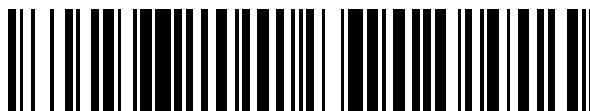


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 529 691**

51 Int. Cl.:

**C07D 471/04** (2006.01)

**A61K 31/437** (2006.01)

**A61P 3/10** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.05.2007 E 07725570 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **03.12.2014 EP 2032571**

54 Título: **Derivados de 3-amino-imidazo [1,2-A] piridina como inhibidores de SGLT**

30 Prioridad:

**23.06.2006 DE 102006028862**

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

**24.02.2015**

73 Titular/es:

**MERCK PATENT GMBH (100.0%)  
FRANKFURTER STRASSE 250  
64293 DARMSTADT, DE**

72 Inventor/es:

**MEDERSKI, WERNER;  
BEIER, NORBERT;  
CEZANNE, BERTRAM;  
GERICKE, ROLF;  
KLEIN, MARKUS y  
TSAKLAKIDIS, CHRISTOS**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

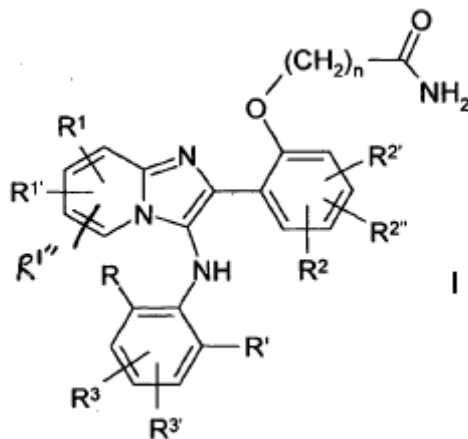
**ES 2 529 691 T3**

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

**DESCRIPCIÓN**

Derivados de 3-amino-imidazo [1,2-A] piridina como inhibidores de SGLT

La presente invención hace referencia a compuestos de la fórmula I



5 en donde

R, R', respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan A, OA, Hal, NO<sub>2</sub> o COOA,

R<sup>1</sup>, R<sup>1'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H, A, F, Cl, NH<sub>2</sub>, OH, CN o COOA,

R<sup>1''</sup> representa H o NH<sub>2</sub>,

10 R<sup>2</sup>, R<sup>2'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H, Hal, A, OH, OA, CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OR<sup>4</sup>, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, NH(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>4</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COOR<sup>4</sup>, OSO<sub>2</sub>A, OHet, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CONR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>Ar, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH o OSO<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>

R<sup>2</sup> y R<sup>2'</sup> representan de forma conjunta también -CH=CH-CH=CH-,

R<sup>2''</sup> representa H, A, Hal, OH u OA,

15 R<sup>3</sup>, R<sup>3'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan A, OA, Hal, NO<sub>2</sub> o COOA,

R<sup>4</sup>, R<sup>4'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H o A,

A representa alquilo no ramificado o ramificado con 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de C, en donde 1-5 átomos de H pueden ser reemplazados por F,

20 Het representa tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, dioxolanilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, los cuales también pueden ser mono-sustituídos por =O (oxígeno de carbonilo),

Ar representa fenilo,

Hal representa F, Cl, Br o I,

m representa 1, 2 ó 3,

n representa 0, 1 ó 2,

25 así como sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción.

Es objeto de la presente invención el hallar nuevos compuestos con propiedades valiosas, en particular compuestos que puedan utilizarse para preparar medicamentos.

Se ha comprobado que los compuestos de la fórmula I y sus sales, en caso de una buena compatibilidad, poseen propiedades farmacológicas muy valiosas. Estos compuestos muestran propiedades inhibitorias con respecto a SGLT1 y SGLT2 (sodium dependent glucose co-transporter) y, por tanto, pueden utilizarse para combatir y prevenir la diabetes de tipo 1 y de tipo 2.

La absorción de glucosa en el borde cuticular del intestino delgado y en los túbulos renales próximos en contra de un gradiente de concentración tiene lugar mediante co-transportadores de glucosa epiteliales dependientes de sodio (SGLTs). Se han descrito al menos dos grandes clases de SGLTs: SGLT1 (por ejemplo Lee W.S. y otros (1994) The high-affinity Na<sup>+</sup>/Glucose co-transporter: reevaluation of function and distribution of expression. J. Biol. Chem. 269, 12032-12039) y SGLT2 (por ejemplo Mackenzie B. y otros (1994) SAAT1 is a low-affinity Na<sup>+</sup>/glucose cotransporter and not an amino acid transporter. J. Biol. Chem. 269, 22488-22491). Se estima que el SGLT1 es importante para la absorción de glucosa en el intestino, mientras que el SGLT2 probablemente es el principal responsable por la reabsorción de glucosa filtrada libremente hacia los riñones.

La modificación principal en la diabetes mellitus es la hiperglicemia. Ésta no se trata solamente de un síntoma de la enfermedad, sino también un factor patógeno potencial que conduce a complicaciones diabéticas crónicas múltiples micro y macro vasculares, a un trastorno de la secreción de insulina y a la sensibilidad (Klein R. (1995), Hyperglycemia and microvascular and macrovascular disease in diabetes, Diabetes Care 18, 258-268; Rossetti L.(1995), Glucose toxicity: the implications of hyperglycemia in the pathophysiology of diabetes mellitus, Clin. Invest. Med. 18, 255-260). De este modo, en el caso de un paciente con diabetes, la regulación exclusiva del nivel de insulina en sangre dentro del rango normal se considera como un objetivo importante de la terapia. Conforme a su función descrita, una inhibición de los SGLTs conduce a una absorción reducida y a una eliminación aumentada de glucosa, así como a una consiguiente disminución del nivel de glucosa en sangre. De este modo, la supresión de los SGLTs puede ser una alternativa adecuada para el tratamiento de la diabetes.

En las publicaciones se describen varias clases de sustancias con efecto SGLT. La sustancia natural plorzina se considera como un modelo para todas esas estructuras.

Por las solicitudes WO 2004/052902 y WO 2004/052903 se conocen derivados aromáticos de glicósidos. En las solicitudes WO 0280936, WO 0280935, JP 2000080041 y EP 850948 se describen glicósidos de propiofenona. En las solicitudes WO 0244192, WO 0228872 y WO 0168660 se describen glucopirano siloxi bencil benzoles. Por las solicitudes WO 0268440, WO 0268439, WO 0236602 y WO 0116147 se conocen glucopirano siloxi pirazoles. En las solicitudes WO 0174835 y WO 0174834 se revelan benzamidas de o-glicósidos.

En las solicitudes WO 0127128 y US 2002137903 se describen c-aril glicósidos. Todas las estructuras conocidas contienen glucosa como un elemento estructural importante. Asimismo, por la solicitud US 2002/132807 se conocen compuestos de diaril-sulfuro para el tratamiento de enfermedades inflamatorias e inmunológicas. En la solicitud EP 0 953 357 A1 se describen compuestos generales de glicósido como portadores renales de fármacos y en la solicitud WO 95/23780 se describen compuestos de 4-hidroxi-fenoxi-hetero-cicloalquilo como agentes aclaradores de la piel.

Los compuestos acordes a la invención presentan una disociación elevada con respecto a la afinidad deseada de SGLT2 para con SGLT1.

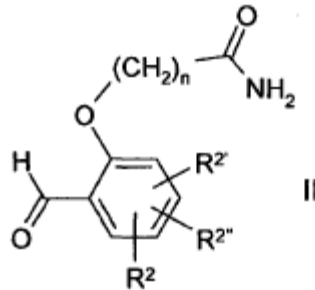
Los compuestos de la fórmula I se caracterizan por sus efectos favorables en cuanto al metabolismo de glucosa, reducen en particular el nivel de glucosa en sangre y son apropiados para el tratamiento de diabetes del tipo 1 y del tipo 2. Por tanto, los compuestos pueden ser utilizados solos o en combinación con otros componentes activos que reduzcan la cantidad de azúcar en sangre (antidiabéticos).

Los compuestos de la fórmula I son apropiados además para prevenir y tratar daños diabéticos a largo plazo, como por ejemplo nefropatía, retinopatía, neuropatía, así como el síndrome X, obesidad, infarto cardíaco, infarto del miocardio, arteriopatía obliterante periférica, trombosis, arterioesclerosis, inflamaciones, enfermedades inmunológicas, enfermedades autoinmunitarias, como por ejemplo SIDA, asma, osteoporosis, cáncer, psoriasis, enfermedad de Alzheimer, esquizofrenia y enfermedades infecciosas, donde se considera particularmente el tratamiento de diabetes del tipo 1 y del tipo 2, así como para la prevención y el tratamiento de 15 daños diabéticos a largo plazo, síndrome X y obesidad.

Los compuestos de la fórmula I pueden utilizarse como componentes activos de medicamentos en la medicina humana y veterinaria, en particular para el tratamiento y la prevención de diabetes del tipo 1 y del tipo 2.

Son objeto de la presente invención los compuestos de la fórmula I y sus sales, así como un procedimiento para preparar compuestos de la fórmula I, así como sus derivados, solvatos, sales y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, caracterizado porque

a) un compuesto de la fórmula II

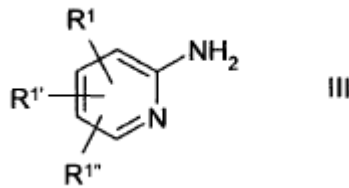


5

en donde

$R^2$ ,  $R^{2'}$  y  $R^{2''}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

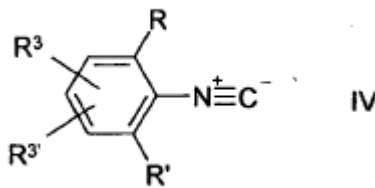
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula III



10 en donde

$R^1$ ,  $R^{1'}$  y  $R^{1''}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

y se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula IV

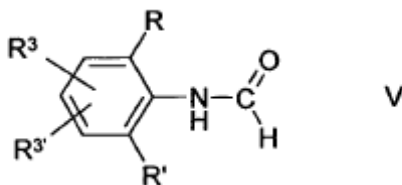


en donde

15  $R$ ,  $R'$ ,  $R^3$  y  $R^3$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

o

b) un compuesto de la fórmula II se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula III y con un compuesto de la fórmula V



en donde

R, R', R<sup>3</sup> y R<sup>3'</sup> representan lo indicado en la reivindicación 1,

y/o

- 5 una base o un ácido de la fórmula I es convertido en una de sus sales.

Son objeto de la presente invención también las formas ópticamente activas (estereoisómeros), los enantiómeros, los racematos, los diastereómeros así como hidratos y solvatos de esos compuestos. Como solvatos de los compuestos se entienden adiciones de moléculas inertes de disolventes en los compuestos, las cuales se conforman debido a su atracción recíproca. Por ejemplo, los mono- o di-hidratos o los alcoholatos son solvatos.

- 10 Como derivados que pueden utilizarse farmacéuticamente se comprenden por ejemplo las sales de los compuestos acordes a la invención.

Son además objeto de la invención las mezclas de los compuestos de la fórmula I acordes a la invención, como por ejemplo las mezclas de dos diastereómeros, por ejemplo en una proporción de 1:1, 1:2, 1:3, 1:4, 1:5, 1:10, 1:100 ó de 1:1000.

- 15 De forma especialmente preferente se trata de mezclas de compuestos estereoisómeros.

Los compuestos según la invención pueden presentarse también en diferentes formas polimórficas, por ejemplo como formas polimórficas amorfas y cristalinas. Todas las formas polimórficas de los compuestos según la invención se encuentran comprendidas dentro del marco de la presente invención y constituyen otro aspecto de la invención.

- 20 Para todos los radicales que se presentan de forma múltiple aplica que sus representaciones son independientes unas de otras. En cuanto a lo mencionado anteriormente y a lo subsiguiente, los radicales o parámetros R, R', R<sup>1</sup>, R<sup>1'</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>2'</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3'</sup>, R<sup>4</sup> y n poseen las representaciones indicadas en la fórmula I, a menos que se indique lo contrario de forma explícita.

- 25 A representa alquilo, no ramificado (lineal) o ramificado, y posee 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 ó 10 átomos de C. A, de forma preferente, representa metilo, además etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, butilo sec. o terc., también pentilo, 1-, 2- ó 3- metilbutilo, 1,1-, 1,2- ó 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1-, 2-, 3- ó 4-metilpentilo, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 2,2-, 2,3- ó 3,3-dimetilbutilo, 1- ó 2-etilbutilo, 1-etilo- 1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, 1,1,2- ó 1,2,2-trimetilpropilo, de forma aún más preferente por ejemplo trifluorometilo.

- 30 A, de forma especialmente preferente, representa alquilo con 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de C, preferentemente metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, butilo secundario, butilo terciario, pentilo, hexilo, trifluorometilo, pentafluoretilo ó 1,1,1-trifluoretilo.

Cicloalquilo, de forma preferente, representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo

De manera preferente, Ar representa fenilo no sustituido.

De manera preferente Het representa tetrahidrofurano, tetrahidropirano, dioxolano, pirrolidino, piperidino, morfolino o piperazino, los cuales también pueden ser mono-sustituidos por =O (oxígeno de carbonilo).

- 35 R, R', preferentemente, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan metilo, etilo, propilo, isopropilo o cloro.

R<sup>1</sup>, de manera preferente, representa H, A, F, Cl, NH<sub>2</sub>, OH, CN o COOA;

R<sup>1'</sup>, de manera preferente, representa H, además también F;

R<sup>1</sup>, de forma preferente, representa H, además NH<sub>2</sub>.

