, al menos parcialmente, por el receptor mGluR5.

15 Preferentemente, la composición farmacéutica según la invención es útil para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente dolor seleccionado entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; migraña; depresión; enfermedades neurodegenerativas, particularmente seleccionadas del grupo formado por la enfermedad de Parkinson, la enfermedad de Alzheimer, la enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; enfermedades cognitivas, preferentemente condiciones de déficit cognitivo, muy particularmente síndrome de déficit de atención (ADS); ataques
20 de pánico; epilepsia, tos, incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemia cerebral; espasmos musculares; calambres; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados del grupo formado por bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; abuso de alcohol y/o drogas (especialmente abuso de nicotina y/o cocaína) y/o abuso de medicamentos; dependencia del alcohol y/o drogas (especialmente dependencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos, particularmente para la profilaxis y/o reducción de trastornos asociados a la abstinencia de alcohol y/o
25 drogas (especialmente abstinencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos; desarrollo de tolerancia a medicamentos, especialmente a opioides; síndrome de reflujo esofágico; diuresis; antinatriuresis; sistemas de flujo del sistema cardiovascular, ansiolisis; para el aumento de la vigilia; aumento de la libido, modulación de la actividad motora y para la anestesia local.

30 La composición farmacéutica según la invención es especialmente adecuada para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente seleccionado de entre el grupo formado por dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; depresiones; epilepsia; enfermedad de Parkinson; abuso de alcohol y/o drogas (especialmente abuso de nicotina y/o cocaína) y/o abuso de medicamentos; dependencia del alcohol y/o drogas (especialmente dependencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos, particularmente para la profilaxis y/o reducción de trastornos asociados a la abstinencia de alcohol y/o drogas (especialmente abstinencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia
35 de medicamentos; desarrollo de tolerancia a medicamentos, especialmente a opioides o para la ansiolisis.

Muy particularmente, la composición farmacéutica según la invención es especialmente útil para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado de entre dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral.

40 Otro objeto de la invención es la utilización de al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de la fórmula general (I) según la invención, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, especialmente de enantiómeros o diastereómeros, sus racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla o en cada caso en forma de sal correspondiente o en forma de correspondiente solvato, así como, opcionalmente, una o varias sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables, para la preparación de un medicamento para la regulación del receptor mGluR5, en particular para su
45 inhibición.

50 Es preferente la utilización de al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de la fórmula general (I) según la invención, opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, especialmente de enantiómeros o diastereómeros, sus racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla o en cada caso en forma de sal correspondiente o en forma de correspondiente solvato, así como, opcionalmente, una o varias sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables, para la preparación de un medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos y/o enfermedades que son mediadas, al menos parcialmente, por el receptor mGluR5.

Es especialmente preferente el uso de al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de la fórmula general (I) según la invención, opcionalmente en forma de estereoisómeros puros, especialmente de enantiómeros o diastereómeros, de racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla o en cada caso en forma de una sal correspondiente o en forma de un correspondiente solvato, así como, opcionalmente, una o varias sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables, para la preparación de un medicamento para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado entre el grupo formado por dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral; migraña; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, particularmente seleccionadas del grupo formado por la enfermedad de Parkinson, enfermedad de Alzheimer, la enfermedad de Huntington y esclerosis múltiple; enfermedades cognitivas, preferentemente condiciones de déficit cognitivo, muy particularmente síndrome de déficit de atención (ADS, por su sigla en inglés); ataques de pánico; epilepsia, tos, incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemia cerebral; espasmos musculares; calambres; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados del grupo formado por bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; abuso de alcohol y/o drogas (especialmente abuso de nicotina y/o cocaína) y/o abuso de medicamentos; dependencia del alcohol y/o drogas (especialmente dependencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos, particularmente para la profilaxis y/o reducción de desórdenes asociados a la abstinencia de alcohol y/o drogas (especialmente abstinencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos; desarrollo de tolerancia a medicamentos, especialmente a opioides; síndrome de reflujo esófago-estómago; diuresis; antinatriuresis; flujo del sistema cardiovascular, ansiolisis; para el aumento de la vigilia; aumento de la libido, modulación de la actividad motora y para la anestesia local.

Es muy especialmente preferente el uso de al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de la anteriormente mencionada fórmula general (I) según la invención, opcionalmente en forma de sus estereoisómeros puros, especialmente de enantiómeros o diastereómeros, sus racematos o en forma de mezcla de estereoisómeros, en particular de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier proporción de mezcla o en cada caso en forma de sal correspondiente o en forma de correspondiente solvato, así como, opcionalmente, una o varias sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables, para la preparación de un medicamento para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado entre el grupo formado por dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral.

Los medicamentos según la invención se pueden administrar a adultos y niños, incluyendo niños pequeños y lactantes.

El medicamento según la invención puede presentarse en forma de medicamento líquido, semisólido o sólido, por ejemplo, en forma de soluciones para inyección, gotas, jugos, jarabes, atomizadores, suspensiones, tabletas, parches, cápsulas, supositorios, ungüentos, cremas, lociones, geles, emulsiones, aerosoles o en forma multiparticulada, por ejemplo como pellets o granulados; opcionalmente, el medicamento según la invención se comprime en tabletas, se rellena en cápsulas o se suspende en un líquido y, como tal, se suministra.

Junto con el al menos un compuesto imidazo-3-il-amina sustituido de fórmula general (I), opcionalmente en forma de estereoisómero puro, especialmente de enantiómero o diastereómero, de racemato o en forma de mezcla de estereoisómeros, especialmente de enantiómeros y/o diastereómeros, en cualquier relación de mezcla, el medicamento según la invención contiene usualmente otras sustancias auxiliares farmacéuticamente aceptables, las cuales preferentemente se seleccionan del grupo compuesto por materiales vehículo, de carga, disolventes, diluyentes, tensioactivos, colorantes, conservantes, disgregantes, lubricantes, aromas y aglutinantes. La selección de las sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables, así como de la cantidad de las mismas a emplear depende de la forma de administración del medicamento, esto es oral, subcutánea, parenteral, intravenosa, intraperitoneal, intradérmica, intramuscular, intranasal, bucal, rectal o tópica, por ejemplo sobre infecciones en la piel, mucosas y ojos. Para la administración oral se emplean preferentemente preparaciones en forma de tabletas, grageas, cápsulas, granulados, pellets, gotas, jugos y jarabes; para la administración parenteral, tópica o por inhalación soluciones, suspensiones, preparaciones secas fácilmente reconstituibles y pulverizaciones.

Los medicamentos según la invención que incluyen los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos según la invención se pueden presentar en forma disuelta o en un parche, opcionalmente incorporando agentes que fomentan la penetración en la piel, para la administración percutánea.

Las formas de administración oral y percutánea pueden liberar de forma retardada los correspondientes compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos según la invención.

La preparación del medicamento según la invención se lleva a cabo con ayuda de los agentes, dispositivos, métodos y procedimientos usuales conocidos en el estado de la técnica, tal como se describe, por ejemplo, en "Remington's Pharmaceutical Sciences", A.R. Gennaro (editor), Edición No. 17, Mack Publishing Company, Easton, Pa. (1985), especialmente sección 8, capítulos 76-93. La descripción de la literatura correspondiente se introduce aquí como referencia y se considera como parte de la especificación.

La cantidad de los compuestos de imidazo-3-il-amina sustituidos según la invención a suministrar al paciente puede variar y depende, por ejemplo, del peso y la edad del paciente, así como también del tipo de administración, la indicación y la gravedad de la enfermedad. Usualmente, se administran entre 0,005 y 2.000 mg/kg, preferentemente entre 0,05 y 500 mg/kg, en especial entre 0,05 y 100 mg/kg por kilogramo de peso corporal del paciente al día de al menos uno de estos compuestos.

Métodos farmacológicos

1. Método para determinar la afinidad por el receptor mGluR5

Se prepara un homogenado de cerebro de cerdo por homogenización (Polytron PT 3000, Kinematica AG, 10.000 revoluciones por minutos durante 90 segundos) a partir de semicerebros de cerdo sin médula, cerebelo y puente, en un tampón a pH 8,0 (Hepes 30 mM, Sigma, N° de pedido H3375 + 1 tableta Complete en 100 ml, Roche Diagnostics, N° de pedido 1836145) en una relación 1:20 (peso del cerebro/volumen) y con una centrifugación diferencial de 900xg y 40.000xg. En preparados o muestras de incubación de 250 µl en placas de microtitulación de 96 pocillos se incuban en cada caso 450 µg de proteína del homogenado de cerebro con 5nM de ³[H]-MPEP (Tocris, N° de pedido R1212) (MPEP = 2-metil-6-(3-metoxifenil)etilpiridina) y los compuestos a analizar (10 µM en el ensayo) en la solución tampón (señalada anteriormente) a temperatura ambiente durante 60 min.

Posteriormente, los preparados se filtran con un cultivador Brandel Cell (Brandel, TYP Robotic 9600) sobre placas unifiltro con tamiz de filtro de fibra de vidrio (Perkin Elmer, N° de pedido 6005177) y, a continuación, se lavan con la solución tampón (señalada anteriormente) 3 veces, cada vez con 250 µl por muestra. Luego, las placas de filtro se secan durante 60 minutos a 55°C. Posteriormente, se agregan 30 µl de líquido de centelleo Ultima Gold™ (Packard BioScience, N° de pedido 6013159) por pocillo y después de 3 horas se miden las muestras en un contador-β (Mikrobeta, Perkin Elmer). La unión sin especificar se determina mediante la adición de 10 µM de MPEP (Tocris, N° de pedido 1212).

2. Dolor neuropático en la rata

El análisis de la eficacia contra el dolor neuropático se llevó a cabo en un modelo Bennett (lesión por constricción crónica; Bennet y Xie, 1988, Pain 33: 87-107). Las partes correspondientes de la literatura son válidas en la presente divulgación como parte de la misma. Se proporcionan ratas Sprague-Dawley con un peso entre 140 y 160 g, anestesiadas con nembutal, con cuatro ligaduras sueltas del nervio isquiático derecho. Los animales desarrollaron en las patas sin nervios del nervio dañado hipersensibilidad, que después de una fase de reposo de una a cuatro semanas se cuantifica por medio de una placa metálica fría a 4°C (alodinia fría). Los animales situados sobre esta placa se observan durante un periodo de 2 minutos y se mide el número de reacciones de retracción de las patas dañadas. Con respecto al valor previo, anterior a la aplicación de la sustancia, se determina el efecto de la misma durante un periodo de una hora en cuatro puntos temporales (15, 30, 45 y 60 minutos después de la aplicación) y las áreas resultantes bajo la curva (AUC) y la inhibición de la alodinia fría con respecto de los puntos de medición individuales se expresaron en porcentaje de efecto con respecto al control con el vehículo (AUC) o bien con respecto al valor inicial (puntos de medición individuales). El tamaño de los grupos de la muestra era n = 10. La significancia de un efecto anti-alodinia se determinó en base a los valores del AUC mediante un Test-T (*0,05 ≥ p > 0,01; **0,01, ≥ p < 0,001, ***p ≤ 0,001; Armitage y Berry, 1987, Stat. Methods in Medical Research, Londres, Blackwell Scientific Publications).

3. Ensayo "Elevated Plus Maze"

En el ensayo llamado "Elevated plus maze" se ensayan los compuestos en relación a posibles efectos ansiolíticos. Los ensayos se realizan con ratones Sprague-Dawley machos (con un peso corporal de 200-250 g) y se utilizan 2 laberintos elevados en cruz (Med Associates) con barreras de luz infrarroja y con control electrónico para determinar el lugar de ubicación de los animales en el laberinto. Cada laberinto comprende dos brazos abiertos, 2 brazos cerrados y una plataforma central. Los bordes de los brazos abiertos están limitados con listones angostos. El conjunto del laberinto está instalado sobre un bastidor metálico.

Al inicio de un ensayo de 5 minutos de duración se coloca cada animal individualmente con la cabeza dirigida a un brazo (o camino) cerrado sobre la plataforma central.

Se determinan, calculan o evalúan los siguientes parámetros: Número y porcentaje de entrada en los brazos abiertos y cerrados, así como el porcentaje de tiempo de permanencia en los brazos abiertos y cerrados y sobre la plataforma central.

Los datos se analizaron con un ANOVA 1-factor (comparación de los grupos tratados versus grupo del vehículo). El nivel de significancia se fijó en $p < 0,05$. Todos los grupos tienen un tamaño de $N = 10$.

5 El ensayo también se describe en Hogg, S. (1996) "A review of the validity and variability of the elevated plus-maze as an animal model of anxiety", *Pharmacol Biochem. Behav.*, 54, 21-30 y Rodgers, R.J., Cole, J.C. (1994); "The elevated plus-maze pharmacology, methodology and ethology", en: Cooper, S.J., Hendrie, C.A. (editores) *Ethology y Psychopharmacology*, Wiley & Sons, pp. 9-44. Las partes respectivas de la bibliografía se consideran parte de la divulgación.

4. Ensayo de formalina

a) Ensayo de formalina en la rata

10 El ensayo de formalina, tal como se describe en Dubuisson, D. Y Dennis, S.G., 1977, *Pain*, 4 161-174, constituye un modelo para el dolor agudo y crónico. Las correspondientes partes de la bibliografía forman parte de la presente publicación. Mediante una sola inyección de formalina aplicada en el lado dorsal de una pata trasera se introduce en los animales de ensayo, con libertad de movimiento, una reacción nociceptiva bifásica, la cual se detecta mediante observación de tres muestras de comportamiento, claramente diferenciables entre sí. La reacción comprende dos fases: Fase 1 = reacción inmediata (duración hasta 10 minutos, agitación de la pata, lamido de la pata); Fase 2 = reacción tardía (después de una pausa de descanso, también agitación de la pata, lamido; duración hasta 60 minutos). La primera fase refleja un estímulo directo de los sensores de nocicepción periféricos con una entrada (input) nociceptiva espinal elevada, o bien liberación de glutamato (fase de dolor agudo); la segunda fase refleja una hipersensibilización espinal y periférica (fase de dolor crónico). En los ensayos aquí descritos se evaluó el componente del dolor crónico (fase 2).

25 La formalina se administró a un volumen de 50 μ l y una concentración del 5% vía subcutánea en el lado dorsal de la pata derecha trasera de cada uno de los animales. Las sustancias a ensayar se administraron 15 minutos antes de la inyección de formalina vía intraperitoneal (i.p.) o 5 minutos antes de la inyección de formalina vía intravenosa (i.v.). Las modificaciones específicas del comportamiento, por ejemplo levantar y agitar la pata, el desplazamiento del peso del animal y las reacciones de mordida y lamida fueron observadas y registradas en el período de 21 hasta 27 minutos después de la inyección de formalina. El resumen de los diferentes comportamientos se realizó en la llamada Pain-Rate (PR) (tasa del dolor), la cual referida a los intervalos de 3 minutos representa el cálculo de la reacción nocicepción promedio. El cálculo de la tasa de dolor (PR) se basa en una ponderación numérica (= cada factor 1, 2, 3) de los comportamientos observados en el animal (correspondiente a la puntuación del comportamiento 1, 2, 3) y se calcula con la siguiente fórmula: $PR = [(T_0 \times 0) + (T_1 \times 1) + (T_2 \times 2) + (T_3 \times 3)]/180$, siendo T_0 , T_1 , T_2 y T_3 los tiempos en segundos en los cuales el animal muestra los comportamientos 0, 1, 2 y 3 respectivamente. El tamaño del grupo es de 10 animales ($n = 10$).

b) Ensayo de formalina en ratones

35 La formalina se aplicó a un volumen de 20 μ l y una concentración del 1% vía subcutánea en el lado dorsal de la pata derecha trasera de cada uno de los animales. Las sustancias a ensayar se administraron 15 minutos antes de la inyección de formalina vía intraperitoneal (i.p.). Las modificaciones específicas en el comportamiento, tales como levantar y agitar la pata (puntuación 3, Dubuisson & Dennis, 1977), fueron observadas y registradas en el período de 21 hasta 24 minutos. El tamaño de los grupos es de 10 animales ($n = 10$).

40 A continuación, la presente invención se explicará en base a los siguientes ejemplos. Estos ejemplos se proporcionan a modo ilustrativo y no limitan el alcance general de la invención.

Ejemplos

Los rendimientos de los compuestos preparados no han sido optimizados. Las temperaturas no han sido corregidas.

Abreviaturas

Equivalente	Equivalente en masa
Ac.	Acuoso/a
d	Días

DCC	Diciclohexilcarbodiimida
DCM	Diclorometano
DMAP	4-dimetilaminopiridina
DMF	N,N-dimetilformamida
DIPE	Diisopropil éter
EE	Acetato de etilo
EDCI	N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida
Éter	Diethyl éter
EtOH	Etanol
Sat.	Saturado/a
H ₂ O	Agua
HATU	N-[(dimetilamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridin-1-ilmetileno]-N-metilmetanaminio hexafluorofosfato N-óxido
HBTU	O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio hexafluorofosfato
MeCN	Acetonitrilo
MeOH	Metanol
NET ₃	Trietilamina
RT	Temperatura ambiente
SC	Cromatografía en columna
THF	Tetrahidrofurano

Los productos químicos y disolventes empleados fueron obtenidos comercialmente de los proveedores usuales (Acros, Avocado, Aldrich, Bachem, Fluka, Lancaster, Maybridge, Merck, Sigma, TCI, etc.) o se sintetizaron según métodos conocidos por el experto.

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

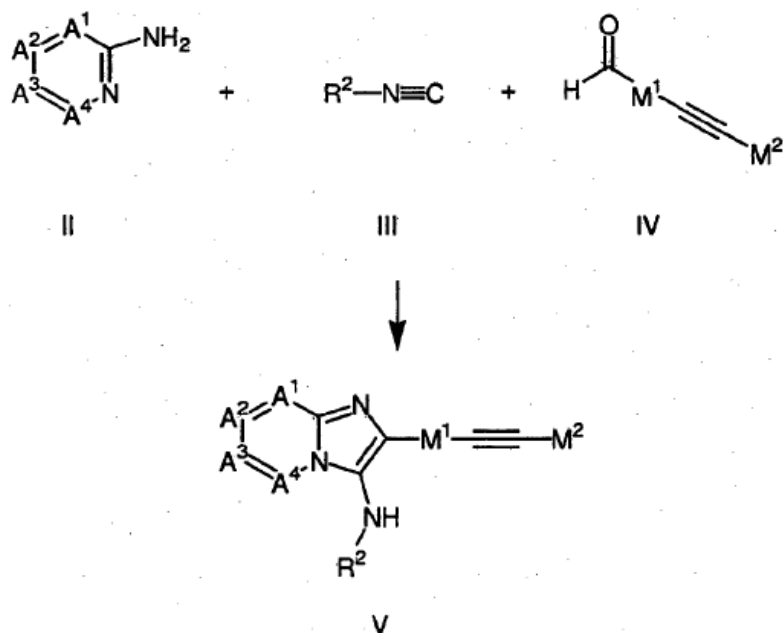
Los análisis cromatográficos en capa fina se realizaron con placas HPTLC de Kieselgel 60 F 254, de la firma E. Merck, Darmstadt, Alemania.

