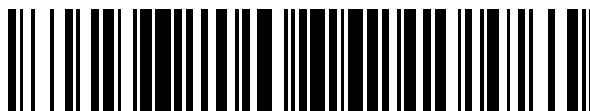


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 562 903**

51 Int. Cl.:

C07D 487/04 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 27/02 (2006.01)

C07D 495/14 (2006.01)

C07D 519/00 (2006.01)

A61K 31/5377 (2006.01)

A61K 31/551 (2006.01)

A61P 9/10 (2006.01)

A61P 43/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.07.2012 E 12811636 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.01.2016 EP 2733144**

54 Título: **Nuevo compuesto que tiene actividad inhibidora de PARP**

30 Prioridad:

13.07.2011 JP 2011154636

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

09.03.2016

73 Titular/es:

**SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD (100.0%)
9-19, Shimoshinjo 3-chome Higashiyodogawa-ku
Osaka-shi, Osaka 533-8651, JP**

72 Inventor/es:

**HONDA, TAKAHIRO;
ENOMOTO, HIROSHI;
KAWASHIMA, KENJI;
TAKAOKA, SHINJI;
FUJIOKA, YASUTAKA;
MATSUDA, MAMORU;
OHASHI, KOJI;
FUJITA, YUKIE;
HIRAI, SHIN-ICHIRO y
KURASHIMA, HIROAKI**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 562 903 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

Nuevo compuesto que tiene actividad inhibidora de PARP

La presente invención se refiere a un nuevo compuesto que tiene actividad inhibidora de PARP.

PARP (Poly ADP Ribose Polymerase) es una enzima que existe en núcleos de células de diversos órganos y se cree que está implicada en la reparación de la ruptura de la cadena del ADN. Como un compuesto que tiene actividad inhibidora de PARP (de ahora en más en la presente, también mencionado como "inhibidor de PARP"), se han mencionado para ello varios compuestos y, por ejemplo, en los documentos WO 02/48117 A (documento de patente 1), WO 03/055865 A (documento de patente 2) y WO 03/063874 A (documento de patente 3), se revelan varios compuestos, y se sugiere que estos compuestos tienen el potencial de volverse agentes terapéuticos para muchas enfermedades.

En los años recientes, los inhibidores de PARP atraen la atención como novedosos fármacos anticáncer y Annals of Oncology, 22, 268-279 (2011) (documento no patente 1) describe que varios inhibidores de PARP se encuentran en desarrollo como fármacos anticáncer.

Además, el documento WO 2009/041565 A (documento de patente 4) y el documento WO 2009/041566 A (documento de patente 5) describen, respectivamente, prevención o terapia de trastorno de queratoconjuntivis y enfermedad ocular posterior por medio de un inhibidor de PARP.

El documento WO 2007/149907 A2 se refiere a 1 H-bencimidazol-4-carboxamidas, su preparación y su uso como inhibidores de la enzima poli(ADP-ribosa)polimerasa para la preparación de fármacos.

Además, el documento WO 2002/06284 A1 se refiere a nuevas indoloquinazolinonas, su preparación, su uso como productos farmacéuticos y composiciones farmacéuticas que las contienen.

PTD 1: WO 02/48117 A

PTD 2: WO 03/055865 A

PTD 3: WO 03/063874 A

PTD 4: WO 2009/041565 A

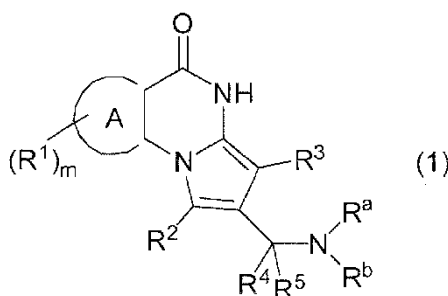
PTD 5: WO 2009/041566 A

NPD 1: Annals of Oncology, 22, 268-279 (2011)

Como se describió con anterioridad, si bien se espera que los inhibidores de PARP tengan el potencial de volverse agentes terapéuticos para diversas enfermedades, el descubrimiento de un nuevo compuesto con actividad inhibidora de PARP es un tema de interés.

A la luz de lo anterior, los presentes inventores sintetizaron una variedad de compuestos para descubrir un nuevo inhibidor de PARP y compararon y examinaron sus actividades inhibidoras de PARP, para hallar que un compuesto representado por la siguiente fórmula general (1) o una de sus sales tiene una fuerte actividad inhibidora de PARP y realizaron la presente invención. Específicamente, la presente invención proporciona un compuesto representado por la siguiente fórmula general (1) o una de sus sales (de ahora en más en la presente, también se mencionan colectivamente como "presente compuesto").