R<sup>2</sup>, R<sup>2</sup>, de manera preferente, independientemente uno del otro, representan H, Hal, A, OH, OA, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OH, O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>OH, OCH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, NHCH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, O(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, O(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, O(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, O(C=O)CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, O(C=O)CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, O(C=O)CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, NH(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NH(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, NH(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, NH(C=O)CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NH(C=O)CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, NH(C=O)CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, COOCH<sub>3</sub>, COOH, CH<sub>2</sub>COOCH<sub>3</sub>, OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, tetrahidro-piran-2-iloxi, tetrahidro-piran-2-iloxi, OCH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>, benciloxi, OCH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>2</sub>OH, OSO<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> o OSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>.

R<sup>3</sup>, R<sup>3</sup>, de manera preferente, respectivamente de forma independiente uno del otro, representan H, metilo, fluor, NO<sub>2</sub> o COOCH<sub>3</sub>.

Hal, de forma preferente, representa F, Cl o Br, pero también I.

m, de forma preferente, representa 1 ó 2; n, de forma preferente, representa 0 ó 1.

15 Los compuestos de la fórmula I pueden poseer uno a varios centros quirales y, por tanto, pueden presentarse en diferentes formas estereoisómeras. La fórmula I comprende todas estas formas.

Los compuestos de la fórmula I y también las sustancias iniciales para su preparación se producen por lo general de acuerdo con métodos conocidos, tal como se describe en la bibliografía (por ejemplo en las publicaciones fundamentales, tal como en Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart) y mediante condiciones de reacción que son conocidas y apropiadas para las reacciones mencionadas. Pueden aplicarse además otras variantes conocidas que no se encuentran descritas aquí de forma detallada.

Las sustancias iniciales, en caso de que así se lo desee, pueden formarse también in situ, de manera que no se las aísla de la mezcla reactiva, sino que se las hace reaccionar de forma inmediata para formar los compuestos de la fórmula I.

25 Los compuestos iniciales de las fórmulas II, III, IV y V son conocidos por lo general. Si se trata de compuestos nuevos, sin embargo, éstos pueden ser producidos de acuerdo con métodos conocidos.

De forma preferente, los compuestos de la fórmula I se obtienen al hacer reaccionar compuestos de la fórmula II con compuestos de la fórmula III y IV.

30 Por lo general la reacción tiene lugar en un disolvente inerte, en presencia de un medio de activación, preferentemente de ácido perclórico.

El tiempo de reacción, según las condiciones que se aplican, se ubica entre algunos minutos y 14 días, la temperatura de reacción entre unos 0° y 150°, normalmente entre 5° y 90° y de forma especialmente preferente entre 10° y 70° C.

35 Como disolventes inertes son adecuados por ejemplo hidrocarburos como hexano, petroleter, benceno, tolueno o xileno; hidrocarburos clorados como tricloroetileno, 1,2-dicloroetano, tetracloruro de carbono, cloroformo o diclorometano; alcoholes como metanol, etanol, isopropanol, n-propanol, n-butanol o terc.-butanol; éter como éter dietílico, éter diisopropílico, tetrahidrofurano (THF) o dioxano; éter glicólico como etilenglicol monometil éter o monoetil éter (metilglicol o etilglicol), 1,2- dimetoxietano (diglima); cetonas como acetona o butanona; amidas como acetamida, dimetilacetamida o dimetilformamida (DMF); nitrilos como acetonitrilo; sulfóxidos como dimetilsulfóxido (DMSO); sulfuro de carbono; ácidos carboxílicos como ácido fórmico o ácido acético; nitroderivados como nitrometano o nitrobenceno; ésteres como acetato de etilo o mezclas de los disolventes mencionados; donde el etanol se considera como especialmente preferente.

45 Los compuestos de la fórmula I pueden obtenerse además al hacer reaccionar compuestos de la fórmula II con compuestos de la fórmula III y V. Por lo general la reacción tiene lugar en un disolvente inerte, en presencia de un medio de fijación del agua, preferentemente en presencia de T3P<sup>®</sup> (anhídrido de ácido propilfosfónico).

El tiempo de reacción, según las condiciones que se aplican, se ubica entre algunos minutos y 14 días, la temperatura de reacción entre unos 0° y 150°, normalmente entre 5° y 90° y de forma especialmente preferente entre 10° y 70° C.

## Sales farmacéuticas y otras formas

Los compuestos mencionados de la fórmula I pueden utilizarse en su forma no salina definitiva. Por otra parte, la presente invención comprende también la utilización de estos compuestos en forma de sus sales farmacéuticamente aceptables que pueden ser derivadas de diferentes ácidos y bases orgánicos e inorgánicos, de acuerdo con procedimientos especializados conocidos. Las formas de sal farmacéuticamente aceptables de los compuestos de la fórmula I, en su mayor parte, se producen de modo convencional. Siempre que el compuesto de la fórmula I contenga un grupo de ácido carboxílico, una de sus sales adecuadas puede formarse al hacer reaccionar el compuesto con una base adecuada para formar una sal de adición básica correspondiente. Las bases de esta clase son, por ejemplo, los hidróxidos de metales alcalinos, entre ellos el hidróxido de potasio, hidróxido de sodio y el hidróxido de litio; hidróxidos de metales de tierra alcalina como hidróxido de bario e hidróxido de calcio; alcoholatos de metales alcalinos, por ejemplo etanolato de potasio y propanolato de sodio; así como diferentes bases orgánicas como piperidina, dietanolamina y N-metilglutamina. Se consideran igualmente las sales de aluminio de los compuestos de la fórmula I. En el caso de determinados compuestos de la fórmula I, las sales de adición ácida pueden formarse debido a que estos compuestos son tratados con ácidos orgánicos e inorgánicos farmacéuticamente aceptables, por ejemplo haluros de hidrógeno como cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno o yoduro de hidrógeno, otros ácidos minerales y sus sales correspondientes, como sulfato, nitrato o fosfato y similares, así como alquilsulfonatos y monoarilsulfonatos, como etanosulfonato, toluenosulfonato y bencenosulfonato, así como otros ácidos orgánicos y sus sales correspondientes, como acetato, trifluoracetato, tartrato, maleato, succinato, citrato, benzoato, salicilato, ascorbato y similares. Conforme a ello, entre las sales de adición ácida farmacéuticamente aceptables de los compuestos de la fórmula I figuran las siguientes: acetato, adipato, alginato, arginato, aspartato, benzoato, bencenosulfonato (besilato), bisulfato, bisulfito, bromuro, butirato, alcanforato, alcanforsulfonato, caprilato, cloruro, clorobenzoato, citrato, ciclopentanopropionato, digluconato, dihidrógeno fosfato, dinitrobenzoato, dodecilsulfato, etanosulfonato, fumarato, galacterato (del ácido múcico), galacturonato, glucoheptanoato, gluconato, glutamato, glicerofosfato, hemisuccinato, hemisulfato, heptanoato, hexanoato, hipurato, hidrocioruro, hidrobromuro, hidroyoduro, 2-hidroxi-etanosulfonato, yoduro, isetionato, isobutirato, lactato, lactobionato, malato, maleato, malonato, mandelato, metafosfato, metanosulfonato, metilbenzoato, monohidrogenofosfato, 2-naftalensulfonato, nicotinato, nitrato, oxalato, oleato, pamoato, pectinato, persulfato, fenilacetato, 3-fenilpropionato, fosfato, fosfonato, ftalato, lo cual sin embargo no debe considerarse de forma restrictiva.

Asimismo, entre las sales base de los compuestos de la fórmula I figuran las sales de aluminio, amonio, calcio, cobre, hierro(III), hierro(II), litio, magnesio-, manganeso(III)-, manganeso(II), potasio, sodio y cinc, lo cual sin embargo no debe considerarse de forma restrictiva. Con relación a las sales mencionadas arriba, se consideran preferentes las sales de amonio; las sales de metales alcalinos sodio y potasio, así como las sales de metales de tierra alcalina calcio y magnesio. Entre las sales de los compuestos de la fórmula I, derivadas de bases orgánicas no tóxicas, farmacéuticamente aceptables, figuran sales de aminas primarias, secundarias y terciarias, aminas sustituidas, entre éstas también aminas sustituidas de forma natural, aminas cíclicas, así como resinas básicas de intercambio iónico, por ejemplo arginina, betaína, cafeína, cloroprocaína, colina, N,N'-dibenciletildiamina (benzatina), diciohexilamina, dietanolamina, dietilamina, 2-dietilaminoetanol, 2-dimetilaminoetanol, etanolamina, etilendiamina, N-etilmorfolina, N-etilpiperidina, glucamina, glucosamina, histidina, hidrabamina, iso-propilamina, lidocaína, lisina, meglumina, N-metil-D-glucamina, morfolina, piperazina, piperidina, resinas de poliamina, procaína, purina, teobromina, trietanolamina, trietilamina, trimetilamina, tripropilamina, así como tris-(hidroximetil)-metilamina (trometamina), lo cual sin embargo no debe considerarse de forma restrictiva.

Los compuestos de la fórmula I de la presente invención que contienen grupos básicos que contienen nitrógeno pueden ser cuaternizados a través de medios como (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) halogenuros de alquilo, por ejemplo cloruro, bromuro y yoduro de metilo, de etilo, de isopropilo y de butilo terciario; di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) alquil sulfatos, por ejemplo sulfato de dimetilo, de dietilo y de diamilo; (C<sub>10</sub>-C<sub>18</sub>) halogenuros de alquilo, por ejemplo cloruro, bromuro y yoduro de decilo, dodecilo, laurilo, miristilo y estearilo; así como (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) halogenuros de alquilo, por ejemplo cloruro de bencilo y bromuro de fenitilo. Con sales de esta clase pueden prepararse tanto compuestos de la fórmula I solubles en agua como también solubles en aceite.

Con relación a las sales farmacéuticas mencionadas anteriormente, se consideran preferentes el acetato, tfluoracetato, besilato, citrato, fumarato, gluconato, hemisuccinato, hipurato, hidrocioruro, hidrobromuro, isetionato, mandelato, meglumina, nitrato, oleato, fosfonato, pivalato, fosfato de sodio, estearato, sulfato, sulfosalicilato, tartrato, tiomalato, tosilato y trometamina, lo cual sin embargo no debe considerarse de forma restrictiva.

Las sales de adición ácida de compuestos básicos de la fórmula I se producen debido a que la forma base libre es puesta en contacto con una cantidad suficiente del ácido deseado, de manera que la sal se presenta del modo tradicional. La base libre puede ser regenerada al poner en contacto la forma de sal con una base, aislando la base libre del modo tradicional. Las formas de base libres se diferencian en cierto modo de sus formas de sal correspondientes con respecto a determinadas propiedades físicas, como la solubilidad en disolventes polares; no obstante, dentro del marco de la presente invención, las sales corresponden a sus respectivas formas de base libres.

5 Tal como se ha indicado, las sales de adición básica de los compuestos de la fórmula I, farmacéuticamente aceptables, se forman con metales o aminas como metales alcalinos y metales de tierra alcalina o con aminas orgánicas. El sodio, potasio, magnesio y calcio se consideran metales preferentes. Como aminas orgánicas preferentes se consideran la N,N'-dibenziletilendiamina, cloroprocaína, colina, dietanolamina, etilendiamina, N-metil-D-glucamina y procaína.

10 Las sales de adición básica de compuestos ácidos de la fórmula I se producen debido a que la forma del ácido libre es puesta en contacto con una cantidad suficiente de la base deseada, de manera que la sal se presenta del modo tradicional. El ácido libre puede ser regenerado al poner en contacto la forma de la sal con un ácido, aislando el ácido libre del modo tradicional. Las formas de ácidos libres se diferencian en cierto modo de sus formas de sal correspondientes con respecto a determinadas propiedades físicas, como la solubilidad en disolventes polares; no obstante, dentro del marco de la presente invención, las sales corresponden a sus respectivas formas de ácidos libres.

15 Si un compuesto de la fórmula I contiene más de un grupo que puede formar sales farmacéuticamente aceptables de esta clase, entonces la fórmula I comprende también sales múltiples. Entre las formas de sales múltiples típicas figuran por ejemplo el bitartrato, diacetato, difumarato, dimeglumina, difosfato, sal disódica, y trihidrocloruro, lo cual sin embargo no debe considerarse de forma restrictiva.

20 Con respecto a lo mencionado anteriormente, puede observarse que, dentro de este contexto, la expresión "sal farmacéuticamente aceptable" debe entenderse como una sustancia activa que contiene un compuesto de la fórmula I en forma de una de sus sales, en particular cuando esta forma de sal, en comparación con la forma libre de la sustancia activa o de otra forma de sal de la sustancia activa, utilizada anteriormente, proporciona a la sustancia activa propiedades farmacocinéticas mejoradas. La forma de sal farmacéuticamente aceptable de la sustancia activa puede también otorgar a esta sustancia activa primero una propiedad farmacocinética deseada de la que antes no disponía, e incluso puede influenciar positivamente la farmacodinámica de esta sustancia activa con respecto a su efectividad terapéutica en el cuerpo.

25 Los compuestos de la fórmula I acordes a la invención, debido a su estructura molecular, pueden ser quirales y, conforme a ello, pueden presentarse en diferentes formas enantioméricas. Por tanto, pueden presentarse en una forma activa racémica u óptica.