Las proporciones en mezcla de los disolventes, diluyentes o para los análisis cromatográficos siempre se indican en volumen/volumen.

- 10 La analítica se realizó mediante espectroscopía de masas y NMR.

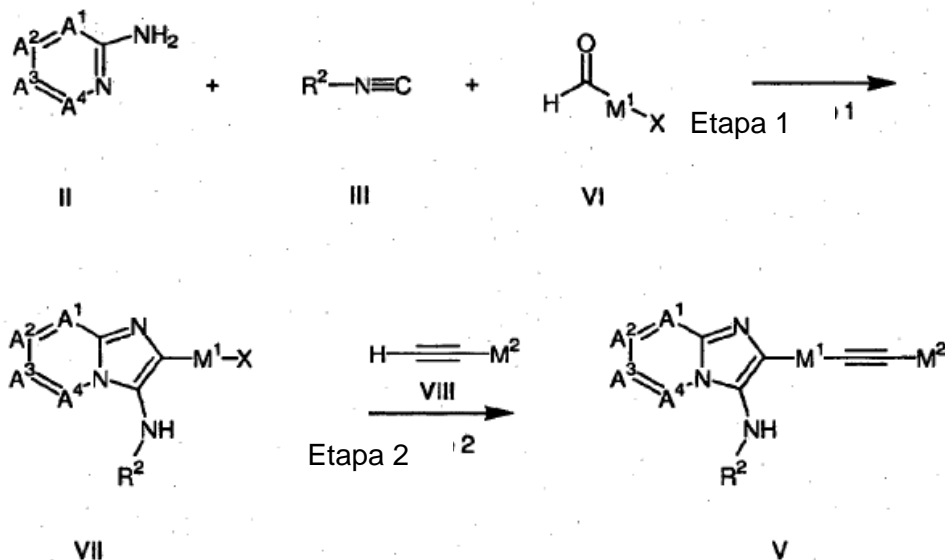
Procedimientos generales de los ejemplos para la preparación de imidazo-3-il-aminas sustituidas bicíclicas

Esquema general de síntesis 1:



5 La reacción de la amina (1 equivalente) de fórmula general (II) (1 equivalente) con el isocianuro de fórmula general (III) y el aldehído (1 equivalente) de fórmula general (IV) para obtener los compuestos de fórmula general (V) se llevó a cabo en disolventes orgánicos o mezclas de los mismos, por ejemplo cloroformo, DCM, MeCN o EtOH, mediante la adición de un ácido orgánico o inorgánico, por ejemplo ácido trifluoroacético o ácido perclórico, o mediante la adición de un triflato de metal de transición, por ejemplo triflato de escandio(III), triflato de iterbio o triflato de indio(III), a temperaturas entre 0 y 150°C.

Esquema general de síntesis 2



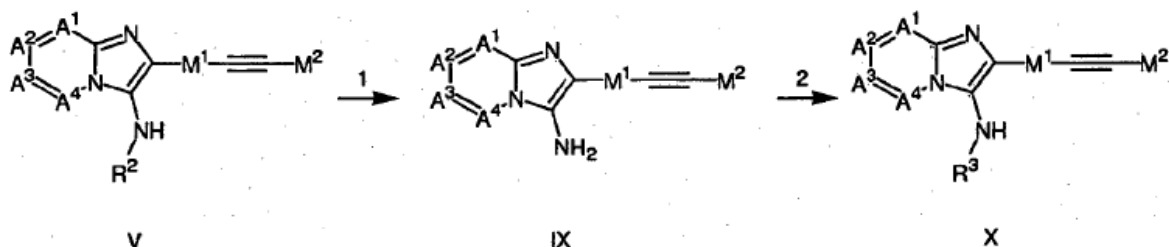
10 En la etapa 1 se llevó a cabo la reacción de la amina (1 equivalente) de fórmula general (II) con el isocianuro (1 equivalente) de fórmula general (III) y el aldehído (1 equivalente) de fórmula general (VI), donde X representa un grupo halógeno, para obtener los compuestos de fórmula general (VII), en disolventes orgánicos o mezclas de los mismos, por ejemplo cloroformo, DCM, MeCN o EtOH, mediante la adición de un ácido orgánico o inorgánico, por ejemplo ácido trifluoroacético o ácido perclórico, o mediante la adición de un triflato de metal de transición, por ejemplo triflato de escandio(III), triflato de iterbio o triflato de indio(III), a temperaturas entre 0 y 150°C.

15

En la etapa 2 se llevó a cabo la reacción de los compuestos de fórmula general (VII) (1 equivalente), donde X representa un grupo halógeno, con el acetileno (2,5 equivalentes) de fórmula general (VIII), para obtener los

compuestos de fórmula general (V), en un disolvente o mezclas de los mismos, por ejemplo tolueno, THF, DMF, MeCN, éter, NET_3 o diisopropilamina, mediante la adición de un catalizador de paladio, por ejemplo cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II), de yoduro de cobre(I) y una base orgánica, por ejemplo NET_3 o diisopropilamina, y/o una base inorgánica, por ejemplo carbonato de potasio o carbonato de cesio, a temperaturas entre -70 y 150°C .

5 Esquema general de síntesis 3:



En la etapa 1 se transformaron los compuestos de fórmula general (V) en las aminas de fórmula general (IX), en un disolvente o mezcla de disolventes, por ejemplo EtOH, MeOH o acetona, mediante la adición de un ácido orgánico o inorgánico, por ejemplo ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido clorhídrico o ácido sulfúrico, a temperaturas entre 0 y 80°C .

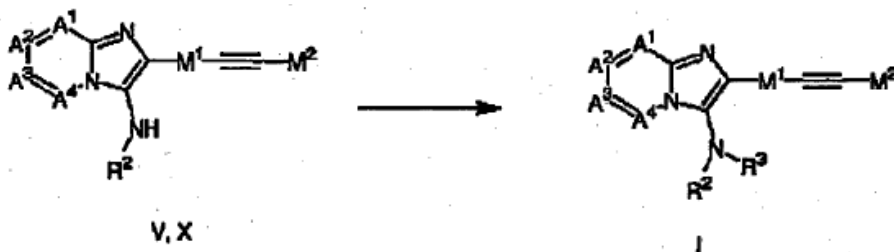
En la etapa 2 se hicieron reaccionar los compuestos de fórmula general (IX) (1 equivalente) con el ácido carboxílico (1 equivalente) de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-(C=O)-OH}$, en un disolvente o mezcla de disolventes, por ejemplo éter, THF, MeCN, MeOH, EtOH, DMF o DCM, con o sin la incorporación de un reactivo de acoplamiento (1 equivalente), por ejemplo DCC, BOP, HATU o EDCI y, opcionalmente, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, por ejemplo NET_3 o diisopropilamina, a temperaturas entre -70 y 100°C , obteniéndose los compuestos de fórmula general (X).

Alternativamente, los compuestos de fórmula general (IX) se hicieron reaccionar con haluros de ácido carboxílico (1 equivalente) o con derivados de ácido carbónico, de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-(C=O)-X}$, donde X representa un grupo halógeno, en un disolvente o mezcla de disolventes, por ejemplo éter, THF, MeCN, MeOH, EtOH, DMF o DCM, con o sin la incorporación de una base orgánica o inorgánica, por ejemplo NET_3 , DMAP, piridina o diisopropilamina, a temperaturas entre -70 y 100°C , obteniéndose los compuestos de fórmula general (X).

De otro modo, los compuestos de fórmula general (IX) (1 equivalente) se hicieron reaccionar con los aldehídos (1 equivalente) de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-C(=O)-H}$, en un disolvente o mezcla de disolventes, por ejemplo éter, THF, MeOH, EtOH, DCM o tolueno y posteriormente se agregó un agente reductor, por ejemplo borohidruro de sodio, acetoxiborohidruro de sodio o cianoborohidruro de sodio, a temperaturas entre -70 y 100°C , obteniéndose los compuestos de fórmula general (X).

Asimismo, los compuestos de fórmula general (IX) (1 equivalente) se hicieron reaccionar con los compuestos de fórmula general $\text{R}^3\text{-X}$ (1,1 equivalentes), donde X representa un grupo halógeno, especialmente cloro, en un disolvente o mezcla de disolventes, por ejemplo tolueno, THF o éter, mediante la adición de una sal hidruro metálico (1,1 equivalentes), preferentemente incorporando hidruro de sodio, obteniéndose los compuestos de fórmula general (X), a temperaturas entre 0°C y 40°C .

Esquema general de síntesis 4:



Los compuestos de fórmula general (V) o (X) se pueden transformar en los compuestos de fórmula general (I) por los mismos métodos descritos en el Esquema de síntesis general 3, etapa 2.

A continuación, se detallarán las disposiciones anteriormente descritas para la preparación de imidazo-3-il-aminas sustituidas bicíclicas en relación con algunos compuestos ilustrativos.

Ejemplo 1: Síntesis de ciclopentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

5 A una solución de 9,5 mg (0,1 mmol) de 2-aminopirazina en MeOH (1 ml) se agregó consecutivamente 10 µl (0,022 mmol) de ácido perclórico acuoso al 20%, una solución de 31,8 mg (0,15 mmol) de 5-feniletinil-tiofen-3-carbaldehído en una mezcla MeOH y DCM (0,5 ml; 1:1 v/v) y una solución de 11,1 mg (0,115 mmol) de isocianuro de ciclopentilo en MeOH (0,5 ml). La solución de reacción se agitó 36 horas a RT y, a continuación, se mezcló con una disolución de NaCl sat. y ac. (3 ml) y se siguió agitando otros 45 minutos a RT. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con DCM (2 x 3ml). Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa, con lo que se obtuvieron 18 mg (0,047 mmol, 47%) de ciclopentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina.

Ejemplo 18:

Tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-tert-butil-amina

15 237 mg (2,50 mmol) de 2-aminopirazina se disolvieron junto con 208 mg (2,50 mmol) de tert-butilisonitrilo y 0,27 (2,50 mmol) de 5-bromotiofen-2-carbaldehído, en DCM (5 ml). Después de agregar ácido perclórico (0,25 mmol) se agitó durante 5 d a RT. A continuación, se lavó con una disolución ac. y sat. de carbonato de sodio y una disolución ac. y sat. de cloruro de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y concentró al vacío. Después de cromatografía en columna (EE/DIPE/DCM 2:2:1) del residuo, se obtuvieron 471 mg (1,3 mmol, 54% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-tert-butil-amina.

b) Síntesis de tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

25 420 mg (1,2 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-tert-butil-amina se disolvieron en DMF (9 ml) junto con 0,33 ml (3,0 mmol) de fenilacetileno, 42 mg (0,06 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II) y 22 mg (0,12 mmol) de yoduro de cobre(I). Después de agregar 1,6 ml (12,0 mmol) de trietilamina, se agitó durante 16 horas a 50°C. A continuación, la solución de reacción se diluyó con EE y se mezcló con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y 2 veces con una disolución sat. y ac. de cloruro de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtración y separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna del residuo (EE/DCM 1:4), después de lo cual se obtuvieron 326 mg (0,88 mmol, 73% teórico) de tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina.

Ejemplo 31:

(1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1-feniletil)-amina

35 951 mg (10,0 mmol) de 2-aminopirazina se disolvieron en cloroformo (24 ml) junto con 1,31 g (10,0 mmol) de 1-feniletisonitrilo y 1,08 ml (10,0 mmol) de 5-bromotiofen-2-carbaldehído. Después de agregar ácido perclórico (1,00 ml), se agitó 5 d a RT. A continuación, se mezcló con una disolución ac. y sat. de carbonato de sodio y las fases se separaron. La fase ac. se extrajo con DCM. Las fases orgánicas purificadas se lavaron con una disolución ac. y sat. de carbonato de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y concentraron al vacío. Después de cromatografía en columna del residuo (EE/DCM 1:1), se obtuvieron 831 mg (2,1 mmol, 21% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1-feniletil)-amina.

b) Síntesis de (1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

45 497 mg de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1-feniletil)-amina se disolvieron en DMF (10 ml) junto con 0,34 ml (3,13 mmol) de fenilacetileno, 43 mg (0,06 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II) y 24 mg (0,13 mmol) de yoduro de cobre(I). Después de agregar 1,7 ml (12,5 mmol) de trietilamina, se agitó la mezcla durante 16 horas a 50°C. A continuación, la solución de reacción se diluyó con EE y se mezcló con una disolución ac. y sat. de carbonato de sodio. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y 2 veces con una disolución sat. y ac. de cloruro de sodio y se secaron

sobre sulfato de magnesio. Después de filtración y la separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna del residuo (EE/DCM 1:3), después de lo cual se obtuvieron 158 mg (0,38 mmol, 30% teórico) de (1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina.

Ejemplo 56:

5 [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina

a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-amina

4,76 g (50,0 mmol) de 2-aminopirazina se disolvieron en cloroformo (40 ml) junto con 8,76 ml (50,0 mmol) de 1,1,3,3-tetrametil-butilisonitrilo y 5,42 ml (50,0 mmol) de 5-bromotiofen-2-carbaldehído. Después de agregar ácido perclórico (5 ml), se agitó la mezcla 16 horas a 50°C. Después de entibiar a RT, se lavó la mezcla 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y concentró al vacío. Después de cromatografía en columna (EE/DCM 1:3) del residuo, se obtuvieron 11,39 g (28,0 mmol, 56% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-amina.

b) Síntesis de [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina

3,65 g (9,0 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina se disolvieron en DMF (30 ml) junto con 1,18 ml (10,8 mmol) de fenilacetileno, 0,16 g (0,23 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II) y 0,08 g (0,45 mmol) de yoduro de cobre(I). Después de agregar 2,50 ml (18,00 mmol) de trietilamina, se agitó la mezcla 16 horas a 50°C. A continuación, la solución de reacción se diluyó con EE y se mezcló con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtración y la separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna del residuo (EE/DIPE/DCM 3:3:4), después de lo cual se obtuvieron 3,38 g (7,9 mmol, 88% teórico) de [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina.

Ejemplo 59:

[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina

25 a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-amina

235 mg (2,5 mmol) de 2-aminopiridina se disolvieron en DCM (5 ml) junto con 0,42 ml (2,5 mmol) de 1,1,3,3-tetrametil-butilisonitrilo y 0,27 ml (2,5 mmol) de 5-bromotiofen-2-carbaldehído. Después de agregar ácido perclórico (0,25 ml), se agitó 5 d a RT. A continuación, se lavó con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y con una disolución sat. y ac. de cloruro de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Después de cromatografía en columna (EE/DIPE/DCM 2:2:1) del residuo, se obtuvieron 724 mg (1,7 mmol, 71% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina.

b) Síntesis de [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina

324 mg (0,80 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina se disolvieron en DMF (6 ml) junto con 0,11 ml (0,96 mmol) de fenilacetileno, 14 mg (0,02 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II) y 7 mg (0,04 mmol) de yoduro de cobre(I). Después de agregar 1,1 ml (8,0 mmol) de trietilamina, se agitó a 50°C durante 2 d. A continuación, la solución de reacción se diluyó con EE y se mezcló con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio. Las fases se separaron y la fase acuosa se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y 2 veces con una disolución sat. y ac. de cloruro de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtración y separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna del residuo (EE/DIPE/DCM 3:3:4), después de lo cual se obtuvieron 54 mg (0,13 mmol, 16% teórico) de [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina.

Ejemplo 60:

Síntesis de [2-(5-piridin-3-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina

600 mg (1,48 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina se disolvieron en DMF (10 ml) junto con 183 mg (1,77 mmol) de 3-etinilpiridina, 104 mg (0,15 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II) y 28 mg (0,15 mmol) de yoduro de cobre(I). Después de agregar 2,00 ml (14,78 mmol) de trietilamina, se agitó a 50°C durante 3 d. A continuación, la solución de reacción se diluyó con EE y se mezcló con una disolución ac. y sat. de carbonato de sodio. Las fases se separaron y la fase acuosa se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas

se lavaron 2 veces con una disolución sat. y ac. de carbonato de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtración y separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna (EE) del residuo. Después de cristalización del producto bruto resultante se obtuvieron 310 mg (0,72 mmol, 49% teórico) de [2-(5-piridin-3-iletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina.

5 **Ejemplo 83:**

2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina, clorhidrato

2,32 g (5,44 mmol) de [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina (Ejemplo 60) se disolvieron en metanol (90 ml) y se mezclaron con 5,3 ml (54,4 mmol) de una disolución de HCl al 32%. La solución de reacción se agitó durante 16 horas a RT. El precipitado resultante se filtró y se lavó con metanol. Así, se obtuvieron 1,39 g (3,95 mmol, 73% teórico) de clorhidrato de 2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina como una sustancia sólida.

Ejemplo 65:

Dimetil-[2(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

790 mg (2,5 mmol) de clorhidrato de 2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina (Ejemplo 83) se disolvieron en DMF (8 ml). Después de agregar por porciones 300 mg (7,5 mmol) de hidruro de sodio (dispersión al 60% en aceite mineral) se agitó la mezcla 30 minutos a RT. A continuación, se agregaron gota a gota 0,3 ml (5,0 mmol) de yoduro de metilo en DMF (2 ml). La solución de reacción se siguió agitando otras 4 horas a RT y luego se detuvo la reacción con agua (20 ml) y se extrajo con EE (2 x 50 ml). Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y concentraron al vacío. Del residuo se obtuvieron 351 mg (1,0 mmol, 40% teórico) de dimetil-[2(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina mediante cristalización (EE).

Ejemplo 68:

Etil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2a]pirazin-3-il]-amina

395 mg (1,25 mmol) de clorhidrato de 2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina (Ejemplo 83) se disolvieron en DMF (8 ml). Después de agregar 100 mg (2,5 mmol) de hidruro de sodio (dispersión al 60% en aceite mineral), se agitó la mezcla durante 1 hora a RT. A continuación, se agregó gota a gota una solución de 74 µl (0,8 mmol) de bromuro de etilo en DMF (2 ml). La solución de reacción se agitó 16 horas a RT, luego se detuvo la reacción con agua (10 ml) y se extrajo esta solución con EE (2 x 50 ml). Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron al vacío. Mediante cromatografía en columna (sílica gel, EE/DCM 4:1) se obtuvieron 253 mg (0,74 mmol, 58% teórico) de etil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2a]pirazin-3-il]-amina.