[Fórmula química 1]



En la fórmula general anterior (1), R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxi, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxi con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo nitro o un grupo ciano; R² y R³ pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un

átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo; R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente o un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente; R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ; R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo heterocíclico que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo hidroxil, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo amino, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo; anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado; y m representa 0, 1 ó 2.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo; R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un átomo de deuterio, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amino o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ; R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxil, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un

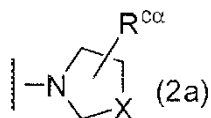
átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y m representa 0 ó 1.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^2 y R^3 cada uno representa un átomo de hidrógeno; R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo; R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amina o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno o un anillo heterobícíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ; R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amina, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y m representa 0 ó 1.

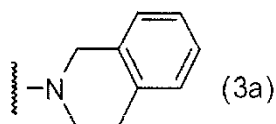
Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo morfolilo, un grupo amina o un grupo dimetilamino.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^a y R^b se unen entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la siguiente fórmula (2a) o (3a);

[Fórmula química 2]



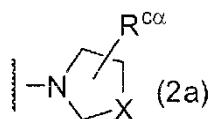
[Fórmula química 3]



- 5 en la fórmula anterior (2a), X representa CH_2 , $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$; $\text{R}^{\text{C}\alpha}$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo; $\text{R}^{\text{C}\beta}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^{a} y R^{b} se unen entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la siguiente fórmula (2a);

[Fórmula química 4]



- 30 en la fórmula anterior (2a), $\text{R}^{\text{C}\alpha}$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo; X representa $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{C}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$; $\text{R}^{\text{C}\beta}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo

con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

- 5 Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula anterior (2a), R^{ca} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo metilo o un grupo fenilo; R^{cb} representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo ciclohexilo, un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo piperidilo, un grupo tiazol, un grupo morfonilo, un grupo indolilo, un grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo ciclopropilcarbonilo o un grupo dimetilamino y el grupo metilo, el grupo ciclohexilo, el grupo fenilo, el grupo piridilo, el grupo piperidilo, el grupo tiazol, el grupo morfonilo, el grupo indolilo, el grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo o el grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo dimetilamino.

- 20 Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula anterior (2a), R^{ca} representa un átomo de hidrógeno, X representa CH_2NR^{cb} y R^{cb} representa un grupo fenilo que puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxilo y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

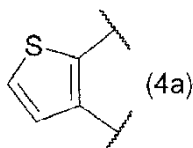
Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^1 representa un átomo de halógeno.

- 25 Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^2 y R^3 representan cada uno un átomo de hidrógeno.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), R^4 y R^5 representan cada uno un átomo de hidrógeno.

Con preferencia, en el presente compuesto, en la fórmula general anterior (1), anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado representado por la siguiente fórmula (4a).

- 30 [Fórmula química 5]



La presente invención también proporciona un compuesto seleccionado de los siguientes compuestos o una de sus sales.

- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 35 • 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 40 • 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Metilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,

- 2-(4-Bencilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 5 • 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pimolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 10 • 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(3,4-Dihidroisoquinolin-2(1H)-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 15 • 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 20 • 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(3-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 25 • 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 30 • 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,

- 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 5 • 2-(Fenilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Metilhomopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[(2-Dimetilaminoetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[(Piridin-4-ilmetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[2-(Morfolin-4-iletil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 10 • 2-(Bencilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(2-Feniletilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(3-Fenilpropilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 15 • 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 20 • 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Metilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 25 • 2-(4-Bencilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 30 • 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,

- 2-(1,2,3,4-Tetrahidroisoquinolin-2(1H)-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 5 • 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Trifluorometililfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 10 • 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(3-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 15 • 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 20 • 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
- 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 25 • 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Hidroxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[1-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-il]-1,1-dideuteriometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 30 • Clorhidrato de 2-(homopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(Piperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona, y
- 2-[4-Ciclopropilcarbonilhomopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona.

Si bien el presente compuesto tiene una fuerte actividad inhibidora de PARP, puede servir como agente terapéutico para diversas enfermedades que incluyen enfermedad ocular posterior.

De ahora en más en la presente, se describirán en detalle definiciones para la expresión (átomo y grupo) usada en esta descripción. Cuando las siguientes definiciones para la expresión se aplican a la definición de otra expresión, también se aplican un rango preferido y un rango de particular preferencia de las definiciones.