30 Puesto que la efectividad farmacéutica de los racematos o de los estereoisómeros de los compuestos acordes a la invención puede ser diferente, puede ser conveniente utilizar enantiómeros. En estos casos, el producto final o ya los productos intermedios pueden ser separados en compuestos enantioméricos a través de estrategias químicas o físicas conocidas por el experto, o pueden ser empleados directamente de ese modo en la síntesis.

35 En el caso de aminas racémicas, a partir de la mezcla, se forman diastereómeros a través de la reacción con un agente separador ópticamente activo. Como agentes separadores son apropiados por ejemplo los ácidos ópticamente activos, como las formas R y S del ácido tartárico, ácido diacetil tartárico, ácido dibenzoil tartárico, ácido mandélico, ácido málico, ácido láctico, aminoácidos N-prottegidos (por ejemplo N-benzoil prolina o N-bencenosulfonil prolina) o los diferentes ácidos sulfónicos de alcanfor ópticamente activos. Se considera también como ventajosa una separación cromatográfica de enantiómeros con la ayuda de un agente separador ópticamente activo (por ejemplo dinitrobenzoilfenilglicina, triacetato de celulosa u otros derivados de hidratos de carbono, o polímeros de metacrilato quiralmente derivatizados, fijados en gel de sílice). Como eluyentes son adecuadas las mezclas de disolventes acuosas o alcohólicas, como por ejemplo hexano/isopropanol/acetronitrilo, por ejemplo en una proporción de 82:15:3.

40 Asimismo, es objeto de la presente invención la utilización de los compuestos de la fórmula I y/o de sus sales fisiológicamente aceptables para la preparación de un medicamento (preparación farmacéutica), en particular por vías no químicas. Éstos pueden utilizarse de forma conjunta con al menos un vehículo o con un adyuvante sólido, líquido y/o semilíquido y, eventualmente, en combinación con uno o con otros varios componentes activos en una forma de dosis adecuada.

45 Además, son objeto de la presente invención los medicamentos que contienen al menos un compuesto de la fórmula I y/o sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción, así como eventualmente vehículos y/o adyuvantes.

50 Estas preparaciones pueden emplearse como medicamentos en la medicina humana o veterinaria.

Las formulaciones farmacéuticas pueden presentarse en forma de unidades de dosis que contienen una cantidad determinada de componente activo por unidad de dosis. A modo de ejemplo, una unidad de esta clase puede contener de 0,5 mg a 1 g, preferentemente de 1 mg a 700 mg, y de forma especialmente preferente de 5 mg a 100 mg de un compuesto acorde a la invención, según el estado de la enfermedad tratada, la vía de administración y la



edad, peso y estado del paciente; o las formulaciones farmacéuticas pueden presentarse en forma de unidades de dosis que contengan una cantidad predeterminada de componente activo por unidad de dosis. Se consideran formulaciones de unidades de dosis preferentes aquellas que, tal como se indicó anteriormente, contienen una dosis diaria o una dosis fraccionada, o una fracción correspondiente, de un componente activo. Las formulaciones farmacéuticas de este tipo, asimismo, pueden ser producidas mediante un procedimiento conocido de forma general en el área farmacéutica.

Las formulaciones farmacéuticas pueden adaptarse para ser administradas por cualquier vía apropiada, por ejemplo por vía oral (inclusive bucal o sublingual), rectal, nasal, local (inclusive bucal, sublingual o transdérmica), vaginal o parenteral (inclusive subcutánea, intramuscular, intravenosa o intradérmica). Las formulaciones de esta clase pueden producirse mediante todos los procedimientos conocidos en el área farmacéutica, por ejemplo reuniendo el componente activo con el o los vehículos o adyuvantes.

Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas por vía oral pueden presentarse como unidades separadas, por ejemplo como cápsulas o comprimidos; polvo o granulados; soluciones o suspensiones en líquidos acuosos o no acuosos; espumas o cremas comestibles; emulsiones líquidas de aceite en agua o emulsiones líquidas de agua en aceite.

De este modo, en el caso de una administración por vía oral, por ejemplo en forma de un comprimido o una cápsula, los componentes de la sustancia activa pueden combinarse con un vehículo inerte oral, no tóxico y farmacéuticamente aceptable, como por ejemplo etanol, glicerina, agua, entre otros. Los polvos se preparan triturando el compuesto hasta lograr un tamaño fino adecuado y mezclándolo con un vehículo triturado farmacéuticamente de forma similar, por ejemplo con un hidrato de carbono comestible, como por ejemplo almidón o manitol. Eventualmente pueden agregarse también aromatizantes, conservantes, dispersantes y colorantes.

Las cápsulas se preparan realizando una mezcla en polvo tal como se describió más arriba y llenando con ella cápsulas de gelatina moldeada. Antes del proceso de llenado, a la mezcla en polvo se pueden agregar deslizantes y lubricantes, como por ejemplo ácido silícico, talco, estearato de magnesio, estearato de calcio o polietilenglicol en forma sólida. En caso necesario, puede añadirse también un agente disgregante o un agente solubilizante, como por ejemplo agar-agar, carbonato de calcio o carbonato sódico, para mejorar la disponibilidad del medicamento después de ingerir la cápsula.

Además, en caso de que sea necesario o si así se desee, pueden incorporarse a la mezcla también agentes aglutinantes, lubricantes, disgregantes o colorantes. Entre los aglutinantes adecuados figuran el almidón, gelatina, azúcares naturales, como por ejemplo glucosa o beta lactosa, edulcorantes a base de maíz, gomas naturales y sintéticas, como por ejemplo goma arábiga, goma tragacanto o alginato sódico, carboximetilcelulosa, polietilenglicol, ceras, entre otros. Entre los lubricantes utilizados en estas formas de dosis figuran el oleato sódico, estearato sódico, estearato de magnesio, benzoato sódico, acetato sódico, cloruro sódico, entre otros. Entre los agentes disgregantes, de forma no restrictiva, figuran el almidón, metilcelulosa, agar, bentonita, xantano, entre otros. Los comprimidos se formulan, por ejemplo, preparando, granulando o comprimiendo en seco una mezcla en polvo, añadiendo un lubricante y un agente disgregante y comprimiendo todo. Una mezcla en polvo se prepara mezclando de forma adecuada un compuesto triturado con un diluyente o con una base, tal como se describió anteriormente y, eventualmente, con un aglutinante, como por ejemplo carboximetilcelulosa, con un alginato, gelatina o polivinil pirrolidón, con un retardador de disolución, como por ejemplo parafina, con un acelerador de resorción, como por ejemplo una sal cuaternaria y/o un agente de absorción, como por ejemplo bentonita, caolinita o fosfato dicálcico. La mezcla en polvo puede ser granulada por ejemplo humedeciendo un aglutinante, como por ejemplo jarabe, pasta de almidón, mucílago de acacia o soluciones a base de celulosa o materiales de polímeros, y prensándola a través de un tamiz. De forma alternativa con respecto a la granulación, la mezcla en polvo puede ser procesada por una pastilladora, donde se producen grumos conformados de forma irregular que se rompen en gránulos. Los granulados pueden ser lubricados agregando ácido esteárico, una sal de estearato, talco o aceite mineral para impedir que se adhieran a los moldes de los comprimidos. La mezcla lubricada es entonces prensada para formar los comprimidos. Los componentes activos pueden ser combinados también con un vehículo inerte de flujo libre y ser entonces prensados directamente para formar comprimidos sin la realización del paso de granulación o de compresión en seco. Puede estar presente una capa protectora transparente u opaca, compuesta por un sellado de goma laca, una capa de azúcar o de material de polímeros y una capa de brillo de cera. A estos recubrimientos se les puede agregar colorantes para poder diferenciar entre unidades de dosis diferentes.

Los líquidos orales, como por ejemplo soluciones, jarabes y elixires, pueden prepararse en forma de unidades de dosis, de manera que una cantidad indicada comprenda una cantidad predeterminada de los compuestos. Los jarabes pueden prepararse disolviendo los compuestos en una solución acuosa con un sabor adecuado, mientras que los elixires se preparan utilizando un vehículo (excipiente) alcohólico no tóxico. Las suspensiones pueden ser formuladas a través de la dispersión de los compuestos en un vehículo no tóxico. Eventualmente pueden agregarse agentes solubilizantes y emulsionantes, como por ejemplo, entre otros, alcoholes isoestearílicos etoxilados y sorbitoléter de polioxietileno, conservantes, aditivos saborizantes, como por ejemplo aceite de menta o edulcorantes naturales o sacarina, u otros edulcorantes artificiales.

Las formulaciones de las unidades de dosis para administración por vía oral, eventualmente, pueden incluirse en microcápsulas. Las formulaciones pueden prepararse de manera que la liberación se prolongue o se retarde, por ejemplo a través del recubrimiento o la inclusión del material particulado en polímeros, cera, entre otros.

5 Los compuestos de la fórmula I, así como las sales y solvatos de éstos, así como los otros componentes activos, pueden ser administrados también en forma de sistemas de suministro de liposomas, como por ejemplo vesículas unilamerales pequeñas, vesículas unilamerales grandes y vesículas multilamerales. Los liposomas pueden formarse a partir de diferentes fosfolípidos, como por ejemplo colesterol, estearilamina o fosfatidilcolina.

10 Los compuestos de la fórmula I, así como las sales y solvatos de los mismos, así como otros componentes activos, pueden administrarse también utilizando anticuerpos monoclonales como portadores individuales, a los que pueden acoplarse las moléculas del compuesto. Los compuestos también pueden acoplarse a polímeros solubles como vehículos dirigidos a una diana determinada. Los polímeros de este tipo pueden comprender polivinil pirrolidón, copolímero de pirano, polihidroxi propil metacrilamida fenol, polihidroxi etil aspartamida fenol o polietilenglicol polilisina, sustituido con radicales de palmitoil. Asimismo, los compuestos pueden acoplarse a una clase de polímeros biológicamente degradables que son adecuados para lograr una liberación controlada de una sustancia medicinal, por ejemplo ácidos polilácticos, poli epsilon caprolactona, ácido polihidroxibutírico, poli-orto-éster, poliacetal, poli dihidroxipirano, policianoacrilato y copolímeros en bloque reticulados transversalmente o anfipáticos de hidrogeles.

20 Las formulaciones adaptadas para una administración transdérmica pueden presentarse como emplastos individuales para un contacto prolongado y próximo con la epidermis del receptor. De este manera, a modo de ejemplo, la sustancia activa puede administrarse desde el emplasto mediante iontoforesis, tal como se describe de modo general en Pharmaceutical Research, 3(6), 318 (1986).

Los compuestos farmacéuticos adaptados para ser administrados por vía tópica pueden ser formulados como pomadas, suspensiones, lociones, polvos, soluciones, pastas, geles, sprays, aerosoles o aceites.

25 Para tratamientos del ojo o de otros tejidos, por ejemplo de la boca y de la piel, las formulaciones se aplican preferentemente como cremas o pomadas tópicas. En el caso de la formulación de una pomada, el componente activo puede ser empleado con una base de crema parafínica o que pueda mezclarse con agua. De forma alternativa, el componente activo puede ser formulado para formar una crema con una base de crema de agua en aceite o una base de aceite en agua.

30 Entre las formulaciones farmacéuticas adaptadas para una aplicación tópica en el ojo figuran las gotas oftálmicas, donde el componente activo se encuentra disuelto o suspendido en un vehículo adecuado, en especial en un disolvente acuoso.

Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para una aplicación tópica en la boca comprenden pastillas, comprimidos para chupar y enjuagues bucales.

35 Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas por vía rectal pueden presentarse en forma de supositorios o de lavativas.

40 Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas por vía nasal, en las cuales la sustancia portadora es una sustancia sólida, contienen un polvo grueso con un tamaño de las partículas dentro del rango de 20-500 micrómetros que se suministra del mismo modo en el que se utiliza el rapé, es decir, a través de una inhalación rápida a través de las vías nasales desde un contenedor con el polvo que se sostiene de forma próxima a las vías nasales. Las formulaciones adaptadas para ser administradas como spray nasal o gotas para la nariz, con un líquido como sustancia portadora, comprenden soluciones de componentes activos en agua o aceite.

Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas a través de inhalación comprenden polvos de partículas finas o niebla que pueden ser producidas mediante diferentes clases de dosificadores que se encuentran bajo presión, con aerosoles, nebulizadores o insufladores.

45 Las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas por vía vaginal pueden presentarse como pesarios, tampones, cremas, geles, pastas, espumas o formulaciones en forma de spray.

50 Entre las formulaciones farmacéuticas adaptadas para ser administradas por vía parenteral figuran las soluciones para inyección estériles acuosas y no acuosas que contienen antioxidantes, tampones químicos, bacteriostatos y solutos, a través de las cuales la formulación se realiza isotómicamente con la sangre del receptor a ser tratado; así como suspensiones estériles acuosas y no acuosas que pueden contener agentes de suspensión y espesantes. Las formulaciones pueden presentarse en dosis individuales o en envases para varias dosis, por ejemplo en ampollas y frascos sellados, y pueden almacenarse en un estado deshidratado por congelación (liofilizado), de manera que sólo

se requiera el agregado del líquido portador estéril, por ejemplo agua, a los fines de una inyección, inmediatamente antes de la utilización. Las soluciones para inyección y las suspensiones preparadas de acuerdo con una receta pueden prepararse en base a polvos estériles, granulados y comprimidos.

5 Se entiende que las formulaciones, junto con los componentes especialmente mencionados más arriba, pueden contener otros agentes utilizados habitualmente en esta área especializada, relativos a la respectiva clase de la formulación; de este modo, por ejemplo, las formulaciones adaptadas para ser administradas por vía oral pueden contener sustancias saborizantes.