30 **Ejemplo 94:**

Síntesis de N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina

1,32 g (14,1 mmol) de 2-aminopirizina se disolvieron en cloroformo (40 ml) junto con 3,00 g (14,1 mmol) de 5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-carbaldehído, 1,59 ml (14,1 mmol) de tert-butilisonitrilo y 2,07 g (4,2 mmol) de trifluorometanosulfonato de escandio(III). La solución de reacción se calentó 60 minutos a 80°C en un horno microondas (800 Watt, MLS-Ethos1600) y luego se diluyó con DCM. Posteriormente, se lavó la solución con una disolución 1M de Na₂CO₃ y una disolución ac. y sat. de NaCl. A continuación, se secó la solución sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró al vacío. Por cristalización del residuo a partir de EE se obtuvieron 3,43 g (9,2 mmol, 65% teórico) de N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina.

Ejemplo 116:

40 **Síntesis de N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina**

A una solución de 229 mg (2,4 mmol) de 2-aminopirizina en cloroformo (20 ml) se agregaron, consecutivamente, 500 mg (2,4 mmol) de 4-piridin-2-iletinil-benzaldehído, 200 mg (2,4 mmol) de tert-butilisonitrilo y 215 µl (0,48 mmol) de ácido perclórico ac. al 20%. La solución de reacción se agitó a 45°C durante 16 horas y luego se diluyó con DCM. Posteriormente, se lavó con una disolución 1M de Na₂CO₃ y una disolución ac. y sat. de NaCl. A continuación, se secó sobre MgSO₄, se filtró y se concentró al vacío. La SC (EE) se llevó a cabo con el residuo, obteniéndose así 565 mg (1,5 mmol, 64% teórico) de N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

Ejemplo 120:

Síntesis de ácido 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxílico

Una solución de 200 mg (0,47 mmol) de 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo (Ejemplo 106) en una mezcla de MeOH (5 ml) y MeCN (5,5 ml) se mezcló 5 ml (0,51 mmol) de una disolución 0,1M ac. de NaOH y se agitó 1 hora a RT. A continuación, la mezcla de reacción se mezcló con 26 µl de una solución ac. 5N de ácido acético. Posteriormente, el disolvente se destiló y retiró al vacío. La fase ac. remanente se extrajo con EE varias veces. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron al vacío. Por cristalización del residuo a partir de DCM/hexano (1:2) se obtuvieron 87 mg (0,21 mmol, 44% teórico) de ácido 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxílico.

Ejemplo 141:**Síntesis de N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina**

Una solución de 222 mg (2,34 mmol) de 2-aminopiridina, 499 mg (2,34 mmol) de 5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-carbaldehído, 195 mg (2,34 mmol) de tert-butilisonitrilo y 234 µl de ácido perclórico ac. al 20% en cloroformo (20 ml) se agitó durante 3 d a 47°C. A continuación, se diluyó con DCM y se mezcló con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃. Las fases se separaron y la fase orgánica se lavó con una disolución sat. de NaCl y se secó sobre MgSO₄. Después de filtración y separación del disolvente al vacío, se realizó una cromatografía en columna (EE) del residuo, obteniéndose 80 mg (0,21 mmol, 9% teórico) de N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina.

Ejemplo 143:**Síntesis de N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina**

A una solución de 135 mg (0,36 mmol) de tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina (Ejemplo 77) en DMF (3 ml) se agregaron 43 mg de hidruro de sodio (1,08 mmol, en aceite mineral al 60%) y se agitó la mezcla 1 hora a RT. A continuación, se agregó gota a gota una solución de 67 µl (1,08 mmol) de yoduro de metilo en DMF (500 µl) y se siguió agitando 16 horas a RT. Posteriormente, se renovaron 43 mg (1,08 mmol, en aceite mineral al 60%) de hidruro de sodio y se agregó una solución de 67 µl (1,08 mmol) de yoduro de metilo en DMF (500 µl) y se siguió agitando 16 horas a RT. Luego, la solución de reacción se mezcló consecutivamente con agua, con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃ y una mezcla de EE/THF (3:1). La fase orgánica se separó y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron al vacío. Mediante SC (acetona/MeCN 1:1) se obtuvieron 33 mg (0,09 mmol, 24%) de N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

Ejemplo 156:**Síntesis de N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato**

A una solución de 699 mg (1,9 mmol) de tert-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina (síntesis descrita en el Ejemplo 158, parte a) y 402 mg (2, mmol) de 3-bromotiofen en DMF (20 ml) se agregaron 94 mg (0,5 mmol) de yoduro de cobre(I), 129 mg (0,5 mmol) de trifenilfosfina, 1,32 ml (9,5 mmol) de NEt₃, 701 mg (1,9 mmol) de yoduro de tetra-n-butilamonio y 173 mg (0,25 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). A la solución de reacción se agregaron gota a gota, durante un periodo de 1 hora, 2,5 ml (2,5 mmol) de una solución 1M de fluoruro de tetra-n-butilamonio en TF. A continuación, se agitó la mezcla 18 horas a 70°C. Después de entibiar a RT, se diluyó la mezcla con EE y se mezcló con una disolución ac. 0,5M de Na₂CO₃. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío. Con el residuo se llevó a cabo una SC (acetona/EE 1:3), aislándose 912 mg de producto con pocas impurezas. Por precipitación del clorhidrato de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 192, se obtuvieron 304 mg (0,73 mmol, 38% teórico) de clorhidrato de N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

Ejemplo 158:**N-tert-butil-2-(5-(6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato***a) Síntesis de tert-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina*

A una solución de 45,3 g (129 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-tert-butil-amina (Síntesis descrita en el Ejemplo 18, parte a) en DMF (760 ml) y NEt₃ (90 ml) se agregaron 21,4 ml (155 mmol) de trimetilsililacetileno, 2,4 g (12,9 mmol) de yoduro de cobre(I) y 4,5 g (6,5 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). La solución de reacción se calentó durante 4 horas a 60°C y se agitó 16 horas a RT. A continuación, la solución se mezcló con una disolución ac.1M de Na₂CO₃ y diluyó con EE. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron con agua y se secaron sobre MgSO₄. Después de filtración y eliminación del disolvente al vacío, el residuo obtenido se absorbió con una mezcla EE/DCM (1:1) y se filtró a través de

diatomita. El filtrado se concentró al vacío. Del residuo se obtuvieron por cristalización a partir de *tert*-butil metil éter 30,8 g (84 mmol, 65% teórico) de *tert*-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina.

b) Síntesis de tert-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

5 Una solución de 14,0 g (38,0 mmol) de *tert*-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina en una mezcla de MeOH (385 ml) y MeCN (440 ml) se mezcló con 417 ml (41,8 mmol) de una disolución ac. 0,1M de NaOH. La solución de reacción se agitó 1 hora a RT. A continuación, se retiró en gran parte el disolvente en vacío. La solución obtenida se extrajo varias veces con EE y las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío. Así, se obtuvieron 11,1 g (37,4 mmol, 99% teórico) de *tert*-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina.

10 *c) Síntesis de N-tert-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina*

15 300 mg (1,0 mmol) de *tert*-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina se disolvieron en DMF junto con 138 µl (1,2 mmol) de 2-bromo-6-metilpiridina (7 ml). A esta solución se agregaron 1,4 ml (10,0 mmol) de NEt₃, 19 mg (0,1 mmol) de yoduro de cobre(I) y 71 mg (0,1 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). La mezcla de reacción se calentó 6 horas a 50°C. A continuación, la mezcla se diluyó con EE y se mezcló con una disolución ac 1M. de Na₂CO₃. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío. Mediante SC (acetona/MeCN 1:1) del residuo se obtuvieron 166 mg (0,42 mmol, 42% teórico) de *N-tert*-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

d) Síntesis de N-tert-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato

20 A partir de 161 mg (0,42 mmol) de *N-tert*-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina se obtuvieron 115 mg (0,27 mmol, 65% teórico) de clorhidrato de *N-tert*-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 192.

Ejemplo 165:

Síntesis de N-tert-butil-2-(5-((6-fluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina

25 500 mg (1,69 mmol) de *tert*-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina (Síntesis descrita en el Ejemplo 158, parte b) se disolvieron en DMF (20 ml) junto con 355 mg (2,02 mmol) de 2-bromo-6-fluoropiridina. A esta solución se agregaron 2,4 ml (16,9 mmol) de NEt₃, 32 mg (0,17 mmol) de yoduro de cobre(I) y 119 mg (0,17 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). La mezcla de reacción se calentó 6 horas a 50°C. A continuación, se diluyó con EE y se mezcló con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se lavaron con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃, se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío. Mediante SC (EE) del residuo se obtuvieron 200 mg (0,51 mmol, 30% teórico) de *N-tert*-butil-2-(5-((6-fluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

Ejemplo 176:

Síntesis de N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina

35 Una solución de 290 mg (3,0 mmol) de 2-aminopirazina, 650 mg (3,0 mmol) de 5-piridin-2-iletinil-tiazol-2-carbaldehído, 344 µl (3,0 mmol) de *tert*-butilisonitrilo y 305 µl de ácido perclórico al 20% en DCM (6 ml) se agitó 6 días a RT. A continuación, se diluyó con éter y las fases se separaron. La fase orgánica se lavó con agua y secó sobre MgSO₄. Después de filtración y eliminación del disolvente al vacío, se llevó a cabo una SC con el residuo (hexano/*tert*-butil metil éter 3:2), obteniéndose 170 mg (0,46 mmol, 15% teórico) de *N-tert*-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina.

40 **Ejemplo 192:**

Síntesis de N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato

45 Una solución de 6,93 g (18,6 mmol) de *N-tert*-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina (Ejemplo 94) en DCM (180 ml) se mezcló con 335 µl (18,6 mmol) de agua y 2,35 ml (18,6 mmol) de clorotrimetilsilano y se agitó 16 horas a RT. El precipitado resultante se filtró y secó con vacío a 40°C. Se obtuvieron 6,09 g (14,8 mmol, 80% teórico) de clorhidrato de *N-tert*-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina.

Ejemplo 331:

Tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina, clorhidrato*a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-tert-butil-amina*

5 A una solución de 15,0 g (158 mmol) de 3-aminopiridazina en DCM (150 ml) se agregaron 13,1 g (158 mmol) de tert-butilisonitrilo, 30,2 g (158 mmol) de 5-bromotiofen-2-carboxaldehído y 5,2 g de una disolución ac. de ácido perclórico al 20%. La solución de reacción se agitó 5 días a 40°C. A continuación, se mezcló con agua (200 ml) y las fases se separaron. La fase ac. se extrajo con DCM. Las fases orgánicas purificadas se lavaron consecutivamente con una disolución sat. de NaHCO₃ y una disolución sat. y ac. de NaCl, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y concentraron al vacío. Con el residuo se llevó a cabo una SC (alúmina, EE/hexano 2:98), obteniéndose 1,7 g (4,8 mmol, 3% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-tert-butil-amina.

10 *b) Síntesis de tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina, clorhidrato*

15 A una solución de 2,0 g (5,7 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-tert-butil-amina en DMF (50 ml) se agregaron 0,42 ml (7,4 mmol) de 2-etilpiridina, 7,9 ml (57,0 mmol) de NEt₃, 280 mg (0,26 mmol) de yoduro de cobre(I) y 519 mg (0,74 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). La solución de reacción se calentó 6 horas a 50°C. A continuación, se diluyó con EE y mezcló con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃. Las fases se separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y concentraron al vacío. Mediante SC (EE) del residuo se obtuvieron 546 mg de la amina. A partir de ella se prepararon 440 mg (1,1 mmol, 19% teórico) del clorhidrato de tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina según el procedimiento descrito en el Ejemplo 192.

Ejemplo 332:20 **Tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato***a) Síntesis de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-tert-butil-amina*

25 Una solución de 32,3 g (343,4 mmol) de 2-aminopiridina, 37,2 ml (343,4 mmol) de 5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-carbaldehído, 28,6 g (343,4 mmol) de tert-butilisonitrilo y 34,3 ml de ácido perclórico ac. al 20% en DCM (660 ml) se agitó 10 días a RT. A continuación, se diluyó la solución de reacción con DCM y se lavó consecutivamente con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃ y una disolución ac. sat. de NaCl. La fase orgánica se secó sobre MgSO₄, filtró y concentró al vacío. Por cristalización a partir de EE del residuo se obtuvieron 56,3 g (160,7 mmol, 47% teórico) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-tert-butil-amina.

b) Síntesis de tert-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina

30 A una solución de 10,5 g (30,0 mmol) de [2-(5-bromotiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-tert-butil-amina en DMF (180 ml) y NEt₃ (21 ml) se agregaron 5,0 ml (36,0 mmol) de trimetilsililacetileno, 0,57 g (3,0 mmol) de yoduro de cobre(I) y 2,1 g (3,0 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). La solución de reacción se agitó durante 16 horas a 50°C. A continuación, se mezcló con una disolución ac. 1M de Na₂CO₃ y se diluyó con EE. Esta mezcla se filtró mediante diatomita. Posteriormente, las fases separaron y la fase ac. se extrajo con EE. Las fases orgánicas purificadas se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío. Con el residuo se llevó a cabo una SC (EE/DCM 1:1), obteniéndose 8,0 g (21,8 mmol, 73% teórico) de tert-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina.

c) Síntesis de tert-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina

40 11,5 g (31,3 mmol) de tert-butil-[2-(5-trimetilsilaniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina se disolvieron en una mezcla de MeOH (230 ml) y DCM (50 ml) y se mezcló con 431 mg (3,13 mmol) de carbonato de potasio. La solución de reacción se agitó 30 minutos a RT y, a continuación, se mezcló con agua (200 ml). Posteriormente se extrajo con DCM y la fase orgánica se lavó con agua y se secó sobre MgSO₄. Después de filtración y concentración al vacío, se obtuvieron 9,0 g (30,5 mmol, 97% teórico) de tert-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina.

d) Síntesis de tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato

45 A una solución de 1,0 g (3,4 mmol) de tert-butil-[2-(5-etinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina en EE (20 ml) se agregaron 383 µl (4,3 mmol) de 2-bromotiazol, 882 µl (6,36 mmol) de trietilamina, 43 mg (0,23 mmol) de yoduro de cobre(I) y 87 mg (0,13 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfina)-paladio(II). Esta solución de reacción se agitó 16 horas a 50°C. A continuación, se filtró mediante diatomita y se concentró al vacío. Con el residuo se llevó a cabo una SC

(EE/DCM 3:7), obteniéndose 902 mg (2,4 mmol, 70% teórico) de tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina. A partir de ella se preparó el clorhidrato de tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 192.

- 5 La preparación no descrita de los restantes compuestos de acuerdo con los siguientes Ejemplos se realizó de forma análoga a las disposiciones de preparación anteriormente indicadas, donde el experto podrá reconocer los eductos utilizados en cada caso, a partir de tales disposiciones.

[1]	ciclopentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[2]	ciclohexilmetil-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[3]	ciclohexilmetil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[4]	ciclohexilmetil-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[5]	ciclohexilmetil-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[6]	ciclohexilmetil-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[7]	[8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]ciclohexilmetil-amina
[8]	ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[9]	ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina
[10]	(4-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[11]	(4-metoxibencil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[12]	(4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[13]	(4-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[14]	[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina
[15]	[8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina
[16]	(4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[17]	(4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[18]	tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[19]	tert-butil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[20]	[8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina
[21]	(3-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[22]	(3-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[23]	[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina
[24]	[8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina
[25]	(3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[26]	(3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[27]	[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina
[28]	[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina
[29]	[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina
[30]	[8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina

ES 2 449 517 T3

[31]	(1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[32]	(2-clorobencil)-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[33]	(3-cloro-4-fluorofenil)-[7-fenil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[34]	(4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina
[35]	[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina
[36]	[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-(1-feniletil)-amina
[37]	(2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[38]	(2-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[39]	(2-clorobencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[40]	(2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina
[41]	(3-metoxifenil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[42]	[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina
[43]	(3-metoxifenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[44]	[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-metoxibencil)-amina
[45]	(2-clorobencil)-[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[46]	[7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-cloro-4-fluorofenil)-amina
[47]	(3-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina
[48]	[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina
[49]	[7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina
[50]	(2,4-difluorofenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-7-(3-fenilpropil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[51]	(4-fluorobencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[52]	[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-fluorobencil)-amina
[53]	[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina
[54]	[7-isopropil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina
[55]	tert-butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[56]	[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[57]	butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[59]	[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[60]	[2-(5-piridinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[61]	[2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[62]	[6-cloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[63]	[6,8-dicloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[64]	[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[65]	dimetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina

ES 2 449 517 T3

[66]	metil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[67]	N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-acetamida
[68]	etil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[69]	propil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[70]	butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[71]	(2-metilpropil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[72]	pentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[73]	{{(metoxicarbonilmetil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]amino}acetato de metilo
[74]	bencil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[75]	[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamino]acetato de metilo
[76]	tert-butil-[2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[77]	tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[78]	N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]benzamida
[79]	[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-bis-piridin-3-ilmetil-amina
[80]	2,2-dimetil-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-propionamida
[81]	3-metoxi-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-benzamida
[82]	tert-butil-[2-(5-piridin-3-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[83]	2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina
[84]	2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo
[85]	2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[86]	2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[87]	N-ciclohexil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[88]	2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(piperidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina
[89]	N-tert-butil-N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[90]	2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]piridin-6-carboxilato de metilo
[91]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[92]	8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[93]	N,N-dietil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[94]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[95]	N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[96]	8-bromo-N-tert-butil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[97]	N-tert-butil-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[98]	N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato

ES 2 449 517 T3

[99]	2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(pirrolidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina, clorhidrato
[100]	N-tert-butil-2-(5-((4-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[101]	N-tert-butil-7-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[102]	N-tert-butil-5-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[103]	8-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[104]	N-tert-butil-2-(5-((3-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[105]	N-tert-butil-2-(5-((2-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[106]	3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo
[107]	N-tert-butil-2-(5-(pirazin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[108]	2-(5-((4-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[109]	N-isopropil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[110]	N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[111]	N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[112]	N-tert-butil-2-(5-((2-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[113]	N-tert-butil-2-(5-((3-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[114]	N-tert-butil-2-(5-((4-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[115]	N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]quinolin-1-amina
[116]	N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[117]	N-tert-butil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[118]	N-tert-butil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[119]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[120]	ácido 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxílico
[121]	4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol, clorhidrato
[122]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol,
[123]	2-(5-((3-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[124]	2-(5-((2-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[125]	N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[2,1-a]isoquinolin-3-amina
[126]	N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[127]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[128]	2-(5-((6-aminopiridin-3-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[129]	N-tert-butil-2-(5-(pirimidin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[130]	N-tert-butil-2-(5-((4-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[131]	N-tert-butil-2-(5-((5-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[132]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato

ES 2 449 517 T3

[133]	N-tert-butil-2-(5-(tiazol-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[134]	2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[135]	N-tert-butil-2-(5-((5-metiltiofen-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[136]	2-(5-((6-aminopiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[137]	N-tert-butil-2-(5-((3-metiltiofen-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[138]	N-tert-butil-2-(4-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[139]	N-tert-butil-2-(5-(m-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[140]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzonnitrilo, clorhidrato
[141]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[142]	N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[143]	N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[144]	4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzonnitrilo, clorhidrato
[145]	2-(5-((1H-indol-6-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[146]	N-tert-butil-2-(2-(feniletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[147]	N-tert-butil-2-(5-(quinolin-6-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[148]	2-(5-((3-(1H-pirrol-1-il)fenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[149]	2-(5-((1H-indol-4-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[150]	N-tert-butil-2-(5-((3-nitrofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[151]	N-tert-butil-2-(5-((4-nitrofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[152]	N-tert-butil-2-(5-(tiazol-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[153]	2-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol,
[154]	2-(5-((3-(aminometil)fenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[155]	2-(5-(bifenil-3-iletinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[156]	N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[157]	N-tert-butil-2-(5-((3-(dimetilamino)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[158]	N-tert-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[159]	N-tert-butil-2-(5-((3-fluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[160]	N-tert-butil-2-(5-((3-(metilamino)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[161]	N-tert-butil-2-(5-(p-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[162]	N-tert-butil-2-(5-(o-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[163]	N-tert-butil-2-(4-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[164]	N-tert-butil-2-(4-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[165]	N-tert-butil-2-(5-((6-fluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[166]	N-tert-butil-2-(5-((2-nitrofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina

ES 2 449 517 T3

[167]	N-tert-butil-8-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[168]	N-tert-butil-2-(5-((6-metoxipiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[169]	N-tert-butil-2-(5-((5-fluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[170]	2-(4-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)-2-(feniletinil)fenil)-acetonitrilo
[171]	N-tert-butil-2-(5-((5-metoxipiridin-3-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[172]	5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)nicotinonitrilo, clorhidrato
[173]	N-tert-butil-2-(5-((3-(metiltio)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[174]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzoato de metilo
[175]	N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluoropiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[176]	N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[177]	N-tert-butil-2-(2-(piridin-4-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[178]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-benzaldehído
[179]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-4-fluorobenzonitrilo
[180]	N-tert-butil-2-(5-((3-(trifluorometil)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[181]	N-tert-butil-2-(2-(piridin-2-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[182]	N-tert-butil-2-(3-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[183]	N-tert-butil-2-(3-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[184]	N-tert-butil-2-(5-((3-vinilfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[185]	2-(5-((1H-imidazol-4-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[186]	N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[187]	N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[188]	N-tert-butil-2-(5-((2-(tert-butildifenilsilil)tiazol-5-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[189]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzonitrilo
[190]	N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[191]	N-tert-butil-2-(5-(tiazol-5-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[192]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[193]	6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[194]	5,7-dimetil-N-fenetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[195]	N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[196]	N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[197]	N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[198]	N-(4-clorobencil)-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[199]	N-(3-metoxifenetil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[200]	N-(2-metilhexan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina

ES 2 449 517 T3

[201]	N-fenetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[202]	N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[203]	2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[204]	N-(4-clorobencil)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[205]	N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[206]	N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[207]	N-(2-metoxibencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[208]	N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[209]	N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[210]	8-bromo-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[211]	8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[212]	N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[213]	N-(1-feniletil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[214]	N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[215]	8-bromo-N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[216]	N-ciclopentil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[217]	N-(3-metoxifenetil)-7-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[218]	8-(benciloxi)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[219]	8-(benciloxi)-N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[220]	8-(benciloxi)-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[221]	6-cloro-N-(4-fluorobencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[222]	6-bromo-N-butil-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[223]	N-(furan-2-il)-8-metil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[224]	N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[225]	N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)-7-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[226]	5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(3-(trifluorometil)fenil)-imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[227]	6-bromo-N-(4-clorofenetil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[228]	N-(4-clorofenetil)-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[229]	N-fenetil-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[230]	N-(4-clorobencil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[231]	6-bromo-N-(4-clorobencil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[232]	8-bromo-N-(4-clorobencil)-6-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[233]	N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-5-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[234]	6-bromo-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina

ES 2 449 517 T3

[235]	7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[236]	6,8-dibromo-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[237]	6-bromo-N-(2,6-dimetilfenil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[238]	N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[239]	2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[240]	N-ciclopentil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[241]	8-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[242]	N-(4-fluorofenil)-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[243]	N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[244]	N-ciclohexil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[245]	N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[246]	8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[247]	N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[248]	2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[249]	N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[250]	8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[251]	N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[252]	N-(4-fluorofenil)-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[253]	2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[254]	N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[255]	2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[256]	2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[257]	N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[258]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[259]	N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[260]	N-ciclopentil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[261]	N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[262]	2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[263]	N-(4-fluorofenil)-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[264]	N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[265]	N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[266]	N-(4-fluorofenil)-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[267]	N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[268]	N-tert-butil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina

ES 2 449 517 T3

[269]	N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[270]	6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[271]	6-metil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[272]	N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[273]	N-ciclohexil-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[274]	N-ciclohexil-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[275]	7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[276]	N-tert-butil-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[277]	N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[278]	N-tert-butil-7-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[279]	N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[280]	N-ciclohexil-8-metil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[281]	N-ciclopentil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[282]	N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[283]	N-ciclohexil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[284]	2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[285]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[286]	N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[287]	N-(4-fluorofenil)-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[288]	N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[289]	2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[290]	N-tert-butil-5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[291]	5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[292]	N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[293]	N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[294]	N-ciclopentil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[295]	N-tert-butil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina
[296]	N-(4-fluorofenil)-8-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[297]	N-ciclohexil-8-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[298]	N-ciclohexil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[299]	7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[300]	N-ciclohexil-7-etil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[301]	N-ciclopentil-7-etil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina

ES 2 449 517 T3

[302]	N-ciclopentil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[303]	N-tert-butil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[304]	N-tert-butil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[305]	7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[306]	N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[307]	N-tert-butil-7-isopropil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[308]	N-ciclohexil-7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[309]	N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[310]	6-cloro-N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[311]	N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[312]	6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[313]	6-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[314]	N-tert-butil-6-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[315]	6-cloro-N-ciclohexil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[316]	N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[317]	6-cloro-N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[318]	6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[319]	6-cloro-N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[320]	N-tert-butil-6-cloro-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[321]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato
[322]	N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina
[323]	N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato
[324]	[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina
[325]	tert-butil-[2-(5-pirimidin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato
[326]	{2-[5-(3-aminopiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-tert-butil-amina
[327]	tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[328]	tert-butil-[2-(2-piridin-2-iletinil-tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[329]	tert-butil-[2-[5-(6-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato
[330]	tert-butil-[2-[5-(3-cloro-5-fluorofeniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato
[331]	tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina, clorhidrato
[332]	tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato
[333]	tert-butil-[2-[5-(3-trifluorometoksi-feniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina
[334]	tert-butil-[2-[5-(3-[1,3]dioxolan-2-il-feniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina
[335]	tert-butil-[2-[5-(3,5-dimetil-feniletinil)-tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato

[336]	tert-butil-{2-[5-(3-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato
[337]	tert-butil-{2-[5-(3-metil-3H-imidazol-4-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato
[338]	tert-butil-{2-[5-(5-clorotiofen-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato
[339]	tert-butil-{2-[5-(5-metil-piridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato
[340]	1-{3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}-etanona, clorhidrato
[341]	{3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}metanol, clorhidrato
[342]	N-tert-butil-2-(5-((3-metoxipiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[343]	N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[344]	5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-2-fluorobenzonitrilo, clorhidrato
[345]	N-tert-butil-2-(5-((3,4-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[346]	N-tert-butil-2-(5-((3-(metoximetil)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[347]	2-(5-((3-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[348]	N-tert-butil-2-(5-((4-fluor-3-metilfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[349]	N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[350]	N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[351]	N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato
[352]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzenosulfonamida, clorhidrato
[353]	Ácido 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzoico
[354]	3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzamida, clorhidrato
[355]	N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)acetamida
[356]	N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[357]	N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[358]	N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[359]	(6-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)piridin-2-il)metanol
[360]	N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)metanosulfonamida
[361]	N-tert-butil-8-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato
[362]	2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[363]	N-tert-butil-2-(5-((3-clorfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[364]	N-tert-butil-2-(5-((2,3-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina
[365]	N-tert-butil-7-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina

Datos farmacológicos

1. La afinidad por el receptor mGluR5 de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de la fórmula general (I) de la invención se determinó del modo descrito anteriormente. Los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de acuerdo con la invención muestran una alta afinidad por el receptor mGluR5.

En la siguiente Tabla 1 se muestran los datos farmacológicos con respecto de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos según los Ejemplos 1 a 332.

Tabla 1

Compuesto según Ej.	Inhibición del receptor mGluR5 de la unión $^3\text{[H]-MPEP}$ [10 μM] en %, concentración de los compuestos ejemplo 10 μM	IC ₅₀
1	52	
2	95	
3	95	
4	91	
5	100	
6	92	
7	89	
8	100	
9	98	
10	95	
11	82	
12	96	
13	96	
14	100	
15	98	
16	93	
17	96	
18		0,0640
19	78	
20	79	
21	91	
22	84	
23	86	
24	94	
25	81	
26	97	
27	82	
28	98	
29	87	

ES 2 449 517 T3

30	73	
31		0,5300
32	98	
33	98	
34	98	
35	95	
36	100	
37	85	
38	87	
39	72	
40	87	
41	73	
42	93	
43	83	
44	75	
45	93	
46	76	
47	79	
48	82	
49	85	
50	90	
51	89	
52	75	
53	80	
54	69	
55	77	
56	100	
57	94	
59		2,0700
60		1,2000
61		0,0425
62	26	
63	65	
64		0,0330

ES 2 449 517 T3

65		3,8400
66		3,1750
67		3,8400
68		2,3200
69		2,9300
70		1,0600
71		1,2700
72		5,3400
73		2,2100
74		1,1000
75		1,2900
76		0,0037
77		0,0057
79	35	
82		0,2000
83	35	
84		1,3200
85		2,0100
86		0,3200
87	35	
88		1,4000
89		0,0450
91		0,0054
92	82	
93		0,2500
94		0,0033
95		1,7400
96	79	
97		0,5900
98		0,2500
99		0,5400
100		0,3400
101		2,4700
102		8,8500

ES 2 449 517 T3

103	66	
104		0,0920
105		0,1500
106		0,2100
107		0,0520
108		1,2400
109		0,3000
110		0,0490
111		1,3700
112		7,5200
113		0,0750
114		2,1100
115		7,7400
116		0,0760
117		0,8800
118		6,3800
119		0,0360
120		3,6300
121		2,5400
122		0,1300
123		0,0140
124		0,1700
125		6,5200
126		3,2500
127		0,0084
128		15,5500
129		0,0120
130		0,0370
131		0,1400
132		0,0160
133		0,0150
134		0,5700
135		1,2000
136		13,770

ES 2 449 517 T3

137		0,8600
138		15,110
139		0,0710
140		0,0260
141		0,0028
143		0,0032
144		3,6800
146		0,0350
148		0,3300
150		0,1100
152		0,0230
153		2,9900
154		0,5900
156		0,0270
157		1,5500
158		0,0330
159		0,0100
160		0,0940
161		7,7400
162		4,2400
164		0,0540
165		0,0180
166		11,330
167		0,0120
168		0,6400
169		0,0110
171		0,3600
172		0,0360
173		0,8000
174		0,8400
175		0,0510
176		0,0190
177		0,0160
178		0,0240

ES 2 449 517 T3

179		0,0260
180		0,5800
181		0,0180
182		8,8500
183		0,2300
184		0,2700
185		0,1900
192		0,0053
193	79	
194	30	
195	53	
196	68	
197	31	
198	67	
199	57	
200	62	
201	55	
202	70	
203	60	
204	30	
205	92	
206	63	
207	35	
208	57	
209	55	
210	68	
211	82	
212	90	
213	84	
214	77	
215	51	
216	49	
217	62	
218	38	

ES 2 449 517 T3

219	33	
220	31	
221	40	
222	33	
223	80	
224	69	
225	43	
226	41	
227	61	
228	43	
229	30	
230	60	
231	62	
232	75	
233	75	
234	64	
235	32	
236	66	
237	36	
238	92	
239	60	
240	95	
241	65	
242	91	
243	80	
244	54	
245	92	
246	74	
247	83	
248	68	
249	80	
250	69	
251	80	
252	86	

ES 2 449 517 T3

253	73	
254	77	
255	81	
256	43	
257	77	
258	86	
259	82	
260	64	
261	79	
262	72	
263	85	
264	83	
265	68	
266	63	
267	85	
268	75	
269	94	
270	93	
271	31	
272	72	
273	84	
274	85	
275	85	
276	93	
277	95	
278	93	
279	67	
280	31	
281	83	
282	72	
283	82	
284	68	
285	88	
286	72	

ES 2 449 517 T3

287	30	
288	89	
289	51	
290	88	
291	92	
292	88	
293	70	
294	79	
295	84	
296	85	
297	80	
298	95	
299	86	
300	50	
301	78	
302	55	
303	67	
304	94	
305	75	
306	76	
307	88	
308	70	
309	82	
310	86	
311	86	
312	64	
313	33	
314	79	
315	75	
316	55	
317	58	
318	43	
319	81	
320	77	

ES 2 449 517 T3

321		0,0093
322		0,1200
323		0,1100
324		0,0590
325		0,0130
326		0,0390
332		0,0140
333		0,4200
334		10,040
335		
336		0,0061
337		6,2600
338	52	
339		0,3200
340		0,6200
341		0,2400
342		1,3600
343		0,0930
344		0,1700
345		
346		0,6700
347		0,9200
348	44	
349	39	
350		0,5700
351		0,2300

2. El compuesto de la invención analizado, Ejemplo 192, demostró un marcado efecto anti-alodinia de larga duración. Los resultados se resumen en la siguiente Tabla 2.

Tabla 2 Análisis de la inhibición del dolor neuropático en ratón [% de MPE, *maximal possible effect*, efecto máximo posible] inhibición en los puntos de medición individuales y durante todo el tiempo de medida (AUC, *area under the curve*, área bajo la curva)

5

Dosis (mg/kg) p.o.	% de MPE después de suministrar los compuestos				AUC (0-60min)	Test-t
	15 Min	30 Min	45 Min	60 Min		

0	Media	0,4	3,3	2,4	3,4	n.a.	
	Error estándar de la media	1,5	1,0	0,7	0,8	n.a.	
0,215	Media	27,1	19,9	9,3	5,4	15,0	**
	Error estándar de la media	5,4	4,6	3,1	2,2	3,5	
0,464	Media	30,2	27,7	20,3	12,4	22,3	***
	Error estándar de la media	4,8	4,2	4,2	4,5	3,0	
1	Media	48,7	50,9	39,4	31,2	42,9	***
	Error estándar de la media	5,9	3,6	5,8	5,7	4,2	
2,15	Media	42,9	54,7	34,3	13,7	38,2	***
	Error estándar de la media	7,8	7,0	6,3	4,7	3,9	
4,64	Media	46,2	72,1	39,9	23,9	47,4	***
	Error estándar de la media	6,5	5,8	7,5	8,0	5,3	
		n.a.: no aplicable					

3. El compuesto de la invención, Ejemplo 192, fue ensayado 60 minutos después de la administración p.o. y produjo un efecto ansiolítico dosis-dependiente caracterizado por un aumento significativo del tiempo con los brazos abiertos. La dosis activa más baja fue de 2,15 mg/kg y se determinó un valor ED₅₀ de 2,75 (95% de intervalo de confianza 0,65-5,58) mg/kg.

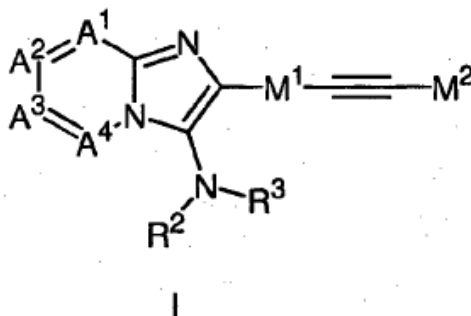
- 5 4. Asimismo, los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos de acuerdo con la invención demuestran un marcado efecto en el Ensayo de Formalina en el ratón o la rata, tal como se indica en la siguiente Tabla 3.