10 Una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de la fórmula I, así como del otro componente activo, depende de una serie de factores, inclusive por ejemplo de la edad y peso del animal, del estado exacto de la enfermedad que requiere el tratamiento, así como de su gravedad, del estado de la formulación, así como de la vía de administración y, por último, es determinada por el médico o veterinario que se encuentre a cargo del tratamiento. No obstante, por lo general, una cantidad efectiva de un compuesto se ubica dentro del rango de 0,1 a 100 mg/kg del peso corporal del receptor (mamíferos) por día y, de forma típica, dentro del rango de 1 a 10 mg/kg del peso corporal por día. De este modo, en el caso de un mamífero adulto con un peso de 70 kg, la cantidad efectiva por día sería por lo general de entre 70 y 700 mg, donde esa cantidad puede ser administrada como dosis individual por día o, del modo más habitual, en una serie de dosis fraccionadas (por ejemplo dos, tres, cuatro, cinco o seis) por día, de manera que la cantidad diaria total de la dosis es la misma. Una cantidad efectiva de una sal o solvato del compuesto puede determinarse por sí misma como parte de la cantidad efectiva del compuesto.

20 Asimismo, es objeto de la presente invención la utilización de compuestos de la fórmula I, en combinación con al menos otro componente activo del medicamento, preferentemente para el tratamiento de la diabetes de tipo 1 y de tipo 2, en particular para reducir el azúcar en la sangre.

Como otros componentes activos para los preparados de combinación son adecuados:

25 Todos los antidiabéticos que se mencionan en la lista roja 2001, capítulo 12. Pueden combinarse con los compuestos de la fórmula I según la invención, en particular para lograr una mejora sinérgica del efecto. La administración de la combinación de componentes activos puede efectuarse a través de la toma separada de los componentes activos por los pacientes o en forma de preparados combinados, en donde en una preparación farmacéutica se presentan varios componentes activos. La mayoría de los componentes activos que se indican a continuación se describen en el USP Dictionary of USAN and International Drug Names, US Pharmacopeia, Rockville 2001. Los antidiabéticos comprenden la insulina y derivados de insulina, como por ejemplo Lantus<sup>®</sup> (véase [www.lantus.com](http://www.lantus.com)) o HMR 1964, insulinas de efecto rápido (véase US 6.221.633, 221, 633), derivados de GLP -1 como por ejemplo aquellos que se han sido revelados en la solicitud WO 98/08871 por Novo Nordisk A/S, así como componentes activos hipoglicémicos administrados por vía oral.

35 De forma preferente, los componentes activos hipoglicémicos administrados por vía oral comprenden sulfonilureas, biguanidas, meglitinidas, oxadiazolidindionas, tiazolidinedionas, inhibidores de glucosidasa, antagonistas de glucagón, agonistas de GLP-1, abridores del canal de potasio, como por ejemplo aquellos que han sido revelados en las solicitudes WO 97/26265 y WO 99/03861 de Novo Nordisk A/S, sensibilizadores de insulina, inhibidores de enzimas hepáticas que participan en la estimulación de la gluconeogénesis y/o glucogenólisis, moduladores de la absorción de glucosa, compuestos que modifican el lipometabolismo como componentes activos antihiperlipidémicos, compuestos que reducen la ingesta de alimentos, agonistas de PPAR y PXR, y componentes activos que actúan en el canal de potasio dependiente del ATP.

En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de HMGC<sub>o</sub>A-reductasa, como simvastatina, fluvastatina, pravastatina, lovastatina, atorvastatina, cerivastatina, rosuvastatina.

45 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de reabsorción de colesterolina, como por ejemplo ezetimiba, tiquesida, pamaquesida.

En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un agonista de PPAR gama, como por ejemplo rosiglitazona, pioglitazona, JTT- 501, GI 262570.

En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con agonista de PPAR alfa, como por ejemplo GW 9578, GW 7647.

50 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con agonistas de PPAR alfa/gama mixtos, como por ejemplo GW 1536, AVE 8042, AVE 8134, AVE 0847, AVE 0897 o como se describe en las solicitudes WO 00/64888, WO 00/64876, WO 03/20269.

- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un fibrato, como por ejemplo fenofibrato, clofibrato, bezafibrato.
- 5 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de MTP, como por ejemplo implitapida, BMS-201038, R-103757. En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de absorción de ácido biliar (véanse por ejemplo las solicitudes US 6,245,744 ó US 6,221, 897), así como por ejemplo HMR 1741.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de CETP, como por ejemplo JTT-705.
- 10 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un absorbedor de ácido biliar, como por ejemplo colestiramina, colesevelam.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inductor receptor de LDL (véase la solicitud US 6.342.512, 342, 512), como por ejemplo HMR1171, HMR1586.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de ACAT como por ejemplo avasimibe.
- 15 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un antioxidante, como por ejemplo OPC-14117.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de lipoproteína-lipasa, como por ejemplo NO-1886.
- 20 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de ATP-citrato-liasa, como por ejemplo SB-204990.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de escualeno sintetasa, como por ejemplo BMS-188494. En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un antagonista de lipoproteína(a), como por ejemplo CI-1027 o ácido nicotínico. En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de lipasa, como por ejemplo orlistat.
- 25 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con insulina.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con una sulfonilurea, como por ejemplo tolbutamida, glibenclamida, glipizida o glimpirida.
- 30 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con una biguanida, como por ejemplo metformina.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con una meglitinida, como por ejemplo repaglinida.
- 35 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con una tiazolidindiona, como por ejemplo troglitazona, ciglitazona, pioglitazona, rosiglitazona o los compuestos descritos en la solicitud WO 97/41097 de Dr. Reddy's Research Foundation, en particular 5- [[4- [(3,4- dihidro-3- metil- 4- oxo -2- quinazolina-il-metoxi] fenil] metil]- 2,4- tiazolidindiona.
- En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un inhibidor de  $\alpha$ - glucosidasa como por ejemplo miglitol o acarbosa.
- 40 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con un componente activo que actúa sobre el canal de potasio dependiente del ATP de las células beta, como por ejemplo tolbutamida, glibenclamida, glipizida, glimpirida o repaglinida.
- 45 En una forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con más de uno de los compuestos antes mencionados, por ejemplo en combinación con una sulfonilurea y metformina, una sulfonilurea y acarbosa, repaglinida y metformina, insulina y una sulfonilurea, insulina y metformina, insulina y troglitazona, insulina y lovastatina, etc.

En otra forma de ejecución de la invención, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con moduladores de CART (véase "Cocaine- amphetamineregulated transcript influences energy metabolism, anxiety and gastric emptying in mice" Asakawa, A, y otros, M.: *Hormone and Metabolic Research* (2001), 33 (9), 554 -558), antagonistas de NPY, por ejemplo naftalina-1-ácido sulfónico {4-[(4- amino-quinazolina-2-ilamino)-metil]-ciclohexilmetil}-amida; hidrocloreuro (CGP 71683A)), agonistas de MC4 (por ejemplo 1-amino-1,2,3,4-tetrahidro-naftalina-2-ácido carboxílico [2-(3a-bencil-2-metil-3-oxo-2,3,3a,4,6,7-hexahidro-pirazolo[4,3-c]piridin-5-il)-1-(4-cloro-fenil)-2-oxo-etil]amida; (solicitud WO 01/91752)), antagonistas de orexina (por ejemplo 1-(2-metil-benzoxazol-6-il)-3-[1,5]naftiridina-4-il-urea; hidrocloreuro (SB-334867-A)), agonistas de H3 (3-ciclohexilo-1-(4,4-dimetil-1,4,6,7-tetrahidroimidazo[4,5-c]piridin-5-il)-propan-1-ona sal de ácido oxálico (solicitud WO 00/ 63208)); agonistas de TNF, antagonistas de CRF (por ejemplo [2-metil-9-(2,4,6-trimetil-fenil)-9H-1,3,9-triaza-fluoren-4-il]-dipropil-amina (solicitud WO 00/66585)), antagonistas de CRF BP (por ejemplo urocortina), agonistas de urocortina, agonistas de  $\beta$ 3 (por ejemplo 1-(4-cloro-3-metanesulfonilmetil-fenil)-2-[2-(2,3-dimetil-1 H-indol-6-iloxi)etilamino]-etanol; hidrocloreuro (solicitud WO 01/83451)), agonistas de MSH (hormona estimulante de melanocitos), agonistas de CCK-A (por ejemplo {2-[4-(4-cloro-2,5-dimetoxi-fenil)-5-(2-ciclohexil-etil)-tiazol-2-ilcarbamoil]-5,7-dimetil-indol-1-il}- ácido acético sal de trifluor-ácido acético (solicitud WO 99/15525)); inhibidores de reabsorción de serotonina (por ejemplo dexfenfluramina), compuestos mixtos de serotonina y sustancias noradrenérgicas (por ejemplo solicitud WO 10 00/71549), agonistas de 5HT, por ejemplo 1-(3-etil-benzofuran-7-il)- piperazina sal de ácido oxálico (solicitud WO 01/09111), agonistas de bombesina, antagonistas de galanina, hormona de crecimiento (por ejemplo hormona de crecimiento humana), compuestos que liberan la hormona de crecimiento (6-benciloxi-1-(2-diisopropilamino-etilcarbamoil)-3,4-dihidro-1H-isoquinolina-2- ácido carboxílico- terc.- butil éster (solicitud WO 01/85695)), agonistas de TRH (véase por ejemplo la solicitud EP 0 462 884), moduladores de proteína desacoplante 2- ó 3, agonistas de leptina (véase por ejemplo Lee, Daniel W.; Leinung, Matthew C.; Rozhavskaya- Arena, Marina; Grasso, Patricia. *Leptin agonists as a potential approach to the treatment of obesity*, *Drugs of the Future* (2001), 26 (9), 873-881), agonistas de DA (bromocriptina, doprexina), inhibidores de lipasa/ amilasa (por ejemplo solicitud WO 00/40569), moduladores de PPAR (véase por ejemplo la solicitud WO 00/78312), moduladores de RXR o agonistas de TR-  $\beta$ .

En una forma de ejecución de la invención, el otro componente activo consiste en leptina; véase por ejemplo "Perspectives in the therapeutic use of leptin", Salvador, Javier; Gomez Ambrosi, Javier; Fruhbeck, Gema, *Expert Opinion on Pharmacotherapy* (2001), 2(10), 1615-1622.

En una forma de ejecución el otro componente activo consiste en dexanfetamina o anfetamina.

30 En una forma de ejecución el otro componente activo consiste en fenfluramina o dexfenfluramina.

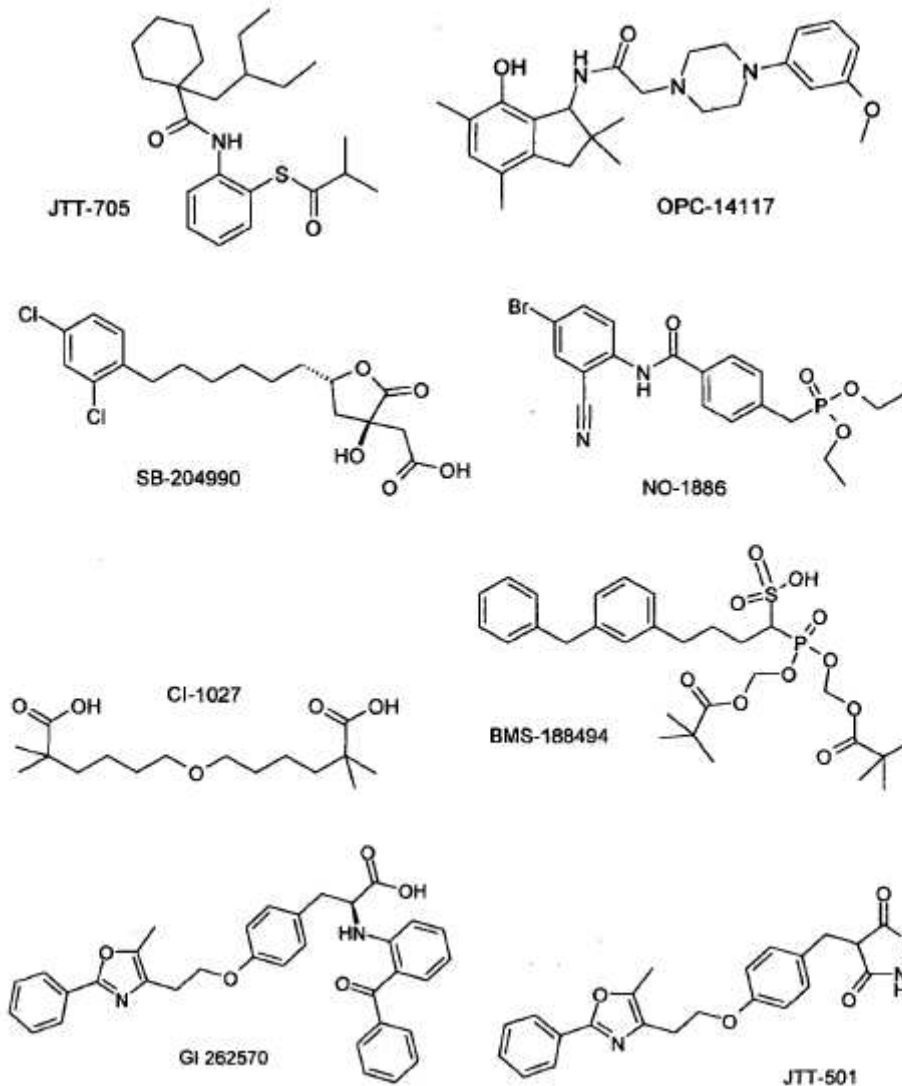
En otra forma de ejecución el otro componente activo consiste en sibutramina.

En una forma de ejecución el otro componente activo consiste en orlistat.

En una forma de ejecución el otro componente activo consiste en mazindol o fentermina.

35 En una forma de ejecución, los compuestos de la fórmula I se administran en combinación con fibras alimentarias, preferentemente fibras alimentarias insolubles (véase por ejemplo Carob/ Caromax<sup>®</sup> (Zunft H J; y otros, *Carob pulp preparation for treatment of hypercholesterolemia*, *ADVANCES IN THERAPY* (2001 Sep-Oct), 18(5), 230-6.) Caromax es un producto que contiene algarrobo (*Ceratonia siliqua*), de la empresa Nutrinova, Nutrition Specialties & Food Ingredients GmbH, Industriepark Höchst, 65926 Frankfurt / Main). La combinación con Caromax<sup>®</sup> puede tener lugar en una preparación o mediante la toma separada de compuestos de la fórmula I y Caromax<sup>®</sup>. Caromax<sup>®</sup> puede administrarse también en forma de alimentos, como por ejemplo en galletas o barras de cereal.

40 Se entiende que todas las combinaciones adecuadas de los compuestos acordes a la invención con uno o varios de los compuestos mencionados anteriormente y de forma opcional con una o varias de las otras sustancias farmacológicamente activas se encuentran contempladas dentro del ámbito de protección de la presente invención.



Es objeto de la presente invención también un conjunto (kit) compuesto por envolturas separadas de

(a) una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I y/o de sus solvatos, sales y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción,

5 y

(b) una cantidad efectiva de otro componente activo del medicamento.

El conjunto comprende recipientes adecuados, como cajas o cajas de cartón, botellas individuales, bolsas o ampollas. El conjunto puede por ejemplo comprender ampollas separadas en las cuales respectivamente se encuentra presente, disuelta o de forma liofilizada, una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I y/o sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción, y una cantidad efectiva de otro componente activo del medicamento.

Los compuestos pueden ser probados en cuanto a sus propiedades inhibitorias mediante células BHK que expresan SGLT1 y SGLT2. La producción de las células y el ensayo pueden realizarse del modo que se describe a continuación:

15 Construcción y expresión de SGLT1 en células BHK

Para construir el vector de expresión SGLT1 (KL225), el gen SLC5A1 (homólogo a NM\_000343) de un banco de cADN fue amplificado mediante tecnología PCR estándar y clonado en el vector de expresión pcDNA3.1 (gen in vitro) mediante los sitios NheI/XhoI, donde dicho vector contenía neomicina como marcador de selección. En el caso de este vector, la transcripción utiliza el potenciador/promotor del citomegalovirus en los seres humanos.

- 5 El vector KL225 ya listo fue introducido en células junto con un vector adicional que contenía un gen de dihidrofolato reductasa como marcador de selección. La transfección en células BHK21 (ATCC CCL-10), cultivadas en un medio DMEM (GIBCO/ BRL), enriquecidas con 10% de suero bovino fetal (FCS) y 20 mM de glutamina, fue efectuada con transfecciones de fosfato de calcio conforme a Graham, F.L. y van der Ebb, A.J. (1973), *Virology* 52: 456 con 5 - 20 µg de plasmidas no cortadas para  $10^7$  células. Los transfectantes estables fueron seleccionados en el medio que  
10 contenía 1 mg/ml G418 de (GIBCO/BRL) y 20 - 5000 nM de metotrexato como concentración final, donde sólo pudieron crecer las células que expresaban el gen de neomicina y sobreexpresaban el gen dhfr. Después de 2-3 semanas de crecimiento las células fueron clonadas (0,5 células/cavidad) y los clones se analizaron en cuanto a la expresión de SGLT en pruebas de absorción de radioactividad.

#### Construcción y expresión de SGLT2 en células BHK

- 15 Para construir el vector de expresión SGLT2 (KL224), el gen SLC5A2 (homólogo a NM\_003041) de un banco de cADN fue amplificado mediante tecnología PCR estándar y fue clonado en el vector de expresión PCI-neo (promega) mediante los sitios NheI/XhoI, donde dicho vector contenía neomicina como marcador de selección. En este vector, la transcripción utiliza el potenciador/promotor del citomegalovirus en los seres humanos y la señalización de poliadenilación de SV40.
- 20 El vector KL224 ya listo fue introducido en células junto con un vector adicional que contenía un gen de dihidrofolato reductasa como marcador de selección. La transfección en células BHK21 (ATCC CCL-10), cultivadas en un medio DMEM (GIBCO/ BRL), enriquecidas con 10% de suero bovino fetal (FCS) y 20 mM de glutamina, fue efectuada con transfecciones de fosfato de calcio conforme a Graham, F.L. y van der Ebb, A.J. (1973), *Virology* 52: 456 con 5 - 20 µg de plasmidas no cortadas para  $10^7$  células. Los transfectantes estables fueron seleccionados en el medio que  
25 contenía 1 mg/ml G418 de (GIBCO/BRL) y 20 - 5000 nM de metotrexato como concentración final, donde sólo pudieron crecer las células que expresaban el gen de neomicina y sobreexpresaban el gen dhfr. Después de 2-3 semanas de crecimiento las células fueron clonadas (0,5 células/cavidad) y los clones se analizaron en cuanto a la expresión de SGLT en pruebas de absorción de radioactividad.

#### Procedimiento para medir la actividad de SGLT1/2

- 30 En principio se describió la absorción de  $^{14}\text{C}$ - $\alpha$ - metil- D- glucopiranosida (AMG), por ejemplo en oocitos de xenopus, a los que se inyectó el cARN correspondiente (por ejemplo véase Wen- Sen Lee y otros (1994), *J. Biol. Chem.* 269, 12032- 12039; Guofeng You y otros (1995), *J. Biol. Chem.* 270, 29365 -29371).

35 Se desarrollo una prueba a base de células, efectuada en 96 cavidades y se adaptó a las exigencias de HTS: las células BHK (transfectadas con SGLT1 o SGLT2) fueron inoculadas en placas de microtitulación con 96 cavidades (placas de cultivo, Perkin Elmer). Después de por lo menos 24 horas se retiró el medio y la capa de células fue lavada con tampones químicos de prueba (140 mM NaCl, 2 mM KCl, 1 mM  $\text{CaCl}_2$ , 1 mM  $\text{MgCl}_2$ , 10 mM HEPES, 5 mM Tris, con 1 M KOH, regulado a un valor de pH de 7,4). Después de agregar 40 µl de tampón químico de prueba de 50 µl AMG (50 µM para SGLT1, así como 2 mM para SGLT2) en presencia o en ausencia de compuestos, las células se incubaron en un volumen total de 100 µl a 37°C durante 90 min. El líquido sobrenadante fue succionado y  
40 desechado. Las células se lavaron y lisaron a través de la adición de 50 µl de agua. Después de 10 min a temperatura ambiente se agregaron 200 µl de Micsrosocint 40 (Perkin Elmer). La radioactividad se contó en un topcount de contador de centello de microplacas (Perkin Elmer). La absorción no específica se determinó en un tampón químico de prueba libre de sodio (266 mM de sacarosa, 2 mM de KCl, 1 mM de  $\text{CaCl}_2$ , 1 mM de  $\text{MgCl}_2$ , 10 mM de HEPES, 5 mM de Tris, con 1 M de KOH, regulado a un valor de pH de 7,4).

- 45 Todas las temperaturas, mencionadas anterior y posteriormente, se indican en °C. En los siguientes ejemplos, "procesamiento habitual" significa: En caso necesario se agrega agua; en caso necesario, de acuerdo con la constitución del producto final, se regulan los valores del pH entre 2 y 10; se extrae con acetato de etilo o diclorometano, se separa, se seca la fase orgánica mediante sulfato sódico, se evapora y se limpia a través de cromatografía en gel de sílice y/o a través de cristalización. Valores Rf en el gel de sílice; eluyente: acetato de etilo/metanol 9:1.  
50

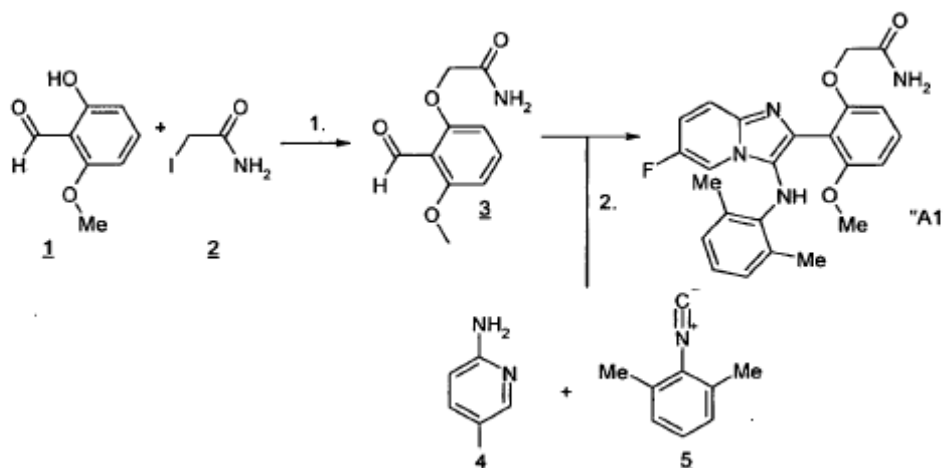
Espectrometría de masas (MS): El (choque de electrones- ionización)  $\text{M}^+$

FAB (bombardeo con átomos rápidos)  $(\text{M}+\text{H})^+$

ESI (ionización por electroespray)  $(\text{M}+\text{H})^+$  (si no se indica otra cosa)

**Ejemplo 1**

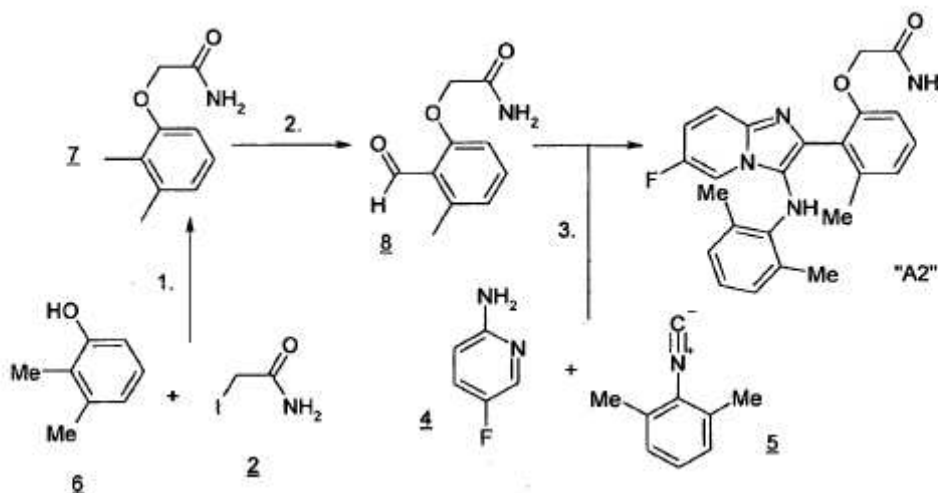
La producción de 2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina ("A1") se efectúa de forma análoga al siguiente esquema:



- 5 1.1 1,0 g (6,57 mmol) de 2-hidroxi-6-metoxibenzaldehído 1 se disuelven en 30 mL de DMF, bajo refrigeración se mezclan cuidadosamente con 0,29 g de NaH (suspensión al 60 % en peso en aceite parafínico) y se agita 45 minutos a temperatura ambiente. A continuación se agregan 1,34 g de 2- yodoacetamida 2 y la mezcla de reacción se agita durante la noche. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 0,81 g (59%) de 2-(2-formil-3-metoxi-fenoxi)-acetamida 3 como sustancia sólida. MS-EI (M<sup>+</sup>) = 209.
- 10 1.2 De forma análoga a H. Bienaymé y otros, Angew. Chem. 1998, 100,2349: Bajo gas inerte, a temperatura ambiente, 0,207 g de 2-amino-5-fluoropiridina 4 y 0,33 g de aldehído 3 se disuelven de forma consecutiva en 30 mL de etanol. A continuación se agregan 0,24 g de 2,6-dimetilfenilisocianida 5, se añaden a modo de goteo 0,075 mL de ácido perclórico al 70 % en peso y se agita otras 20 horas a temperatura ambiente. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 0,42 g (55%) de "A1"; F. 103-104°; MS-EI (M<sup>+</sup>) = 434.
- 15 <sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8,09 (1H, dd, J = 2,4 y 4,3 Hz), 8,03 (N-H, s), 7,51 (1H, dd, J = 5,1 y 9,7 Hz), 7,38 (N-H, s), 7,26 (1H, ddd, J = 2,4, 8,5 y 9,7 Hz), 7,15 (1 H, t, J = 8,4 Hz), 6,73 (2H, d, J = 7,4 Hz), 6,65 (N-H, s), 6,58 (1H, t, J = 7,4 Hz), 6,55 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,48 (1H, d, J = 8,4 Hz), 4,36 (2H, s), 3,57 (3H, s), 1,85 (6H, s).