Tabla 3

ED ₅₀ [mg/kg] o % de inhibición	Ratón			Rata	
	i.v.	p.o.	i.p.	p.o.	i.p.
Ejemplo					
91	-	7,3	4,7	2,3	1,2
110	-	61% a 21,5 mg/kg	-	-	-
116	-	-	-	-	15,2
127	-	5,9	2,2	-	7,7
192	0,8	7,6	41% a 4,64 mg/kg	-	-

REIVINDICACIONES

1. Compuestos imidazo-3-il-amina bicíclicos sustituidos de fórmula general I,



5 donde

A¹ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1b},

A³ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1d},

10 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno, un grupo halógeno; -NO₂; -CN; -NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -NH-C(=O)-R⁷; -C(=O)-R⁸; -C(=O)-NH₂; -C(=O)-NHR⁹; -C(=O)-NR¹⁰R¹¹; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2, 3, 4 ó 5; -O-C(=O)-R¹⁴; -(CH₂)_n-O-C(=O)-R¹⁵ con n = 1, 2, 3, 4 ó 5; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2, 3, 4 ó 5; -SR¹⁸; -(CH₂)_p-S(=O)_t-R¹⁹ con p = 1, 2, 3, 4 ó 5 y t = 0, 1 ó 2; -NH-S(=O)₂-R²⁶R²⁷; -S(=O)₂-NR²⁸R²⁹; -SF₅; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente incluye al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido y que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

o, en cada caso, R^{1a} y R^{1b} junto con el enlace C-C, forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;

o, en cada caso, R^{1b} y R^{1c} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;

o, en cada caso, R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado, no sustituido o al menos monosustituido;

30 R² y R³, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-O-R²²; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-NHR²⁴; -(CH₂)_s-C(=O)-NHR²⁵ con s = 1, 2, 3, 4 ó 5; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido; o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno, forman un grupo heterocicloalifático saturado o insaturado, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo y que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁴ y R¹⁵, independientemente entre sí, representan un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileo lineal o ramificado y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

5 R⁸, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹, independientemente entre sí, representan un grupo hidrógeno; un grupo alifático lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido por un grupo alquileo lineal o ramificado y/o condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

10 M¹ representa un grupo arilo o heteroarilo, que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional y/o que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

15 M² representa un grupo arilo o heteroarilo, que puede estar no sustituido o al menos monosustituido y, en cada caso, puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico, no sustituido o al menos monosustituido;

donde

20 cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d} y R² a R²⁹ representan un grupo alifático saturado o insaturado sustituido una o más veces, preferentemente éste se sustituye con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientes entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, -NO₂, -CN, -OH, -SH y -NH₂;

25 cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ representan un grupo cicloalifático o incluyen un grupo cicloalifático mono o polisustituido, preferentemente éste está sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientes entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-CF₃, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -N(H)alquilo(C₁₋₅), -NO₂, -S-CF₃, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-N(H)alquilo(C₁₋₅) y fenilo; donde los grupos alquilo(C₁₋₅) mencionados pueden ser en cada caso lineales o ramificados y los grupos fenilos pueden estar en cada caso no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi;

30 cuando los grupos cicloalifáticos presentan uno o más heteroátomos como miembros del anillo, éstos tienen preferentemente en cada caso 1, 2 ó 3 heteroátomos como miembro(s) el anillo, los cuales se seleccionan, independientemente, de entre el grupo consistente en nitrógeno, oxígeno y azufre;

35 cuando los sustituyentes R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos como miembros del anillo, forman un grupo heterocicloalifático saturado o insaturado, mono- o polisustituido, preferentemente, éste está sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -SF₅, -OH, -NH₂, -O-CF₃, -SH, -O-alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-CF₃, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-fenilo, oxo (=O), tioxo (=S), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -N(H)alquilo(C₁₋₅), -NO₂, -S-CF₃, -C(=O)-OH, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H; -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-N(H)alquilo(C₁₋₅) y fenilo; pudiendo en cada caso los grupo alquilo(C₁₋₅) ser lineales o ramificados y en cada caso los grupos fenilo estar no sustituidos o sustituidos con 1, 2 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo condistente en F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi;

40 cuando los grupos heterocicloalifáticos presentan uno o más heteroátomos adicionales como miembros del anillo, preferentemente en cada caso 1, 2, 3, 4 ó 5, éstos se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en nitrógeno, oxígeno y azufre;

50 cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² representan un grupo arilo o heteroarilo o incluyen un grupo arilo o heteroarilo, mono- o polisustituido, éste está sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo consistente en halógeno, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)-OH, -(CH₂)-O-alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -CH₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -

NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)₂-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH, -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -Si(fenil)₂[alquilo(C₁₋₅)], pirazolilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi, bencilo y fenetilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3, ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo consistente en F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo, etilo, metoxi y etoxi;

cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² representan un grupo heteroarilo o incluyen un grupo heteroarilo, sus heteroátomos se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

cuando los sustituyentes R^{1a} y R^{1b} ó R^{1b} y R^{1c} ó R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado mono- o polisustituido, éste está sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por halógeno, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, -CH₂-NH₂, -C(=O)-OH, -alquilo(C₁₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -CH₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -Si(fenil)₂[alquilo(C₁₋₅)], pirazolilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo, tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi, bencilo y fenetilo, pudiendo los sustituyentes cíclicos estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CF₃, metilo, etilo, metoxi y etoxi;

cuando esté presente un sistema de anillo policíclico, éste puede ser, en cada caso, saturado, insaturado o aromático y los heteroátomos de cada anillo se seleccionan, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

cuando uno o más de los sustituyentes R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² a R²⁹ y M¹ y M² representan un sistema de anillo mono- o policíclico mono- o polisustituido, éste puede estar sustituido en cada caso con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por halógeno, -CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, oxo (=O), tioxo (=S), -C(=O)-OH, -alquilo(C₁₋₅), -alqueno(C₂₋₅), -alquino(C₂₋₅), -(CH₂)₂-O-alquilo(C₁₋₅), -S-alquilo(C₁₋₅), -O-alquilo(C₁₋₅), -CF₃, -SF₅, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -S(=O)₂-fenilo, -S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -S(=O)-alquilo(C₁₋₅), -NH-alquilo(C₁₋₅), -N(alquilo(C₁₋₅))₂, -CH₂-NH-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-N(alquilo(C₁₋₅))₂, -C(=O)-O-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-H, -C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -CH₂-O-C(=O)-fenilo, -O-C(=O)-fenilo, -NH-S(=O)₂-alquilo(C₁₋₅), -NH-C(=O)-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-alquilo(C₁₋₅), -C(=O)-N(alquilo(C₁₋₅))₂, pirazolilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo, tiofenilo (tienilo), fenoxi y bencilo, donde los sustituyentes cíclicos pueden estar sustituidos en cada caso con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por F, Cl, Br, I, metilo, etilo, metoxi y etoxi;

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

2. Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

A¹ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1b},

A³ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un átomo de nitrógeno o un grupo C-R^{1d};

R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d} representan, independientemente entre sí, en cada caso un grupo hidrógeno, un grupo halógeno; -NO₂; -CN; -NH₂; -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -NH-C(=O)-R⁷; -C(=O)-R⁸, -C(=O)-NH₂; -C(=O)-NHR⁹; -C(=O)-NR¹⁰R¹¹; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2, 3, 4 ó 5; -O-C(=O)-R¹⁴; -(CH₂)_n-O-C(=O)-R¹⁵ con n = 1, 2, 3, 4 ó 5; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2, 3, 4 ó 5; -SR¹⁸; -(CH₂)_p-S(=O)_t-R¹⁹ con p = 1, 2, 3, 4 ó 5 con t = 0, 1 ó 2; -NH-S(=O)₂-R²⁶R²⁷; -S(=O)₂-NR²⁸R²⁹; -SF₅; un grupo alifático(C₁₋₁₀) lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático(C₃₋₈) saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente presenta al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alqueno(C₁₋₅) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido que puede estar unido a través de un grupo alqueno(C₁₋₅) lineal o ramificado;

o, en cada caso, R^{1a} y R^{1b} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;

o, en cada caso, R^{1b} y R^{1c} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;

5 o, en cada caso, R^{1c} y R^{1d} junto con el enlace C-C forman un grupo fenilo fusionado no sustituido o al menos monosustituido;

10 R^2 y R^3 representan, independientemente entre sí, en cada caso un grupo hidrógeno; $-C(=O)-R^{20}$; $-(CH_2)_q-C(=O)-R^{21}$ con $q = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-C(=O)-O-R^{22}$; $-(CH_2)_r-C(=O)-O-R^{23}$ con $r = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; $-C(=O)-NHR^{24}$; $-(CH_2)_s-C(=O)-NHR^{25}$ con $s = 1, 2, 3, 4$ ó 5 ; un grupo alifático(C_{1-10}) lineal o ramificado, saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido; un grupo cicloalifático(C_{4-8}) saturado o insaturado, no sustituido o al menos monosustituido, que opcionalmente presenta al menos un heteroátomo como miembro del anillo y que puede estar unido a través de un grupo alquileno(C_{1-5}) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido que puede estar unido a través de un grupo alquileno(C_{1-5}) lineal o ramificado;

15 o R^2 y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno como miembro del anillo, forman un grupo heterocicloalifático(C_{4-10}) saturado o insaturado, que opcionalmente tiene al menos un heteroátomo adicional como miembro del anillo y que está condensado con un sistema de anillo mono- o policíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los sistemas de anillo tienen 5, 6 o 7 miembros de anillo;

20 $R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{14}$ y R^{15} representan, independientemente entre sí, un grupo alifático(C_{1-4}) lineal o ramificado, saturado o insaturado, o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido a través de un grupo alquileno(C_{1-5}) lineal o ramificado;

25 $R^8, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}, R^{23}, R^{24}, R^{25}, R^{26}, R^{27}, R^{28}$ y R^{29} , representan, independientemente entre sí, un grupo hidrógeno; un grupo alifático(C_{1-4}) lineal o ramificado, saturado o insaturado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede estar unido por un grupo alquileno(C_{1-5}) lineal o ramificado;

M^1 representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede sustituirse con al menos un sustituyente adicional y, opcionalmente, puede condensarse con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los anillos del sistema de anillo tienen 5, 6 ó 7 miembros, respectivamente; y

30 M^2 representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede estar no sustituido o al menos monosustituido y que puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los anillos del sistema de anillos tienen 5, 6 ó 7 miembros;

donde

35 los grupos cicloalifáticos mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

los grupos heterocicloalifáticos mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre;

40 los anillos del sistema de anillo mono- o policíclico pueden presentar en cada caso opcionalmente 0, 1, 2 ó 3 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre; y

45 los grupos heteroarilo mencionados pueden presentar opcionalmente 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, del grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre.

3. Compuestos según la reivindicación 1 ó 2, caracterizados porque:

A^1 representa un grupo $C-R^{1a}$,

A^2 representa un grupo $C-R^{1b}$,

A^3 representa un grupo $C-R^{1c}$,

50 A^4 representa un grupo $C-R^{1d}$;

o bien

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c},

5 A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un átomo de nitrógeno,

A³ representa un grupo C-R^{1c},

10 A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un átomo de nitrógeno,

15 A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c},

20 A⁴ representa un átomo de nitrógeno;

o bien

A¹ y A³ representan cada uno un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

A⁴ representa grupo C-R^{1d}.

25 4. Compuestos según la reivindicación 3, caracterizados porque

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

30 o bien

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

A² representa un grupo C-R^{1b},

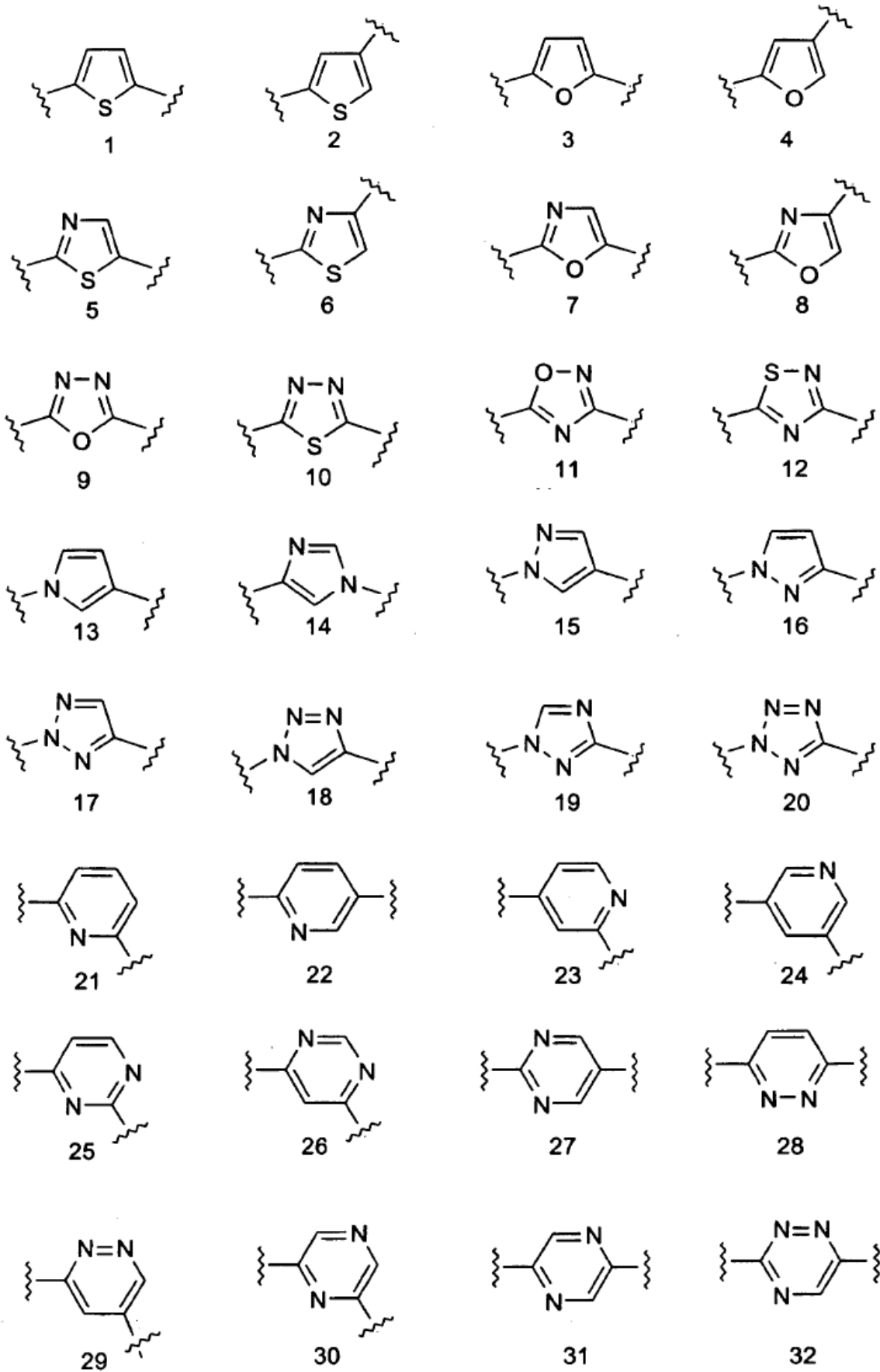
A³ representa un grupo C-R^{1c},

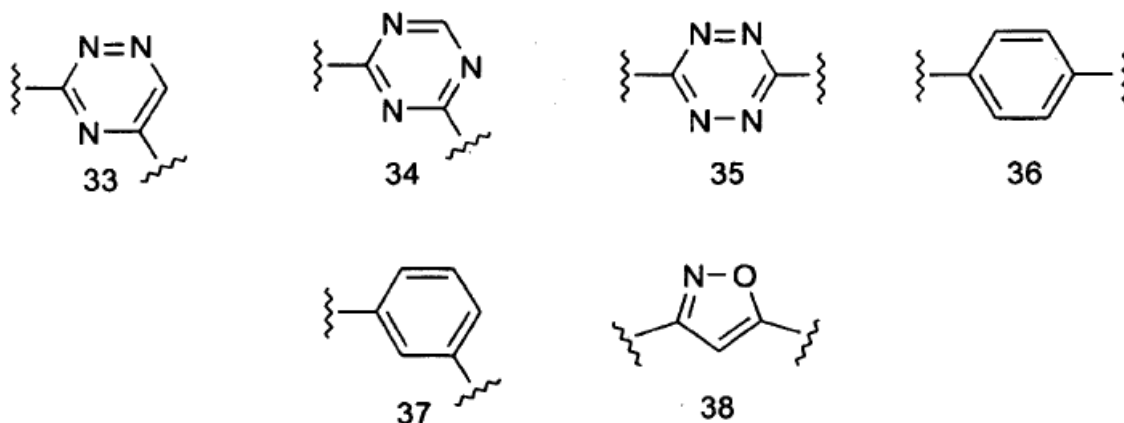
A⁴ representa un grupo C-R^{1d};

35 o bien

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

- A² representa un átomo de nitrógeno,
 A³ representa un grupo C-R^{1c},
 A⁴ representa un grupo C-R^{1d};
 o bien
- 5 A¹ representa un grupo C-R^{1a},
 A² representa un grupo C-R^{1b},
 A³ representa un grupo C-R^{1c},
 A⁴ representa un átomo de nitrógeno.
- 10 5. Compuestos según las reivindicaciones 1 a 4, caracterizados porque R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan en cada caso -H; -F; -Cl, -Br; -I; -NO₂; -CN; -CF₃; -SF₅; -NH₂; -S(=O)-NH₂, -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2 ó 3; -O-C(=O)-R¹⁴; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-O-R¹⁷ con o = 1, 2 ó 3; un grupo alquilo(C₁₋₁₀) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, que se puede unir a través de un grupo alquileo(C₁₋₄) lineal o ramificado.
- 15 6. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizados porque R^{1a} y R^{1b} o R^{1b} y R^{1c} o R^{1c} y R^{1d}, junto con el enlace C-C, forman un grupo fenilo fusionado, que puede estar sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅.
- 20 7. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizados porque R² y R³, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2, 3, 4 ó 5; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2, 3, 4 ó 5; -C(=O)-NHR²⁴; un grupo alquilo(C₁₋₁₆) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C₄₋₈) no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileo(C₁₋₃) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileo(C₁₋₃) lineal o ramificado;
- 25 8. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizados porque R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno como miembro del anillo, forman un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y azocanilo, no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃.
- 30 9. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizados porque R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁴ y R¹⁵, independientemente entre sí, representan un grupo alquilo(C₁₋₄) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros no sustituido o al menos monosustituido, que puede unirse a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado.
- 35 10. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizados porque R⁸, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹, independientemente entre sí, representan un grupo hidrógeno; un grupo alquilo(C₁₋₈) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo de 5 a 14 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, que se puede unir a través de un grupo alquileo(C₁₋₅) lineal o ramificado.
- 40 11. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizados porque M¹ representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, que puede estar sustituido con al menos un sustituyente adicional, donde el grupo heteroarilo presenta 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre.
- 45 12. Compuestos según la reivindicación 11, caracterizados porque M1 representa un grupo seleccionados de entre los grupos 1 a 38





en cada caso unido en cualquier dirección deseada por las posiciones indicadas con la línea ondulada al sistema de anillo bicíclico y al átomo de carbono del triple enlace, y que puede estar sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes adicionales seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NO₂, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -C(=O)-CH₃ y -C(=O)-C₂H₅.

- 5
13. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizados porque M² representa un grupo arilo o heteroarilo de 5 ó 6 miembros, no sustituido o al menos monosustituido, donde el grupo heteroarilo presenta 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre; y donde el grupo arilo o heteroarilo puede estar condensado con un sistema de anillo mono- o bicíclico no sustituido o al menos monosustituido, donde los anillos del sistema de anillo tienen de 5 ó 6 miembros en cada caso y pueden presentar en cada caso 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos como miembros del anillo seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por nitrógeno, oxígeno y azufre.
- 10
14. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizados porque
- 15
- A¹ representa un grupo C-R^{1a},
- A² representa un grupo C-R^{1b},
- A³ representa un grupo C-R^{1c} y
- A⁴ representa un grupo C-R^{1d},
- 20
- o bien
- A¹ representa un átomo de nitrógeno,
- A² representa un grupo C-R^{1b},
- A³ representa un grupo C-R^{1c} y
- A⁴ representa un grupo C-R^{1d},
- 25
- o bien
- A¹ representa un grupo C-R^{1a},
- A² representa un átomo de nitrógeno,
- A³ representa un grupo C-R^{1c} y
- A⁴ representa un grupo C-R^{1d},
- 30
- R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, independientemente entre sí, representan en cada caso -H; -F; -Cl, -Br; -I; -NO₂; -CN; -CF₃; -SF₅; -NH₂; -S(=O)-NH₂, -NHR⁴; -NR⁵R⁶; -C(=O)-OR¹²; -(CH₂)_m-C(=O)-OR¹³ con m = 1, 2 ó 3; -O-C(=O)-R¹⁴; -OR¹⁶; -(CH₂)_o-OR¹⁷ con o = 1, 2 ó 3; un grupo alquilo lineal o ramificado seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo y tert-butilo; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, furanilo, tiofenilo y piridinilo, en cada caso no

sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionado, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

o en cada caso R^{1a} y R^{1b} ó R^{1b} y R^{1c} ó R^{1c} y R^{1d}, junto con el enlace C-C, forman un grupo fenilo fusionado, que puede estar sustituido con 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅;

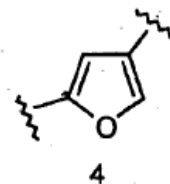
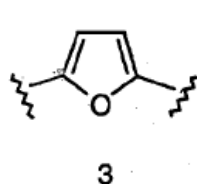
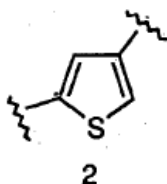
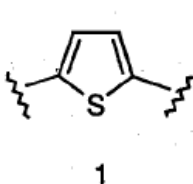
R² y R³, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo hidrógeno; -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1, 2 ó 3; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1, 2 ó 3; un grupo alquilo(C₁₋₁₀) lineal o ramificado; un grupo cicloalquilo(C₄₋₈) no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, opcionalmente unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₃) lineal o ramificado; o un grupo arilo o heteroarilo seleccionado de entre el grupo compuesto por fenilo, tiofenilo, furanilo y piridinilo, no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo alquileo(C₁₋₃) lineal o ramificado;

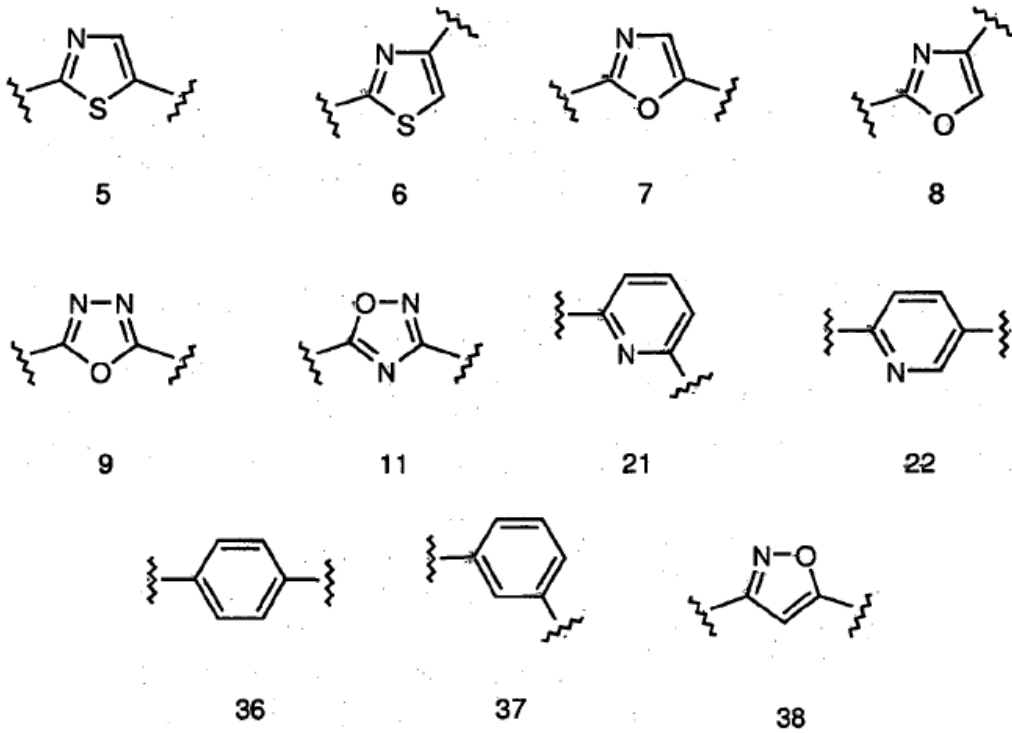
o R² y R³, junto con el átomo de nitrógeno como miembro del anillo, forman un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por imidazolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tiomorfolinilo, azepanilo, diazepanilo y azocanilo, no sustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -O-CF₃, -S-CF₃, -S(=O)-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-C₂H₅, -C(=O)-OH, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃;

R⁴, R⁵, R⁶ y R¹⁴, independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado de entre metilo, etilo, n-propilo e isopropilo; o un grupo fenilo, no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R²⁰, R²¹ y R²³, independientemente entre sí, representan hidrógeno; un grupo alquilo seleccionado de entre el grupo compuesto por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo; o un grupo fenilo no sustituido o sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- ó -(CH₂)₃-;

M¹ representa un grupo seleccionado de entre el grupo compuesto por los grupos 1 a 9, 11, 21, 22 y 36 a 38:

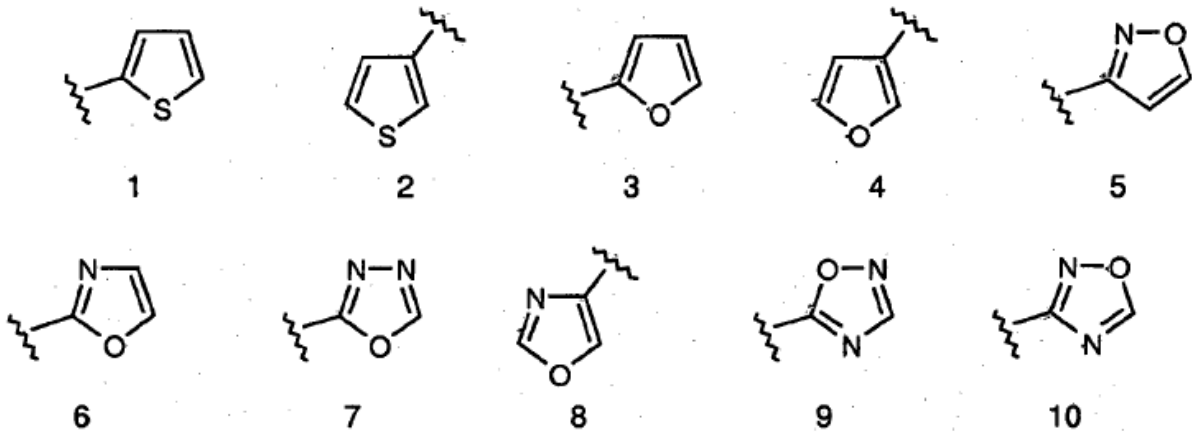


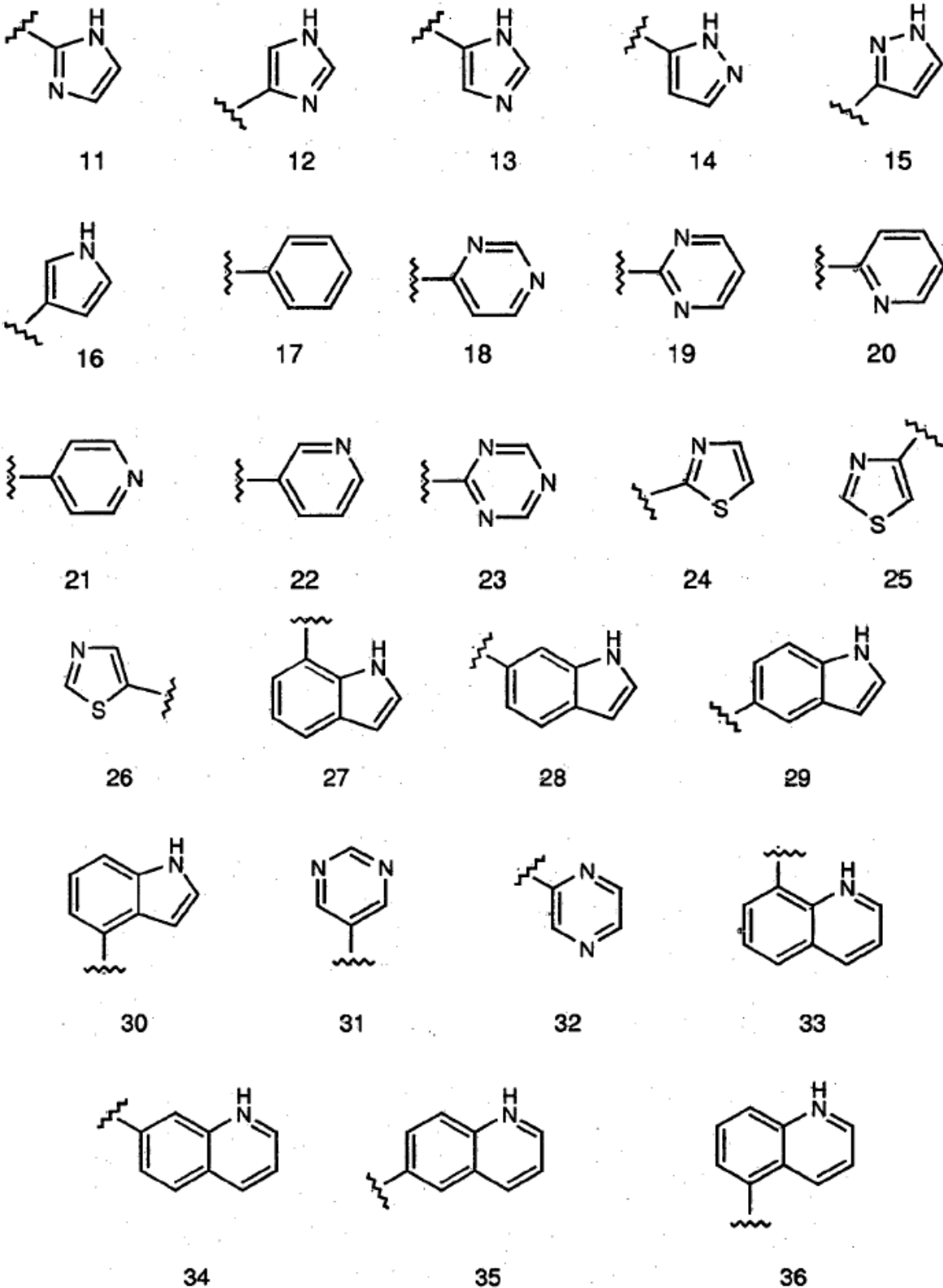


5

que se puede unir según la cualquier dirección deseada con las posiciones indicadas con la línea ondulada al biciclo y al átomo de carbono del triple enlace, y opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CH, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-CF₃; y

M² representa un grupo seleccionado de entre los grupos 1 a 36





en cada caso unido según la posición mostrada con la línea ondulada con el biciclo y el átomo de carbono del triple enlace, no sustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2 ó 3 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de entre el grupo compuesto por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -O-CF₃, -C(=O)-H, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -

Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], -NO₂, NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -S(=O)₂-N(CH₃)₂, -NH-S(=O)₂-OH y -NH-C(=NH)-NH₂;

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

15. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizados porque

10 A¹ representa un grupo C-R^{1a},

A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

o

A¹ representa un átomo de nitrógeno,

15 A² representa un grupo C-R^{1b},

A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

o

A¹ representa un grupo C-R^{1a},

20 A² representa un átomo de nitrógeno,

A³ representa un grupo C-R^{1c},

A⁴ representa un grupo C-R^{1d},

25 R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, en cada caso independientemente entre sí, representan hidrógeno, -OR¹⁶; -F; -Cl, -Br; -CF₃, -CN; -S(=O)₂-NH₂; -C(=O)-OR¹², un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo y tert-butilo; un grupo fenilo; un grupo bencilo; un grupo fenetilo o un grupo (3-fenil)prop-1-ilo;

o en cada caso R^{1a} y R^{1b} forman un grupo fenilo fusionado y no sustituido junto con el enlace C-C al cual se unen;

30 o en cada caso R^{1c} y R^{1d} forman un grupo fenilo fusionado y no sustituido junto con el enlace C-C al cual se unen;

35 R² y R³, independientemente entre sí, en cada caso representan hidrógeno, -C(=O)-R²⁰; -(CH₂)_q-C(=O)-R²¹ con q = 1; -(CH₂)_r-C(=O)-O-R²³ con r = 1; un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, tert-butilo, sec-butilo, isobutilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, 1,1,3,3-tetrametilbutilo; 1,1-dimetilpentilo y 1,2-dimetilbutilo; un grupo ciclohexilo o ciclopentilo no sustituido, en cada caso unido a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂- o -(CH₂)₃; o un grupo fenilo, piridinilo, tiofenilo o furanilo; en cada caso no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, isobutilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y unido opcionalmente a través de un grupo -(CH₂)-, -(CH₂)₂-, -(CH(CH₃))- o -(CH₂)₃,

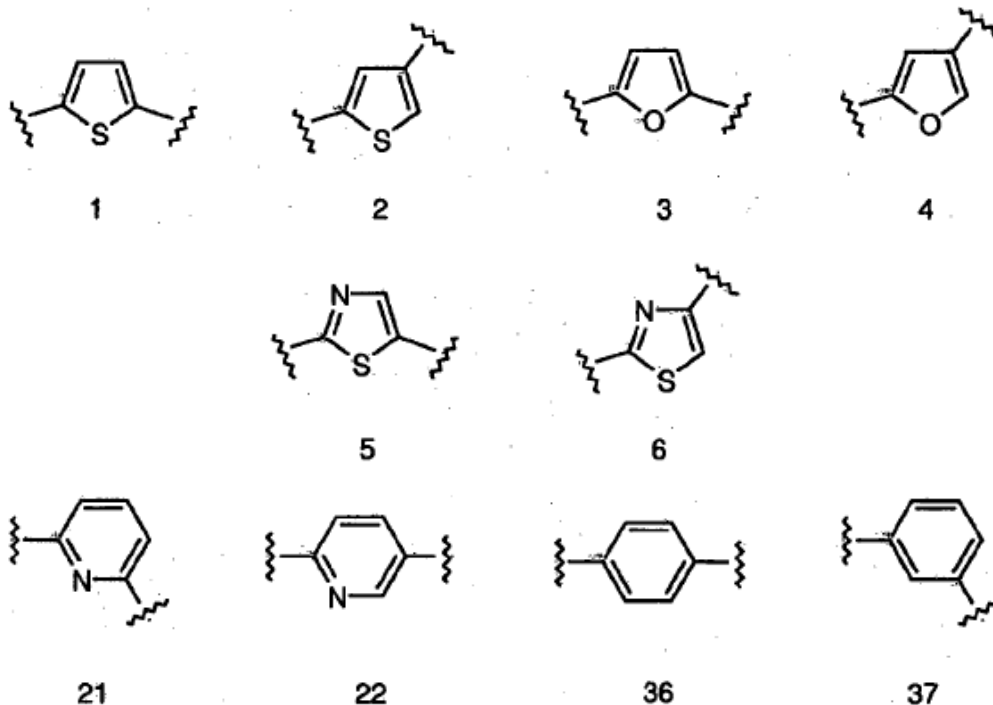
40 o R² y R³ junto con el átomo de nitrógeno al que se unen, como miembro del anillo, forman un grupo heterocicloalifático seleccionado del grupo formado por pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo y morfolinilo,

R¹² representa hidrógeno o un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo;

45 R¹⁶, R²⁰, R²¹ y R²³, en cada caso independientemente entre sí, representan un grupo alquilo seleccionado del grupo formado por metilo, etilo, n-propilo, isopropilo y tert-butilo, o un grupo fenilo que, en v_icada caso, está no

sustituido o sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, metilo, etilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅, y, opcionalmente unido a través de un grupo -(CH₂),

M¹ representa un grupo seleccionado del grupo formado por los grupos 1 a 6, 21, 22, 36 y 37:

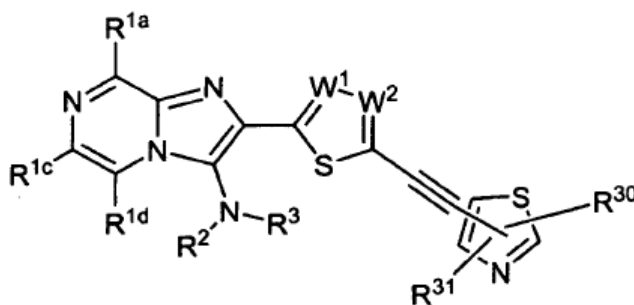


donde dicho grupo puede estar unido en cualquier dirección deseada vía las posiciones indicadas por una línea ondulada al sistema de anillo bicíclico y al átomo de carbono del triple enlace y que está opcionalmente está sustituido con 1 ó 2 sustituyentes adicionales, que se pueden seleccionar, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CH₂-CN, -CF₃, -SF₅, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, tert-butilo, -O-CH₃ y -O-CF₃, y

M² representa un grupo seleccionado del grupo formado por fenilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 4-indolilo, 5-indolilo, 6-indolilo, 7-indolilo, 2-tiofenilo, 3-tiofenilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 5-quinolinilo, 6-quinolinilo, 7-quinolinilo y 8-quinolinilo, donde el grupo correspondiente está no sustituido u opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, del grupo formado por F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH; -S(=O)₂-N(CH₃)₂.