**Ejemplo 2**

- 20 La producción de 2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina ("A2") se efectúa de forma análoga al siguiente esquema:





2.1 19,95 g de 2,3-dimetilfenol **6** se disuelven en 250 mL de DMF, bajo refrigeración se mezclan cuidadosamente con 6,4 g de NaH (suspensión al 60 % en peso en aceite parafínico) y se agita 45 minutos a temperatura ambiente. A continuación se agregan 31,4 g de 2- yodoacetamida **2** y la mezcla de reacción se agita durante la noche. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 23,8 g (83%) de 2-(2,3-dimetil-fenoxi)-acetamida **7**; MS-EI ( $M^+$ ) = 179.

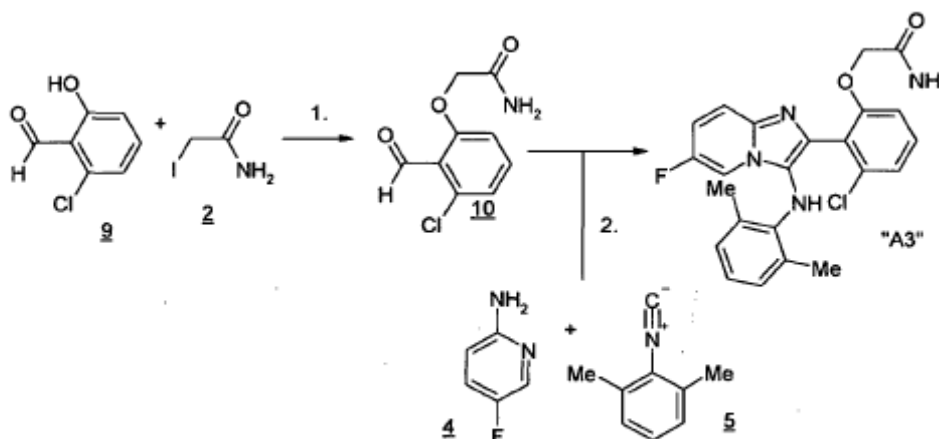
2.2 De forma análoga a FM Hauser y SR Ellenberger Synthesis 1987, 723: 12,0 g de **7**; 50,82 g de peroxodisulfato de potasio y 17,05 g de sulfato de cobre(II)-pentahidrato se disuelven en una mezcla de disolventes de 250 mL de MeCN y 250 mL de agua, y a continuación se agita 2 horas bajo reflujo. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 1,38 g (11%) de 2-(2-formil-3-metil-fenoxi)-acetamida **8**; MS-EI ( $M^+$ ) = 193.

2.3 Bajo gas inerte, a temperatura ambiente, 0,095 g de 2-amino-5-fluoropiridina **4** y 0,14 g de aldehído **8** se disuelven de forma consecutiva en 30 mL de etanol. A continuación se agregan 0,11 g de 2,6-dimetilfenilisocianida **5**, se añaden a modo de goteo 34,43  $\mu$ L de ácido perclórico al 70 % en peso y se agita otras 20 horas a temperatura ambiente. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 0,084g (25%) de "A2"; F. 198 - 199°; MS-EI ( $M^+$ ) = 418.

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  7,74 (1H, dd, J = 2,4 y 4,1 Hz), 7,58 (1H, dd, J = 5,1 y 9,7 Hz), 7,47 (N-H, s), 7,42 (N-H, s), 7,23 (1H, ddd, J = 2,4, 8,5 y 9,7 Hz), 7,16 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,00 (N-H, s), 6,83 (1 H, d, J = 7,5 Hz), 6,82 (2H, d, J = 7,4 Hz), 6,69 (1 H, t, J = 7,4 Hz), 6,68 (1 H, d, J = 7,5 Hz), 4,38 (2H, s), 2,12 (3H, s), 1,84 (6H, s).

### Ejemplo 3

La producción de 2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina ("A3") se efectúa de forma análoga al siguiente esquema:



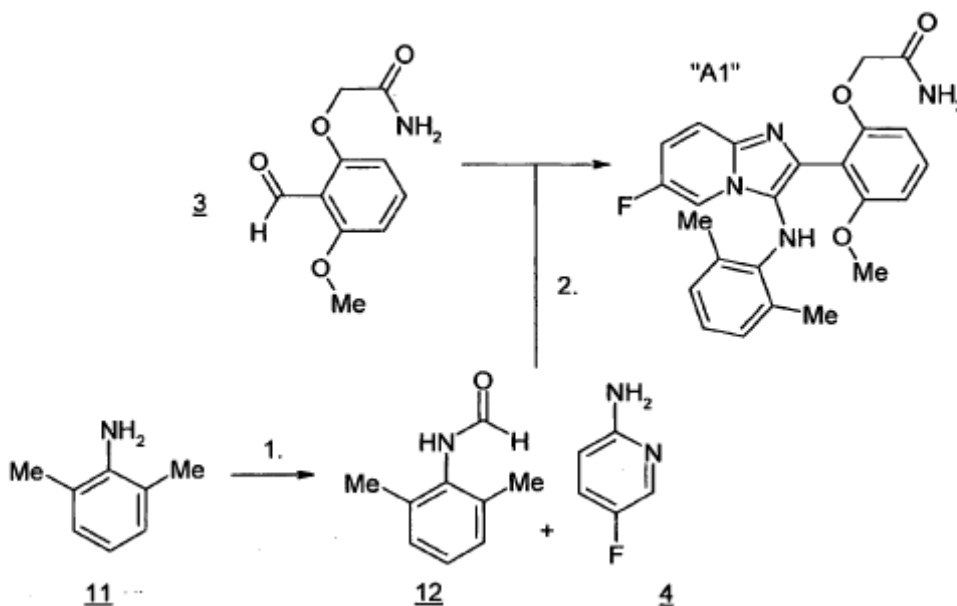
3.1 1,0 g de 6-clorosalicilaldehído **9** se disuelven en 30 mL de DMF, bajo refrigeración se mezclan cuidadosamente con 0,26 g de NaH (suspensión al 60 % en peso en aceite parafínico) y se agita 45 minutos a temperatura ambiente. A continuación se agregan 1,30 g de 2- yodoacetamida **2** y la mezcla de reacción se agita durante la noche. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 1,28 g (90%) de 2-(3-cloro-2-formil-fenoxi)-acetamida **10**; MS-EI ( $M^+$ ) = 213.

3.2 Bajo gas inerte, a temperatura ambiente, 0,177g de 2-amino-5-fluoropiridina **4** y 0,288 g de aldehído **10** se disuelven de forma consecutiva en 30 mL de etanol. A continuación se agregan 0,205 g de 2,6-dimetilfenilisocianida **5**, se añaden a modo de goteo 64,1  $\mu$ L de ácido perclórico al 70 % en peso y se agita otras 20 horas a temperatura ambiente. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 0,286g (43%) de "A3"; F. 186 - 187°; MS-EI ( $M^+$ ) = 438.

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8,05 (1H, dd, J = 2,4 y 4,1 Hz), 7,58 (1H, dd, J = 5,1 y 9,7 Hz), 7,48 (N-H, s), 7,42 (N-H, s), 7,29 (1 H, ddd, J = 2,4, 8,5 y 9,7 Hz), 7,21 (1 H, t, J = 8,2 Hz), 7,00 (1 H, d, J = 8,2 Hz), 6,91 (N-H, s), 6,81 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,75 (2H, d, J = 7,4 Hz), 6,62 (1H, t, J = 7,4 Hz), 4,41 (1H, d, J = 15,1 Hz), 4,31 (1H, d, J = 15,1 Hz), 1,87 (6H, s).

**Ejemplo 4**

Producción alternativa de 2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina ("A1"):



5 4.1 10,0 g de acetato de sodio se disuelven en 120 mL de ácido fórmico. A continuación se introducen 50,0 g de 2,6-dimetilanilina **11** y se agita 24 horas bajo reflujo. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 48,9 g (79%) de N-(2,6-dimetil-fenil)-formamida **12**; MS-EI ( $M^+$ ) = 149.

10 4.2 Bajo refrigeración con hielo y gas inerte, 0,149 g de **12**; 0,112g de 2-amino-5-fluoropiridina **4**; 0,209 g de 2-(2-formil-3-metoxi-fenoxi)-acetamida **3** y 0,286 mL de trietilamina se colocan de forma consecutiva en un matraz, y a modo de goteo se agregan 2,5 mL de T3P® [= anhídrido de ácido propilfosfónico (solución al 50 % en peso en acetato de etilo)]. La mezcla de reacción se agita durante 7 horas a 100°C. Seguidamente se procesa del modo habitual y se obtienen 0,2 g de (40%) "A1".

De forma análoga al ejemplo 1, 2 ó 3 se obtienen los siguientes compuestos

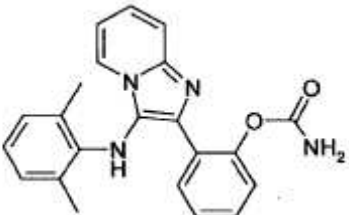
Nº	Nombre y/o estructura	MSEI ( $M^+$ )
"A4"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	386
"A5"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	426
"A6"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	406
"A7"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-isopropil-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	414
"A8"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-metil-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A9"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A10"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina	420
"A11"	2-[2-(aminocarbonyl-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina	440
"A12"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-cloro-imidazo[1,2-a]piridina	420
"A13"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-etil-imidazo[1,2-a]piridina	414

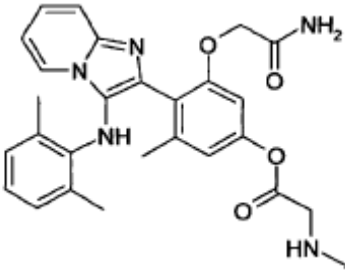
ES 2 529 691 T3

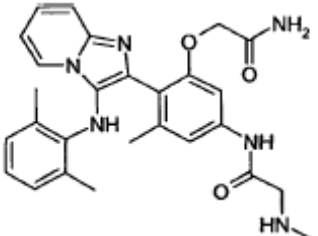
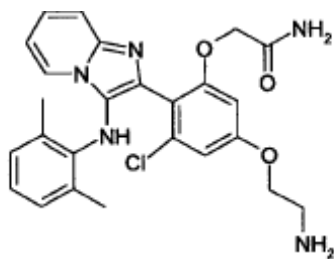
Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>3</sup> )
"A14"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	416
"A15"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2-cloro-6-metilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	436
"A16"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	456
"A17"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A18"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-metoxifenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	416
"A19"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A20"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A21"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	420
"A22"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	416
"A23"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2-cloro-6-metilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	436
"A24"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	456
"A25"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	404
"A26"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluorimidazo[1,2-a]piridina	404
"A27"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	404
"A28"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	404
"A29"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluorimidazo[1,2-a]piridina	404
"A30"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	422
"A31"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	404
"A32"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	404
"A33"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	422
"A34"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	422
"A35"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluorimidazo[1,2-a]piridina	422
"A36"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxifenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluorimidazo[1,2-a]piridina	434
"A37"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	452
"A38"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	400

ES 2 529 691 T3

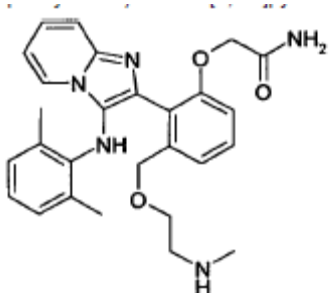
Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>3</sup> )
"A39"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2-etil-6-metilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	430
"A40"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dietil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	414
"A41"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxifenil]-3-(2,6-dietil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	444
"A42"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	400
"A43"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	418
"A44"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-5-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	418
"A45"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	448
"A46"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	440
"A47"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	404
"A48"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluorimidazo[1,2-a]piridina	434
"A49"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	422
"A50"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	418
"A51"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	436
"A52"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluorimidazo[1,2-a]piridina	418
"A53"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	436
"A54"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	420
"A55"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	432
"A56"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	438
"A57"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A58"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A59"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A60"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A67"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A68"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A69"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A70"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A71"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A72"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A73"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A74"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A75"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A76"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A77"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A78"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A79"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A80"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A81"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A82"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A83"	2-[2-(aminocarbonil-oxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A84"	2-[2-(aminocarbonil-oximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A87"	2-[2-[2-(aminocarbonil)-etoxi]-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A88"	2-[2-(aminocarbonil-oxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>3</sup> )
"A89"	2-[2-(aminocarbonil-oximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A92"	2-[2-[2-(aminocarbonil)-etoxi]-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A93"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A94"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A95"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A96"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A97"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A98"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A99"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A100"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A101"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A102"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A103"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A104"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	

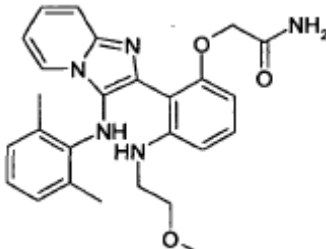
Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>†</sup> )
"A105"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A106"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A107"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A108"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A109"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A110"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A111"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A112"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A113"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A114"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A115"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A116"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A117"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M*)
"A118"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A119"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A120"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A121"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A122"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A123"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A124"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A125"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A126"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-carboxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A127"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroximetil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A128"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A129"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A130"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A131"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-carboxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A132"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroximetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A133"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A134"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	

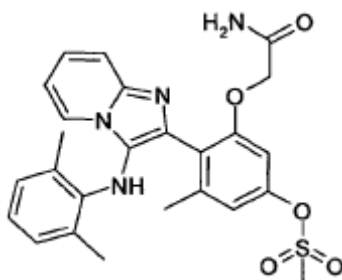


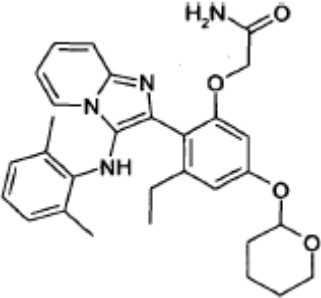
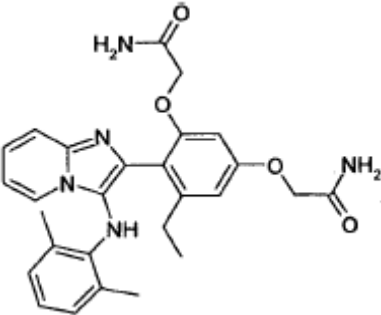
ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A135"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A136"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A137"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A138"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina  	
"A139"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A140"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A141"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A142"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A143"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A144"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A145"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A146"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A147"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A148"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A149"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A150"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	