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

16. Compuestos de fórmula general Id según la reivindicación 15,



Id,

donde

en cada caso, R^{1a} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

W^1 representa C y W^2 representa C,

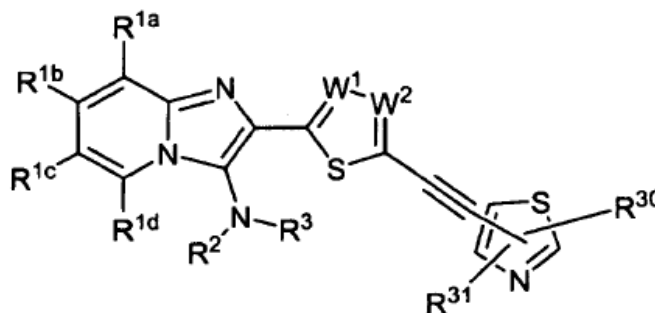
5 o W^1 representa C y W^2 representa N,

o W^1 representa N y W^2 representa C, y

10 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

17. Compuestos de la fórmula general le según la reivindicación 15,



le,

donde

en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

W^1 representa C y W^2 representa C,

o W^1 representa C y W^2 representa N,

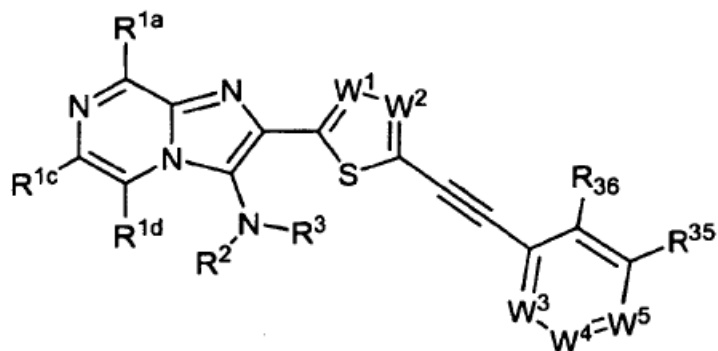
20 o W^1 representa N y W^2 representa C, y

R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -

O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

5 en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

18. Compuestos de fórmula general If según la reivindicación 15



If

donde

en cada caso R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

10 W¹ representa C y W² representa C,

o W¹ representa C y W² representa N,

o W¹ representa N y W² representa C,

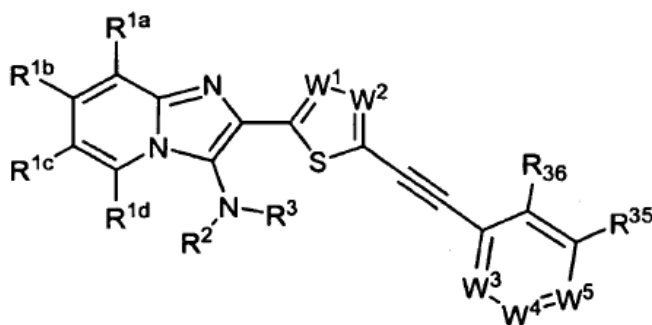
W³ representa C-R³², W⁴ representa C-R³³ y W⁵ representa C-R³⁴;

15 o uno de los grupos W³, W⁴ y W⁵ representa N y los otros dos grupos W³, W⁴ y W⁵ se seleccionan del grupo formado por C-R³² o C-R³³; y

20 R³², R³³, R³⁴, R³⁵ y R³⁶, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

19. Compuestos de fórmula general Ig según la reivindicación 15



Ig

donde

en cada caso R^{1a}, R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

W¹ representa C y W² representa C,

o W¹ representa C y W² representa N,

5 o W¹ representa N y W² representa C,

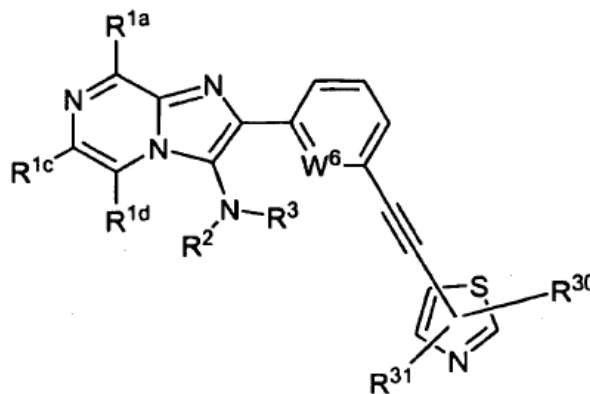
W³ representa C-R³², W⁴ representa C-R³³ y W⁵ representa C-R³⁴;

o uno de los grupos W³, W⁴ y W⁵ representa N y los otros dos grupos W³, W⁴ y W⁵ se seleccionan del grupo formado por C-R³² o C-R³³, y

10 R³², R³³, R³⁴, R³⁵ y R³⁶, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

15 en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

20. Compuestos de fórmula general lh según la reivindicación 15



lh,

donde

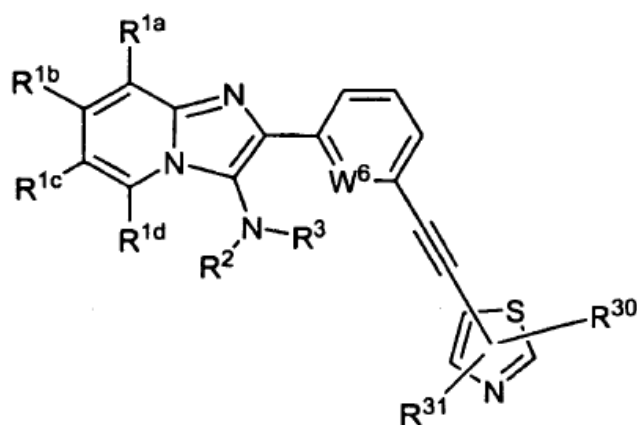
en cada caso R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R² y R³ tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

20 W⁶ representa C o N; y

25 R³⁰ y R³¹, independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

21. Compuestos de fórmula general lk según la reivindicación 15



Ik,

donde

en cada caso R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

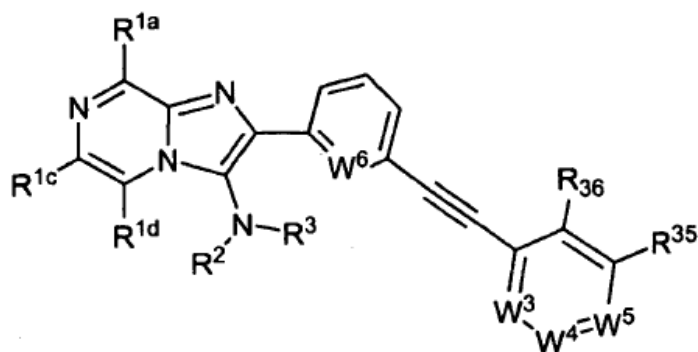
W^6 representa C o N; y

5 R^{30} y R^{31} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

10

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

22. Compuestos de fórmula general Im según la reivindicación 15



Im

donde

15 en cada caso R^{1a} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen el significado que se indica en la reivindicación 15;

W^6 representa C o N,

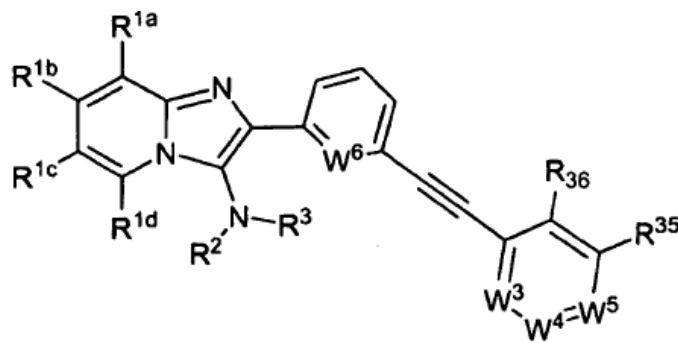
W^3 representa C-R³²; W^4 representa C-R³³ y W^5 representa C-R³⁴;

o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos W^3 , W^4 y W^5 se seleccionan del grupo formado por C-R³² o C-R³³; y

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

23. Compuestos de fórmula general In según la reivindicación 15



In

10 donde

en cada caso, R^{1a} , R^{1b} , R^{1c} , R^{1d} , R^2 y R^3 tienen los significados indicados en la reivindicación 15;

W^6 representa C o N,

W^3 representa C- R^{32} ; W^4 representa C- R^{33} y W^5 representa C- R^{34} ;

15 o uno de los grupos W^3 , W^4 y W^5 representa N y los otros dos grupos W^3 , W^4 y W^5 se seleccionan del grupo formado por C- R^{32} o C- R^{33} ; y

20 R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} , independientemente entre sí, representan en cada caso un grupo seleccionado del grupo formado por H, F, Cl, Br, -CN, -CF₃, -SF₅, -S-CH₃, -S-C₂H₅, metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, etenilo, propenilo, -OH, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -NH₂, -N(CH₃)₂, -NH-CH₃, -CH₂-NH₂, -NO₂, -O-CF₃, -C(=O)-H; -C(=O)-OCH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, fenilo, pirrolilo, 1,3-dioxolanilo, -Si(fenil)₂[C(CH₃)₃], NH-S(=O)₂-CH₃, -NH-S(=O)₂-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -S(=O)₂-NH-CH₃, -CH₂-OH, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-OH, -CH₂-O-CH₃, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=NH)-NH₂, -NH-S(=O)₂-OH y -S(=O)₂-N(CH₃)₂,

en cada caso opcionalmente en la forma de su sal correspondiente o de su correspondiente solvato.

24. Compuestos según una o más de las reivindicaciones 1 a 23, caracterizados porque se seleccionan del grupo formado por:

- 25 [1] ciclopentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
 [2] ciclohexilmetil-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [3] ciclohexilmetil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [4] ciclohexilmetil-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [5] ciclohexilmetil-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 30 [6] ciclohexilmetil-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
 [7] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]ciclohexilmetil-amina,
 [8] ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,

- [9] ciclohexilmetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
- [10] (4-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [11] (4-metoxibencil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [12] (4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- 5 [13] (4-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [14] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina,
- [15] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-metoxibencil)-amina,
- [16] (4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [17] (4-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- 10 [18] tert-butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [19] tert-butil-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [20] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina,
- [21] (3-metoxibencil)-[5-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [22] (3-metoxibencil)-[8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- 15 [23] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina,
- [24] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxibencil)-amina,
- [25] (3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [26] (3-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [27] [6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- 20 [28] [7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- [29] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- [30] [8-benciloxi-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- [31] (1-feniletil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [32] (2-clorobencil)-[5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- 25 [33] (3-cloro-4-fluorofenil)-[7-fenil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [34] (4-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
- [35] [8-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- [36] [7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-(1-feniletil)-amina,
- [37] (2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- 30 [38] (2-metoxibencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [39] (2-clorobencil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [40] (2-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
- [41] (3-metoxifenil)-[6-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [42] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-metoxifenil)-amina,
- 35 [43] (3-metoxifenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [44] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-metoxibencil)-amina,

- [45] (2-clorobencil)-[7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [46] [7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-cloro-4-fluorofenil)-amina,
- [47] (3-metoxibencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-il]-amina,
- [48] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina,
- 5 [49] [7-tert-butil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(2-fluorofenil)-amina,
- [50] (2,4-difluorofenil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)-7-(3-fenilpropil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [51] (4-fluorobencil)-[7-metil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [52] [5,7-dimetil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(4-fluorobencil)-amina,
- [53] [7-etil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina,
- 10 [54] [7-isopropil-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(3-trifluorometil-bencil)-amina,
- [55] tert-butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [56] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [57] butil-[2-(4-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [59] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- 15 [60] [2-(5-piridiniltiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [61] [2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [62] [6-cloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [63] [6,8-dicloro-2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- [64] [2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametilbutil)-amina,
- 20 [65] dimetil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [66] metil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [67] N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]acetamida,
- [68] etil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [69] propil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- 25 [70] butil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [71] (2-metilpropil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [72] pentil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [73] {(metoxicarbonilmetil)-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amino}acetato de metilo,
- [74] bencil-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- 30 [75] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamino]acetato de metilo,
- [76] tert-butil-[2-(5-piridin-4-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [77] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [78] N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-benzamida,
- [79] [2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-bis-piridin-3-ilmetil-amina,
- 35 [80] 2,2-dimetil-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]propionamida,
- [81] 3-metoxi-N-[2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]benzamida,

- [82] tert-butil-[2-(5-piridin-3-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-il]-amina,
- [83] 2-(5-feniletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-ilamina,
- [84] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo,
- [85] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
- 5 [86] 2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [87] N-ciclohexil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [88] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(piperidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina,
- [89] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [90] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(2,4,4-trimetilpentan-2-ilamino)imidazo[1,2-a]piridin-6-carboxilato de metilo,
- 10 [91] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [92] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [93] N,N-dietil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [94] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [95] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- 15 [96] 8-bromo-N-tert-butil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [97] N-tert-butil-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [98] N-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [99] 2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-3-(pirrolidin-1-il)imidazo[1,2-a]pirazina, clorhidrato,
- [100] N-tert-butil-2-(5-((4-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 20 [101] N-tert-butil-7-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [102] N-tert-butil-5-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [103] 8-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [104] N-tert-butil-2-(5-((3-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [105] N-tert-butil-2-(5-((2-fluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 25 [106] 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxilato de metilo,
- [107] N-tert-butil-2-(5-(pirazin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [108] 2-(5-((4-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [109] N-isopropil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [110] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- 30 [111] N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [112] N-tert-butil-2-(5-((2-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [113] N-tert-butil-2-(5-((3-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [114] N-tert-butil-2-(5-((4-metoxifenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
- [115] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]quinolin-1-amina,
- 35 [116] N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [117] N-tert-butil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,

- [118] N-tert-butil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [119] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [120] ácido 3-(tert-butilamino)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-8-carboxílico,
 [121] 4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol, clorhidrato,
 5 [122] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol,
 [123] 2-(5-((3-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [124] 2-(5-((2-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [125] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[2,1-a]isoquinolin-3-amina,
 [126] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 10 [127] N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [128] 2-(5-((6-aminopiridin-3-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [129] N-tert-butil-2-(5-(pirimidin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [130] N-tert-butil-2-(5-((4-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [131] N-tert-butil-2-(5-((5-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 15 [132] N-tert-butil-2-(5-(piridin-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [133] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [134] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [135] N-tert-butil-2-(5-((5-metiltiofen-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [136] 2-(5-((6-aminopiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 20 [137] N-tert-butil-2-(5-((3-metiltiofen-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [138] N-tert-butil-2-(4-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [139] N-tert-butil-2-(5-(m-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [140] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-benzonitrilo, clorhidrato,
 [141] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 25 [142] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [143] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [144] 4-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-benzonitrilo, clorhidrato,
 [145] 2-(5-((1H-indol-6-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [146] N-tert-butil-2-(2-(feniletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 30 [147] N-tert-butil-2-(5-(quinolin-6-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina clorhidrato,
 [148] 2-(5-((3-(1H-pirrol-1-il)fenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [149] 2-(5-((1H-indol-4-il)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [150] N-tert-butil-2-(5-((3-nitrofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [151] N-tert-butil-2-(5-((4-nitrofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 35 [152] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-4-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [153] 2-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenol,

- [154] 2-(5-((3-(aminometil)fenil)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [155] 2-(5-(bifenil-3-iletinil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [156] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [157] N-tert-butil-2-(5-((3-(dimetilamino)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 5 [158] N-tert-butil-2-(5-((6-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [159] N-tert-butil-2-(5-((3-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [160] N-tert-butil-2-(5-((3-(metilamino)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [161] N-tert-butil-2-(5-(p-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [162] N-tert-butil-2-(5-(o-toliletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 10 [163] N-tert-butil-2-(4-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [164] N-tert-butil-2-(4-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [165] N-tert-butil-2-(5-((6-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [166] N-tert-butil-2-(5-((2-nitrofenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [167] N-tert-butil-8-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 15 [168] N-tert-butil-2-(5-((6-metoxipiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [169] N-tert-butil-2-(5-((5-fluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [170] 2-(4-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)-2-(feniletinil)fenil)-acetonitrilo,
 [171] N-tert-butil-2-(5-((5-metoxipiridin-3-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [172] 5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-nicotinonitrilo, clorhidrato,
 20 [173] N-tert-butil-2-(5-((3-(metiltio)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [174] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)benzoato de metilo,
 [175] N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluoropiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [176] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [177] N-tert-butil-2-(2-(piridin-4-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 25 [178] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzaldehído,
 [179] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]pirazin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-4-fluorobenzonitrilo,
 [180] N-tert-butil-2-(5-((3-(trifluorometil)fenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [181] N-tert-butil-2-(2-(piridin-2-iletinil)tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [182] N-tert-butil-2-(3-metil-5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 30 [183] N-tert-butil-2-(3-metil-5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [184] N-tert-butil-2-(5-((3-vinilfenil)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [185] 2-(5-((1H-imidazol-4-il)etnil)tiofen-2-il)-N-tert-butylimidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [186] N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [187] N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 35 [188] N-tert-butil-2-(5-((2-(tert-butildifenilsilil)tiazol-5-il)etnil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [189] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etnil)-benzonitrilo,

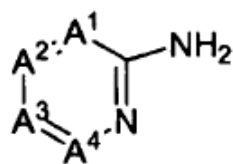
- [190] N-tert-butil-2-(5-(feniletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [191] N-tert-butil-2-(5-(tiazol-5-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [192] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [193] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 5 [194] 5,7-dimetil-N-fenetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [195] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [196] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [197] N-(3-metoxifenetil)-5,7-dimetil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [198] N-(4-clorobencil)-8-metil-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [199] N-(3-metoxifenetil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [200] N-(2-metilhexan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [201] N-fenetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [202] N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [203] 2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 15 [204] N-(4-clorobencil)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [205] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [206] N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [207] N-(2-metoxibencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [208] N-(ciclohexilmetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 20 [209] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [210] 8-bromo-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [211] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [212] N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [213] N-(1-feniletil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 25 [214] N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [215] 8-bromo-N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [216] N-ciclopentil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [217] N-(3-metoxifenetil)-7-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [218] 8-(benciloxi)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 30 [219] 8-(benciloxi)-N-ciclopentil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [220] 8-(benciloxi)-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [221] 6-cloro-N-(4-fluorobencil)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [222] 6-bromo-N-butil-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [223] N-(furan-2-il)-8-metil-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 35 [224] N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [225] N-(furan-2-il)-2-(5-(feniletinil)furan-2-il)-7-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [226] 5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(3-(trifluorometil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [227] 6-bromo-N-(4-clorofenetil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [228] N-(4-clorofenetil)-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [229] N-fenetil-7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 5 [230] N-(4-clorobencil)-5,7-dimetil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [231] 6-bromo-N-(4-clorobencil)-5-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [232] 8-bromo-N-(4-clorobencil)-6-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [233] N-(3-metoxifenetil)-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-5-propilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [234] 6-bromo-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [235] 7-fenil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)-N-(2-(tiofen-2-il)etil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [236] 6,8-dibromo-N-(2-metilpentan-2-il)-2-(5-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [237] 6-bromo-N-(2,6-dimetilfenil)-8-metil-2-(4-(feniletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [238] N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [239] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 15 [240] N-ciclopentil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [241] 8-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)-6-(trifluorometil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [242] N-(4-fluorofenil)-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [243] N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [244] N-ciclohexil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 20 [245] N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [246] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [247] N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [248] 2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [249] N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 25 [250] 8-bromo-N-ciclopentil-6-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [251] N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [252] N-(4-fluorofenil)-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
 [253] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [254] N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 30 [255] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [256] 2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [257] N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [258] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [259] N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 35 [260] N-ciclopentil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [261] N-tert-butil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [262] 2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [263] N-(4-fluorofenil)-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [264] N-tert-butil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [265] N-ciclopentil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 5 [266] N-(4-fluorofenil)-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [267] N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [268] N-tert-butil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [269] N-ciclohexil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [270] 6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [271] 6-metil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [272] N-ciclopentil-6-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [273] N-ciclohexil-6-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [274] N-ciclohexil-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [275] 7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 15 [276] N-tert-butil-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [277] N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [278] N-tert-butil-7-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [279] N-(4-fluorofenil)-7-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [280] N-ciclohexil-8-metil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 20 [281] N-ciclopentil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [282] N-tert-butil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [283] N-ciclohexil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [284] 2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [285] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 25 [286] N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [287] N-(4-fluorofenil)-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [288] N-ciclohexil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [289] 2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [290] N-tert-butil-5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 30 [291] 5-metil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [292] N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [293] N-ciclohexil-5,7-dimetil-2-(2-metil-6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [294] N-ciclopentil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 [295] N-tert-butil-5,7-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]pirimidin-3-amina,
 35 [296] N-(4-fluorofenil)-8-metil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [297] N-ciclohexil-8-metil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,

- [298] N-ciclohexil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [299] 7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [300] N-ciclohexil-7-etil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [301] N-ciclopentil-7-etil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 5 [302] N-ciclopentil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [303] N-tert-butil-7-etil-2-(6-(feniletinil)piridin-3-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [304] N-tert-butil-7-etil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [305] 7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [306] N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 10 [307] N-tert-butil-7-isopropil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [308] N-ciclohexil-7-isopropil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [309] N-tert-butil-7-isopropil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [310] 6-cloro-N-ciclopentil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [311] N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 15 [312] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [313] 6-cloro-2-(3-(piridin-2-iletinil)fenil)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [314] N-tert-butil-6-cloro-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [315] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(4-(piridin-2-iletinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [316] N-tert-butil-6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- 20 [317] 6-cloro-N-ciclohexil-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [318] 6-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)furan-2-il)-N-(2,4,4-trimetilpentan-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [319] 6-cloro-N-ciclopentil-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [320] N-tert-butil-6-cloro-2-(3-((6-metilpiridin-2-il)etinil)fenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
- [321] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato,
- 25 [322] N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina,
- [323] N-tert-butil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, diclorhidrato,
- [324] [2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-(1,1,3,3-tetrametil-butil)-amina,
- [325] tert-butil-[2-(5-pirimidin-2-iletinil-tiofen-2-il)-imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato,
- [326] {2-[5-(3-aminopiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-tert-butil-amina,
- 30 [327] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [328] tert-butil-[2-(2-piridin-2-iletinil-tiazol-5-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina,
- [329] tert-butil-{2-[5-(6-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
- [330] tert-butil-{2-[5-(3-cloro-5-fluorofeniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
- [331] tert-butil-[2-(5-piridin-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-3-il]-amina, clorhidrato,
- 35 [332] tert-butil-[2-(5-tiazol-2-iletinil-tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]-amina, clorhidrato,
- [333] tert-butil-{2-[5-(3-trifluorometoxi-feniletinil)tiofen-2-il]imidazo[1,2-a]pirazin-3-il}-amina,

- [334] tert-butil-{2-[5-(3-[1,3]dioxolan-2-il-feniletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina,
 [335] tert-butil-{2-[5-(3,5-dimetil-feniletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [336] tert-butil-{2-[5-(3-fluoropiridin-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [337] tert-butil-{2-[5-(3-metil-3H-imidazol-4-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 5 [338] tert-butil-{2-[5-(5-clorotiofen-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [339] tert-butil-{2-[5-(5-metil-piridin-2-iletinil)tiofen-2-il]-imidazo[1,2-a]piridin-3-il}-amina, clorhidrato,
 [340] 1-{3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}-etanona, clorhidrato,
 [341] {3-[5-(3-tert-butilamino-imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-iletinil]fenil}-metanol, clorhidrato,
 [342] N-tert-butil-2-(5-((3-metoxipiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 10 [343] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [344] 5-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-2-fluorobenzonitrilo, clorhidrato,
 [345] N-tert-butil-2-(5-((3,4-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [346] N-tert-butil-2-(5-((3-(metoximetil)fenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [347] 2-(5-((3-aminofenil)etinil)tiofen-2-il)-N-tert-butilimidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 15 [348] N-tert-butil-2-(5-((4-fluoro-3-metilfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [349] N-tert-butil-2-(5-((3,5-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [350] N-tert-butil-2-(5-(tiofen-3-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [351] N-tert-butil-2-(5-((3-metilpiridin-2-il)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, clorhidrato,
 [352] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzenosulfonamida, clorhidrato,
 20 [353] ácido 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)-benzoico,
 [354] 3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)benzamida, clorhidrato,
 [355] N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)-acetamida,
 [356] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [357] N,N-dimetil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 25 [358] N-tert-butil-N-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiazol-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [359] (6-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)piridin-2-il)metanol,
 [360] N-(3-((5-(3-(tert-butilamino)imidazo[1,2-a]piridin-2-il)tiofen-2-il)etinil)fenil)-metanosulfonamida,
 [361] N-tert-butil-8-metil-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]pirazin-3-amina, clorhidrato,
 [362] 2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 30 [363] N-tert-butil-2-(5-((3-clorfenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 [364] N-tert-butil-2-(5-((2,3-difluorofenil)etinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina, y
 [365] N-tert-butil-7-cloro-2-(5-(piridin-2-iletinil)tiofen-2-il)imidazo[1,2-a]piridin-3-amina,
 y en cada caso sus sales correspondientes, en especial sus clorhidratos y, en cada caso sus correspondientes solvatos.
- 35 **25.** Procedimiento para la preparación de los compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos bicíclicos de fórmula general I según una o más de las reivindicaciones 1 a 24, caracterizado porque se hace reaccionar al menos un compuesto de fórmula general II



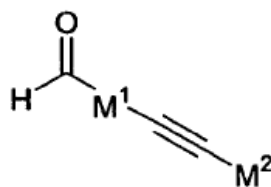
II,

donde A¹, A², A³ y A⁴ tienen los significados descritos en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico o al menos en presencia de una sal de metal de transición, con al menos un isocianuro de fórmula general III

5



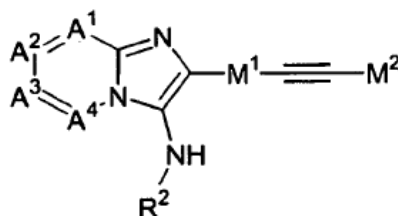
donde R² tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, y con al menos un aldehído de fórmula general IV



IV,

10

donde M¹ y M² tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24; y el compuesto obtenido de la fórmula general V

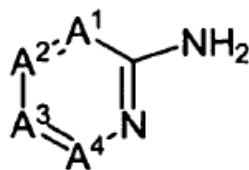


V,

donde A¹, A², A³, A⁴, R², M¹ y M² tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en la sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o aísla,

15

o se hace reaccionar al menos un compuesto de fórmula general II

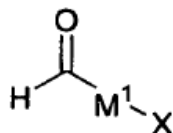


II,

donde A¹, A², A³ y A⁴ tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico o al menos en presencia de una sal de metal de transición, con al menos un isocianuro de fórmula general III

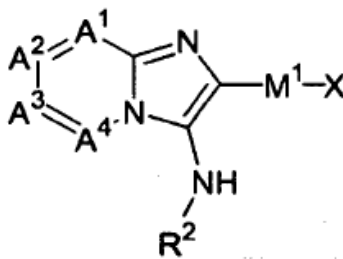


5 donde R² tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, y con al menos un aldehído de fórmula general VI



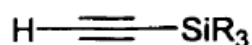
VI,

donde M¹ tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, y el compuesto obtenido de fórmula general VII



VII,

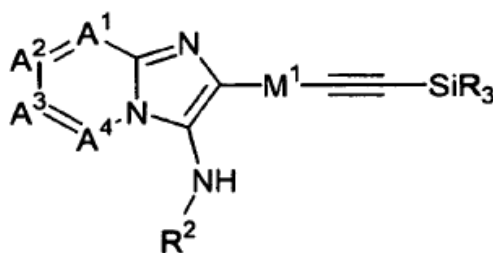
10 donde A¹, A², A³, A⁴, R², M¹ y X tienen los significados indicados anteriormente, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en la sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o aísla, y por reacción con al menos un acetileno de fórmula general XI



XI,

15 donde R, independientemente entre sí, en cada caso representa un grupo alquilo lineal o ramificado o un grupo fenilo no sustituido,

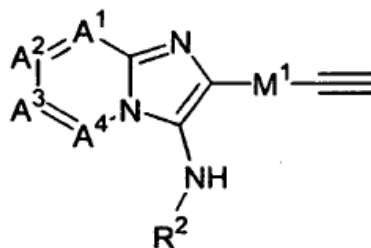
se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado y opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general XII



XII,

5 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 y M^1 tienen los significados indicados anteriormente y R , independientemente entre sí, en cada caso representa un grupo alquilo lineal o ramificado o un grupo fenilo no sustituido y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

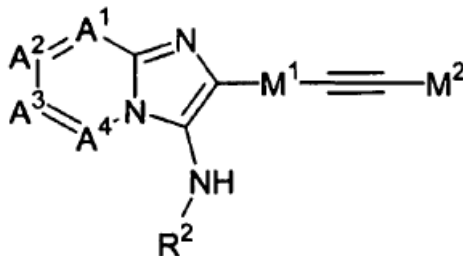
y al menos un compuesto de fórmula general XII se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, opcionalmente en presencia de al menos una sal inorgánica y, opcionalmente, en presencia de al menos una sal de amonio, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general XIII



XIII,

10 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 y M^1 tienen los significados indicados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

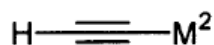
15 y al menos un compuesto de fórmula general XIII y/o al menos un compuesto de fórmula general XII, por reacción con al menos un compuesto de fórmula general M^2-X , donde M^2 tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, se transforman en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, opcionalmente en presencia de al menos una sal inorgánica y, opcionalmente, en presencia de al menos una sal de amonio, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general V



V,

20 donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

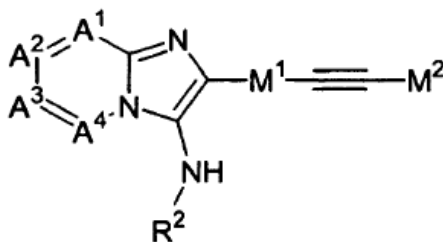
o un compuesto de fórmula general VII, por reacción con al menos un acetileno de fórmula general VIII



VIII,

donde M^2 tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, se transforma en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un catalizador adecuado y opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica, en un compuesto correspondientemente sustituido de fórmula general V

5



V,

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados anteriormente y, opcionalmente, este compuesto se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una sal correspondiente y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla,

10

y, opcionalmente, el compuesto de fórmula general V, por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $\text{R}^3\text{-X}$, donde R^3 tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica,

15

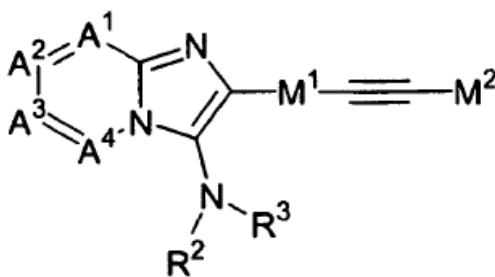
o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-C(=O)-OH}$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica,

20

o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-C(=O)-X}$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica y/o inorgánica,

o por reacción con al menos un compuesto de fórmula general $\text{R}^{20}\text{-C(=O)-H}$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor,

se transforma en un compuesto de fórmula general I, opcionalmente en forma de una sal correspondiente



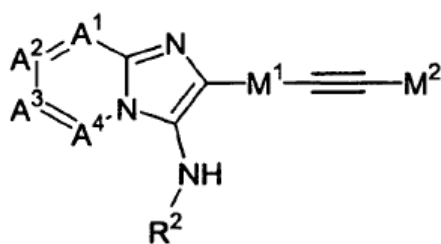
I,

25

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y, opcionalmente, dicho compuesto se purifica y/o aísla.

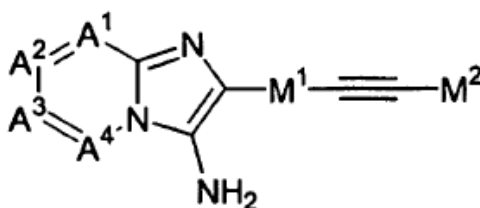
26.

Procedimiento para la preparación de compuestos imidazo-3-il-amina sustituidos bicíclicos de fórmula general I según una o más de las reivindicaciones 1 a 24, caracterizado porque al menos un compuesto de fórmula general V



V,

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, se hace reaccionar, opcionalmente en un medio de reacción en presencia de al menos un ácido orgánico o inorgánico, y el compuesto obtenido de fórmula general IX



IX,

5

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, opcionalmente se purifica y/o se aísla y, opcionalmente, se transforma en una correspondiente sal y ésta, opcionalmente, se purifica y/o se aísla y

10

se hace reaccionar en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, con al menos un compuesto de fórmula general R^3-X , donde R^3 tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, o

15

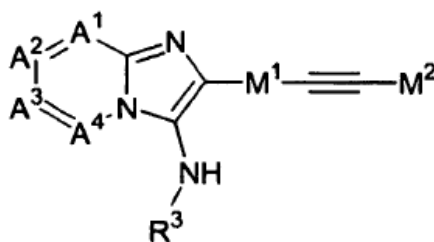
se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica y/u opcionalmente en presencia de al menos un medio de acoplamiento, con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-OH$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, o

20

se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-X$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, o

se hace reaccionar en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor, con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-H$, donde R^{20} tiene el significado indicado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24,

y se transforma en el compuesto correspondiente de fórmula general X, opcionalmente en la forma de su correspondiente sal,



X,

donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y este compuesto, opcionalmente, se purifica y/o aísla,

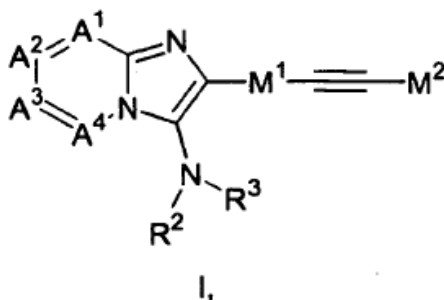
y, opcionalmente, el compuesto de fórmula general X se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general R^2-X , donde R^2 tiene el significado señalado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, en un medio de reacción, en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, u

opcionalmente, el compuesto de fórmula general X se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-OH$, donde R^{20} tiene el significado señalado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica y/o en presencia de al menos un medio de acoplamiento, o

el compuesto de fórmula general X se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-X$, donde R^{20} tiene el significado señalado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y X representa un grupo saliente, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos una base orgánica o inorgánica, o

el compuesto de fórmula general X se hace reaccionar con al menos un compuesto de fórmula general $R^{20}-C(=O)-H$, donde R^{20} tiene el significado señalado en una o más de las reivindicaciones 1 a 24, en un medio de reacción, opcionalmente en presencia de al menos un agente reductor,

y se transforma en el compuesto de fórmula general I, opcionalmente en forma de una correspondiente sal,



donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , R^3 , M^1 y M^2 tienen los significados indicados en una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y este compuesto, opcionalmente, se purifica y/o aísla.

27. Composición farmacéutica caracterizada porque comprende al menos un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 24 y opcionalmente una o más sustancias auxiliares fisiológicamente tolerables.

28. Composición farmacéutica según la reivindicación 27 para la profilaxis y/o el tratamiento de trastornos y/o enfermedades que son mediadas, al menos parcialmente, por el receptor mGluR5.

29. Composición farmacéutica según la reivindicación 27 ó 28, para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente de dolor seleccionado de entre el grupo formado por dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral.

30. Composición farmacéutica según la reivindicación 27 ó 28, para el tratamiento y/o la profilaxis de la migraña; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, particularmente seleccionadas del grupo formado por la enfermedad de Parkinson, la enfermedad de Alzheimer, la enfermedad de Huntington y la esclerosis múltiple; enfermedades cognitivas, preferentemente condiciones de déficit cognitivo, en particular el síndrome de déficit de atención (ADS); ataques de pánico; epilepsia, tos, incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemia cerebral; espasmos musculares; calambres; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados del grupo formado por bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; abuso de alcohol y/o drogas (especialmente abuso de nicotina y/o cocaína) y/o abuso de medicamentos; dependencia del alcohol y/o drogas (especialmente dependencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos, para la profilaxis y/o la reducción de trastornos asociados a la abstinencia de alcohol y/o drogas (especialmente abstinencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos; desarrollo de tolerancia a medicamentos, especialmente a opioides; síndrome de reflujo gastroesofágico; diuresis; antinatriuresis; influjo del sistema cardiovascular, ansiolisis; para el aumento de la vigilia; aumento de la libido, modulación de la actividad motora y para la anestesia local.

31. Utilización de al menos un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 24, para la preparación de medicamento para la profilaxis y/o el tratamiento de desórdenes y/o enfermedades mediadas, al menos parcialmente, por el receptor mGluR5.
- 5 32. Utilización de al menos un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 24, para la preparación de un medicamento para el tratamiento y/o la profilaxis del dolor, preferentemente del dolor seleccionado entre el grupo formado por dolor agudo, dolor crónico, dolor neuropático y dolor visceral.
- 10 33. Utilización de al menos un compuesto según una o más de las reivindicaciones 1 a 24, para la preparación de un medicamento para el tratamiento y/o la profilaxis de la migraña; depresiones; enfermedades neurodegenerativas, particularmente seleccionadas del grupo formado por la enfermedad de Parkinson, la enfermedad de Alzheimer, la enfermedad de Huntington y la esclerosis múltiple; enfermedades cognitivas, preferentemente condiciones de déficit cognitivo, en particular síndrome de déficit de atención (ADS); ataques de pánico; epilepsia, tos, incontinencia urinaria; diarrea; prurito; esquizofrenia; isquemia cerebral; espasmos musculares; calambres; trastornos alimentarios, preferentemente seleccionados del grupo formado por bulimia, caquexia, anorexia y obesidad; abuso de alcohol y/o drogas (especialmente abuso de nicotina y/o cocaína) y/o abuso de medicamentos; dependencia del alcohol y/o drogas (especialmente dependencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos, particularmente para la profilaxis y/o reducción de trastornos asociados a la abstinencia de alcohol y/o drogas (especialmente abstinencia de nicotina y/o cocaína) y/o dependencia de medicamentos; desarrollo de tolerancia a medicamentos, especialmente a opioides; síndrome de reflujo gastroesofágico; diuresis; antinatriuresis; influjo del sistema cardiovascular, ansiolisis; para el aumento de la vigilia; aumento de la libido, modulación de la actividad motora y para la anestesia local.
- 15
- 20