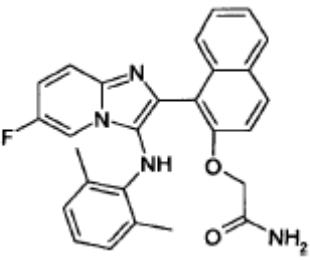
ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A151"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A152"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A153"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A154"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A155"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A156"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A157"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A158"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A159"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A160"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A161"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A162"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A163"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A164"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A165"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metilsulfoniloxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	



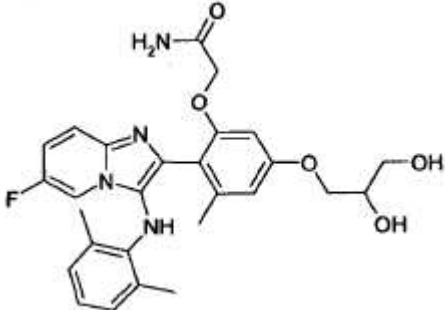
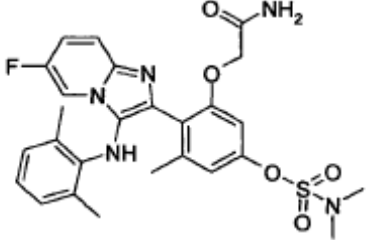
Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A166"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidro-piran-2-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A167"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 	
"A168"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A169"	2-(2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil)-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A170"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A171"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A172"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A173"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-benciloxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A174"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-metil-6-etil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A175"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A176"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A177"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidro-piran-2-iloxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>*</sup> )
"A178"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A179"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A180"	2-{1-[3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-naftalen-2-iloxi}-acetamida	
"A181"	2-{1-[3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-naftalen-2-iloxi}-acetamida	
"A182"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidro-piran-2-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A183"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-(metoxicarbonilmetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A184"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metoxi-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A185"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A186"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-hidroxi-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A187"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metoxi-etoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A188"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3,4-dimetoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A189"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,5-dimetoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A190"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-oxo-[1,3]dioxolan-4-iloxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina	
"A191"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-amino-imidazo[1,2-a]piridina	
"A192"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-amino-imidazo[1,2-a]piridina	
"A193"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-hidroxi-imidazo[1,2-a]piridina	
"A194"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-hidroxi-imidazo[1,2-a]piridina	

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A195"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-hidroxi-etoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A196"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-etoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A197"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A198"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-oxo-[1,3]dioxolan-4-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A199"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A200"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluorfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A201"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3,4-dimetoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A202"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A203"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluorfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A204"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A205"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A206"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-metilimidazo[1,2-a]piridina	
"A207"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-aminoimidazo[1,2-a]piridina	

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A208"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina 	
"A209"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-ciano-imidazo[1,2-a]piridina	
"A210"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-7-ciano-imidazo[1,2-a]piridina	
"A211"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxifenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A212"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A213"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-dimetilsulfamoiloxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina 	
"A214"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metoxi-6-metilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A215"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-metoxi-6-metilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A216"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A217"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(3-cloro-2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A218"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(3-cloro-2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A219"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A220"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M*)
"A221"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A222"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(4-cloro-2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A223"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-carboxiimidazo[1,2-a]piridina	
"A224"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(4-fluor-2,6-diclorofenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina	
"A225"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(4-fluor-2,6-dicloro-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A226"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A227"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-amino-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A228"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-dimetilsulfamoiloxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A229"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A230"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A231"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A232"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-nitro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A233"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A234"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluorfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A235"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A236"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-trifluormetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A237"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A238"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A239"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-4-metilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura	MSEI (M <sup>+</sup> )
"A240"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A241"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A242"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-trifluormetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A243"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-bromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A244"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4,6-trifluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A245"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-metoxicarbonilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A246"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-metoxicarbonilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A247"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-metil-6-trifluormetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A248"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-cloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A249"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,5-dimetil-4,6-dibromofenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A250"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4-dimetil-6-nitrofenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A251"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluorfenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A252"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-difluor-4-bromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A253"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A254"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-nitrofenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A255"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A256"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	
"A257"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina	



Datos farmacológicos

Afinidad con respecto a receptores

Tabla 1

Nº del compuesto	SGLT <sub>1</sub> -IC <sub>50</sub>	SGLT <sub>2</sub> -IC <sub>50</sub>
"A1"	B	A
"A2"	B	A
"A3"	B	A
"A4"	C	A
"A5"	C	A
"A6"	C	A
"A7"	C	B
"A8"	C	B
"A9"	C	A
"A10"	B	A
"A11"	B	A
"A12"		B
"A13"	B	A
"A14"	C	A
"A15"	B	A
"A16"	B	A
"A17"	C	A
"A165"	C	A
"A166"	C	A
"A167"	C	A
"A168"	C	A
"A169"	B	A
"A170"	B	A
"A171"	C	A
"A172"	C	A
"A173"	C	C

ES 2 529 691 T3

Nº del compuesto	SGLT <sub>1</sub> -IC <sub>50</sub>	SGLT <sub>2</sub> -IC <sub>50</sub>
"A174"	C	A
"A175"	C	A
"A176"	C	B
"A119"	---	B
"A177"	C	A
"A102"	B	A
"A178"	C	A
"A179"	C	A
"A180"	B	A
"A181"	B	A
"A182"	C	A
"A183"	C	B
"A184"	C	A
"A185"	B	A
"A186"	C	A
"A187"	C	a
"A188"	C	B
"A189"	---	B
"A190"	C	A
"A191"	C	A
"A192"	C	A
"A193"	---	B
"A194"	C	B
"A195"	C	A
"A196"	C	A
"A197"	C	A
"A198"	B	A
"A199"	C	A

ES 2 529 691 T3

Nº del compuesto	SGLT <sub>1</sub> -IC <sub>50</sub>	SGLT <sub>2</sub> -IC <sub>50</sub>
"A200"	C	A
"A201"	C	B
"A202"	B	A
"A203"	B	A
"A204"	B	A
"A205"	B	A
"A206"	C	A
"A207"	C	A
"A208"	C	A
"A209"	C	B
"A210"	C	C
"A211"	C	A
"A212"	C	A
"A213"	C	A
"A214"	C	A
"A215"	C	A
"A216"	C	A
"A217"	B	A
"A218"	B	A
"A219"	B	A
"A202"	B	A
"A221"	B	A
"A222"	B	A
"A223"	---	B
"A224"	B	A
"A225"	B	A
"A226"	B	A
"A227"	B	A

ES 2 529 691 T3

Nº del compuesto	SGLT <sub>1</sub> -IC <sub>50</sub>	SGLT <sub>2</sub> -IC <sub>50</sub>
"A228"	C	A
"A229"	C	B
"A230"	C	A
"A231"	B	A
"A232"	B	A
"A233"	C	A
"A234"	B	A
"A235"	B	A
"A236"	B	A
"A237"	B	A
"A238"	B	A
"A239"	A	A
"A240"	B	A
"A241"	A	A
"A242"	B	A
"A243"	B	A
"A244"	B	A
"A245"	C	B
"A246"	C	B
"A247"	C	A
"A248"	C	A
"A249"	B	B
"A250"	C	A
"A251"	B	A
"A252"	B	B
"A253"		
"A254"	C	C
"A255"	B	B

Nº del compuesto	SGLT <sub>1</sub> -IC <sub>50</sub>	SGLT <sub>2</sub> -IC <sub>50</sub>
"A256"	B	B
"A257"	B	B

IC<sub>50</sub>: 10 nM - 1 µM = A

1 µM - 10 µM = B

> 10 µM = C

- 5 Los siguientes ejemplos hacen referencia a preparaciones farmacéuticas:

**Ejemplo A: Viales para inyección**

10 Una solución de 100 g de un componente activo de la fórmula I y 5 g de fosfato disódico hidrogenado es estandarizada en 3 l de agua doblemente destilada con 2 n de ácido clorhídrico a un pH de 6,5; es filtrada de forma estéril, vertida en viales para inyección, liofilizada bajo condiciones estériles, donde dichos viales se cierran de forma estéril. Cada vial para inyección contiene 5 mg de componente activo.

**Ejemplo B: Supositorios**

Una mezcla de 20 g de un componente activo de la fórmula I se funde con 100 g de lecitina de soja y 1400 g de manteca de cacao, se vierte en moldes y se deja enfriar. Cada supositorio contiene 20 mg de componente activo.

**Ejemplo C: Solución**

15 Se prepara una solución a partir de 1 g de un componente activo de la fórmula I, 9,38 g de NaH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>, 2 H<sub>2</sub>O, 28,48 g de Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>, 12 H<sub>2</sub>O y 0,1 g de cloruro de benzalconio en 940 ml de agua doblemente destilada. Se regula a un pH de 6,8; se completa 1 litro y se esteriliza a través de radiación. Esta solución puede utilizarse en forma de gotas oftálmicas.

**Ejemplo D: Pomada**

20 Se mezclan 500 mg de un componente activo de la fórmula I con 99,5 g de vaselina, en condiciones asépticas.

**Ejemplo E: Comprimidos**

Una mezcla de 1 kg de componente activo de la fórmula I, 4 kg de lactosa, 1,2 kg de almidón de patata, 0,2 kg de talco y 0,1 kg de estearato de magnesio es comprimida del modo habitual para formar comprimidos, de manera que cada uno de los comprimidos contenga 10 mg de componente activo.

25 **Ejemplo F: Grageas**

De forma análoga al ejemplo E, se forman comprimidos que a continuación, del modo habitual, son recubiertos con una capa de sacarosa, almidón de patata, talco, goma tragacanto y colorante.

**Ejemplo G: Cápsulas**

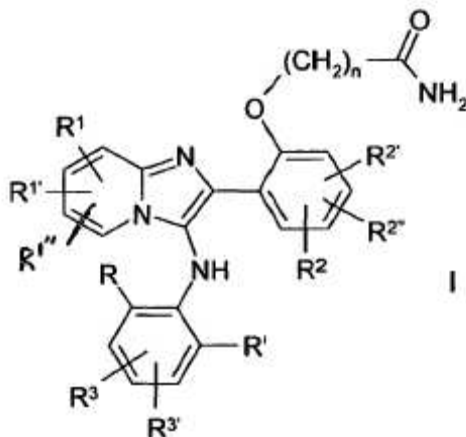
30 2 kg de componente activo de la fórmula I son llenados del modo habitual en cápsulas de gelatina dura, de manera que cada cápsula contenga 20 mg del componente activo.

**Ejemplo H: Ampollas**

Una solución de 1 kg de componente activo de la fórmula I es filtrada de forma estéril en 60 l de agua doblemente destilada, vertido en ampollas, donde éstas son liofilizadas bajo condiciones estériles y cerradas de forma estéril. Cada ampolla contiene 10 mg de componente activo.

## REIVINDICACIONES

## 1. Compuestos de la fórmula I



en donde

5 R, R', respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan A, OA, Hal, NO<sub>2</sub> o COOA,

R1, R1', respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H, A, F, Cl, NH<sub>2</sub>, OH, CN o COOA,

R1'' representa H o NH<sub>2</sub>,

10 R<sup>2</sup>, R<sup>2'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H, Hal, A, OH, OA, CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OR<sup>4</sup>, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, NH(C=O)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>4</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COOR<sup>4</sup>, OSO<sub>2</sub>A, OHet, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CONR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>Ar, O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH o OSO<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>4'</sup>,

R<sup>2</sup> y R<sup>2'</sup> representan de forma conjunta también -CH=CH-CH=CH-,

R<sup>2'</sup> representa H, A, Hal, OH u OA,

R<sup>3</sup>, R<sup>3'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan A, OA, Hal, NO<sub>2</sub> o COOA,

15 R<sup>4</sup>, R<sup>4'</sup>, respectivamente de forma independiente el uno del otro, representan H o A,

A representa alquilo no ramificado o ramificado con 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de C, en donde 1-5 átomos de H pueden ser reemplazados por F,

Het representa tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, dioxolanilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, los cuales también pueden ser mono-sustituídos por =O (oxígeno de carbonilo),

20 Ar representa fenilo,

Hal representa F, Cl, Br o I,

m representa 1, 2 ó 3,

n representa 0, 1 ó 2,

25 así como sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción.

2. Compuestos según la reivindicación 1, seleccionados del grupo

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A1"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A2"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A3"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A4"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A5"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A6"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A7"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-isopropil-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A8"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-metil-imidazo[1,2-a]piridina
"A9"	2-(2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil)-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina
"A10"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina
"A11"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-5-metil-imidazo[1,2-a]piridina
"A12"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-cloro-imidazo[1,2-a]piridina
"A13"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-etil-imidazo[1,2-a]piridina
"A14"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A15"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A16"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A17"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A18"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A19"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A20"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A21"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A22"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A23"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A24"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A25"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A26"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A27"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A28"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina

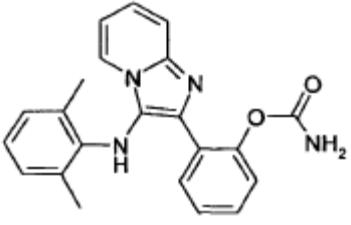
ES 2 529 691 T3

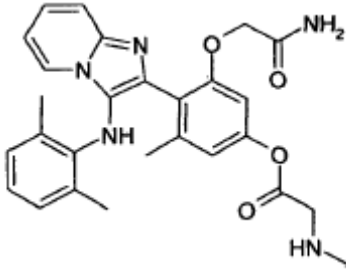
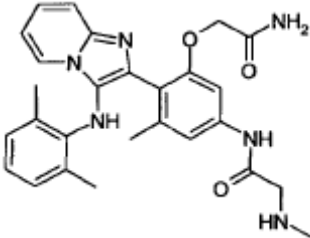
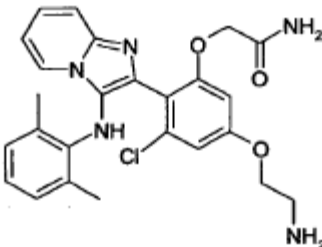
Nº	Nombre y/o estructura
"A29"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A30"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A31"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A32"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A33"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A34"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A35"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A36"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A37"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A38"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A39"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A40"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dietil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A41"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dietil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A42"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A43"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A44"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-5-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A45"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,4,6-trimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A46"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A47"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A48"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A49"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A50"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A51"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A52"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A53"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A54"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina



ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A55"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2-etil-6-metil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A56"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A57"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A58"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A59"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A60"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A67"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A68"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A69"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A70"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A71"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-fluor-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A72"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A73"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A74"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A75"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A76"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A77"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A78"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A79"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A80"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A81"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A82"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina

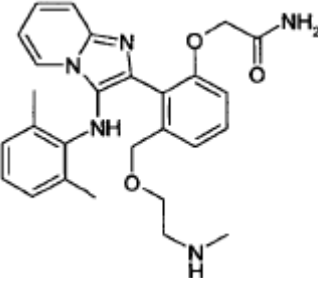
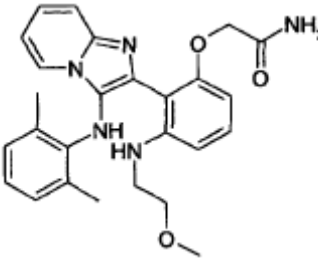
Nº	Nombre y/o estructura
"A83"	2-[2-(aminocarbonil-oxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A84"	2-[2-(aminocarbonil-oximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A87"	2-{2-[2-(aminocarbonil)-etoxi]-fenil}-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A88"	2-[2-(aminocarbonil-oxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A89"	2-[2-(aminocarbonil-oximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A92"	2-[2-[2-(aminocarbonil)-etoxi]-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A93"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A94"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A95"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A96"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A97"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A98"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A99"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-cloro-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A100"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A101"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A102"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-4-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina

Nº	Nombre y/o estructura
"A103"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A104"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A105"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A106"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A107"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A108"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A109"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A110"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-acetilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A111"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 

ES 2 529 691 T3

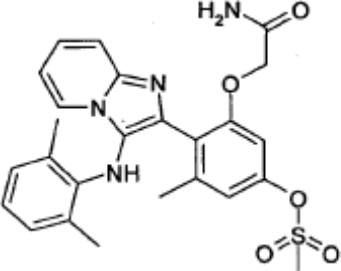
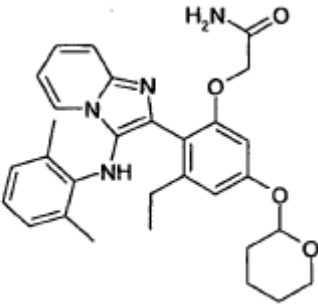
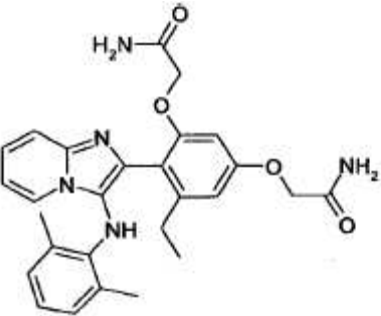
Nº	Nombre y/o estructura
"A112"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A113"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A114"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-chlor-phenyl]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6- fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A115"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)- 6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A116"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)- 6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A117"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)- imidazo[1,2-a]piridina
"A118"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A119"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A120"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6- fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A121"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)- 6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A122"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-dimetilamino-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)- 6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A123"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A124"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A125"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A126"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-carboxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A127"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroximetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2- a]piridina
"A128"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2- a]piridina
"A129"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2- a]piridina
"A130"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2- a]piridina
"A131"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-carboxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2- a]piridina
"A132"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroximetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2- a]piridina

ES 2 529 691 T3

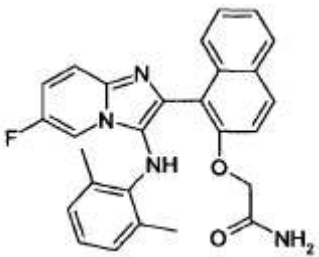
Nº	Nombre y/o estructura
"A133"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p> 
"A134"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina</p>
"A135"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoximetil)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina</p>
"A136"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p>
"A137"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p>
"A138"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p> 
"A139"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p>
"A140"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p>
"A141"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina</p>
"A142"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina</p>
"A143"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina</p>
"A144"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina</p>
"A145"	<p>2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina</p>

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A146"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A147"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-amino-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A148"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metoxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A149"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A150"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-amino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A151"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-metilamino-etilamino)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A152"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A153"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A154"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-bromo-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A155"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-amino-etoxi)-6-ciano-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A156"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A157"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A158"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A159"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A160"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A161"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A162"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A163"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A164"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-propil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina

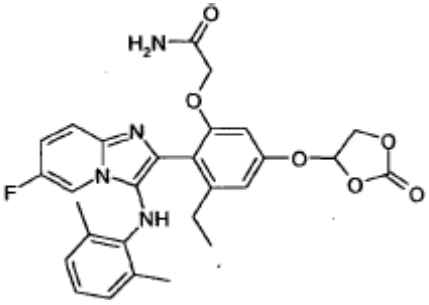
Nº	Nombre y/o estructura
"A165"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metilsulfonilo-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A166"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidropiran-2-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A167"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina 
"A168"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A169"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,6-dimetil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A170"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A171"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-hidroxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A172"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A173"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-benciloxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina

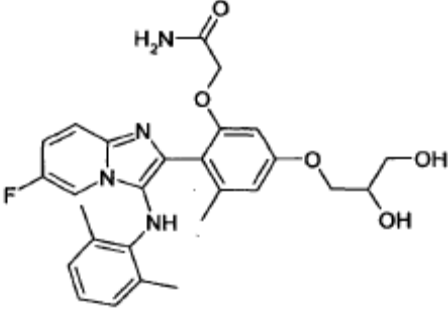
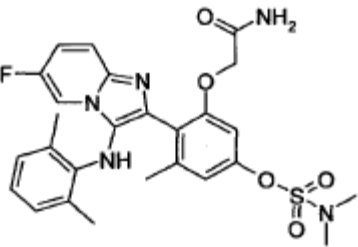
ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A174"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2-metil-6-etil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A175"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A176"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-hidroxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A177"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidro-piran-2-iloxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A178"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A179"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-nitro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A180"	2-{1-[3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-naftalen-2-iloxi}-acetamida
	
"A181"	2-{1-[3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-naftalen-2-iloxi}-acetamida
"A182"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(tetrahidro-piran-2-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A183"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-(metoxicarbonilmetil)-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A184"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metoxi-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A185"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A186"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-hidroxi-etoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A187"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-metoxi-etoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A188"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3,4-dimetoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A189"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4,5-dimetoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A190"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-oxo-[1,3]dioxolan-4-iloxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluor-imidazo[1,2-a]piridina
"A191"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-aminoimidazo[1,2-a]piridina



ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A192"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-aminoimidazo[1,2-a]piridina
"A193"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-hidroimidazo[1,2-a]piridina
"A194"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-8-hidroimidazo[1,2-a]piridina
"A195"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-hidroxi-etoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A196"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-etoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A197"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-cloro-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A198"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2-oxo-[1,3]dioxolan-4-iloxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina 
"A199"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A200"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A201"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-3,4-dimetoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A202"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A203"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluorfenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A204"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A205"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A206"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-metilimidazo[1,2-a]piridina
"A207"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-aminoimidazo[1,2-a]piridina

Nº	Nombre y/o estructura
"A208"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina 
"A209"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-cianoimidazo[1,2-a]piridina
"A210"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-7-cianoimidazo[1,2-a]piridina
"A211"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A212"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A213"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-dimetilsulfamoiloxi-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina 
"A214"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metoxi-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A215"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-metoxi-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A216"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A217"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(3-cloro-2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A218"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(3-cloro-2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A219"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A220"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina

ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A221"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A222"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(4-cloro-2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A223"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-carboxiimidazo[1,2-a]piridina
"A224"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metilfenil]-3-(4-fluor-2,6-diclorofenilamino)-imidazo[1,2-a]piridina
"A225"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metilfenil]-3-(4-fluor-2,6-dicloro-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A226"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A227"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-5-amino-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A228"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-dimetilsulfamoiloxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A229"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4-difluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A230"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A231"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-5-cloro-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A232"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-nitro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A233"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A234"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A235"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A236"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-trifluormetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A237"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A238"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-4-fluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A239"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dibromo-4-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina

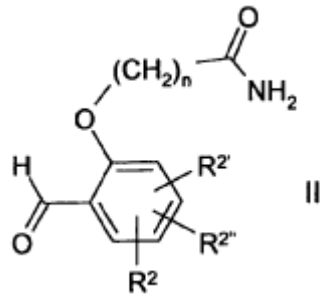
ES 2 529 691 T3

Nº	Nombre y/o estructura
"A240"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A241"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-etil-fenil]-3-(2,6-dicloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A242"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-trifluormetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A243"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-bromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A244"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4,6-trifluor-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A245"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-metoxicarbonilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A246"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-metil-6-metoxicarbonilfenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A247"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-metil-6-trifluormetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A248"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-fluor-6-cloro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A249"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,5-dimetil-4,6-dibromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A250"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,4-dimetil-6-nitro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A251"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A252"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-difluor-4-bromo-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A253"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A254"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-nitro-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A255"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2,6-dimetil-4-fluor-fenilamino)-6,8-difluorimidazo[1,2-a]piridina
"A256"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-metil-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina
"A257"	2-[2-(aminocarbonil-metoxi)-4-metoxi-6-etil-fenil]-3-(2-cloro-6-metil-fenilamino)-6-fluorimidazo[1,2-a]piridina

así como sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción.

5 3. Procedimiento para producir compuestos de la fórmula I según las reivindicaciones 1-2, así como sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, caracterizado por que

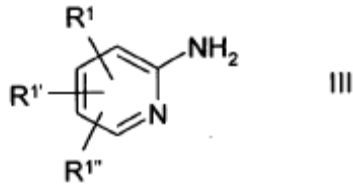
a) un compuesto de la fórmula II



en donde

$R^2$ ,  $R^{2'}$  y  $R^{2''}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

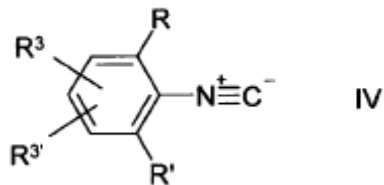
5 se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula III



en donde

$R^1$ ,  $R^{1'}$  y  $R^{1''}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

y se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula IV

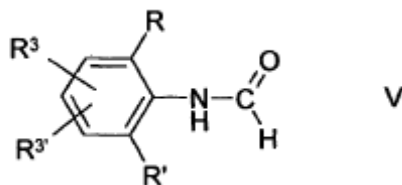


10

en donde  $R$ ,  $R'$ ,  $R^3$  y  $R^{3'}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

o

b) un compuesto de la fórmula II se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula III y con un compuesto de la fórmula V



15

en donde

$R$ ,  $R'$ ,  $R^3$  y  $R^{3'}$  representan lo indicado en la reivindicación 1,

y/o

una base o un ácido de la fórmula I es convertido en una de sus sales.

5 4. Medicamentos que contienen al menos un compuesto de la fórmula I según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2, y/o sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción, así como eventualmente vehículos y/o adyuvantes.

5. Medicamentos que contienen al menos un compuesto de la fórmula I según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2, y/o sus sales, solvatos y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción, y por lo menos otro componente activo del medicamento.

10 6. Utilización de compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 y/o sus sales y solvatos fisiológicamente aceptables para producir un medicamento para el tratamiento de la diabetes de tipo 1 y de tipo 2.

7. Utilización de compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 y/o sus sales y solvatos fisiológicamente aceptables para producir un medicamento para reducir el azúcar en la sangre.

15 8. Utilización de compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 y/o sus sales y solvatos fisiológicamente aceptables y de otro componente activo del medicamento para producir un medicamento para el tratamiento de la diabetes de tipo 1 y de tipo 2.

9. Conjunto (kit) compuesto por envolturas separadas de

(a) una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 y/o sus solvatos, sales y estereoisómeros que pueden utilizarse farmacéuticamente, incluyendo las mezclas de los mismos en cualquier proporción,

20 y

(b) una cantidad efectiva de otro componente activo del medicamento.

10. Utilización de compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 y/o sus sales y solvatos fisiológicamente aceptables y de otro componente activo del medicamento para producir un medicamento para reducir el azúcar en la sangre.