“Átomo de halógeno” representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

- 5 Un grupo alquilo lineal o ramificado tiene 1 a 8, con preferencia, 1 a 6 y, con preferencia particular, 1 a 4 átomos de carbono. Los ejemplos específicos incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo, un grupo isopropilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo ter-butilo y un grupo isopentilo.

- 10 Un grupo cicloalquilo tiene 3 a 10, con preferencia, 3 a 8 y, con preferencia particular, 3 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos específicos incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo ciclooctilo, un grupo ciclononano y un grupo ciclodecano.

- 15 Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentoxi, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo, un grupo isopropoxi, un grupo isobutoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo ter-butoxi y un grupo isopentoxi.

- 20 Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” incluyen un grupo metilcarbonilo, un grupo etilcarbonilo, un grupo n-propilcarbonilo, un grupo n-butilcarbonilo, un grupo n-pentilcarbonilo, un grupo n-hexilcarbonilo, un grupo n-heptilcarbonilo, un grupo n-octilcarbonilo, un grupo isopropilcarbonilo, un grupo isobutilcarbonilo, un grupo sec-butilcarbonilo, un grupo ter-butilcarbonilo y un grupo isopentilcarbonilo.

- Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono” incluyen un grupo ciclopropilcarbonilo, un grupo ciclopentilcarbonilo, un grupo ciclohexilcarbonilo, un grupo cicloheptilcarbonilo, un grupo ciclononilcarbonilo y un grupo ciclodecanilcarbonilo.

- 25 “Grupo arilo” representa un residuo formado al remover un átomo de hidrógeno de un hidrocarburo aromático monocíclico o hidrocarburo aromático bicíclico o tricíclico o policíclico condensado que tiene 6 a 14 átomos de carbono. Los ejemplos específicos de “grupo arilo” incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo antrilo y un grupo fenantrilo y, entre ellos, se prefiere en particular un grupo fenilo.

- 30 Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” incluyen un grupo metilamino, un grupo etilamino, un grupo propilamino, un grupo dimetilamino y un grupo etil(metil)amino.

- Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono” incluyen un grupo ciclopropilamino, un grupo ciclobutilamino, un grupo ciclopentilamino, un grupo ciclohexilamino y un grupo ciclohexil(metil)amino.

- 35 Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” incluyen un grupo metilaminocarbonilo, un grupo etilaminocarbonilo, un grupo propilaminocarbonilo, un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo dietilaminocarbonilo y un grupo etil(metil)aminocarbonilo.

- 40 Los ejemplos específicos de “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono” incluyen un grupo ciclopropilaminocarbonilo, un grupo ciclobutilaminocarbonilo, un grupo ciclopentilaminocarbonilo, un grupo ciclohexilaminocarbonilo, un grupo cicloheptilaminocarbonilo, un grupo ciclooctilaminocarbonilo, un grupo dicitlohexilaminocarbonilo y un grupo ciclohexil(metil)aminocarbonilo.

- 45 Los ejemplos específicos de un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, un grupo n-pentoxicarbonilo, un grupo n-hexiloxicarbonilo, un grupo n-heptiloxicarbonilo, un grupo n-octiloxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo, un grupo isobutoxicarbonilo, un grupo sec-butoxicarbonilo, un grupo ter-butoxicarbonilo y un grupo isopentoxicarbonilo.

- 50 “Anillo heterocíclico” representa un anillo heteromonocíclico saturado o insaturado o anillo heterobícíclico o heterotricíclico que tiene uno o varios heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre en el anillo.

Como “anillo heteromonocíclico saturado” en la presente invención, se prefiere un anillo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 2 a 5 átomos de carbono en el anillo y se prefiere en particular un anillo heteromonocíclico saturado de 5 a 7 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 3 a 5 átomos de carbono en el anillo. Los ejemplos específicos de “anillo heteromonocíclico saturado” incluyen un anillo pirrolidina, un anillo pirazolidina, un anillo imidazolidina, un anillo triazolidina, un anillo piperidina, un anillo hexahidropiridazina, un anillo hexahidropirimidina, un anillo piperazina, un anillo homopiperidina y un anillo homopiperazina que tiene un átomo de nitrógeno en el anillo; un anillo tetrahidrofuran y un anillo tetrahidropirano que tiene un átomo de oxígeno en el anillo; un anillo tetrahidrotiofeno y un anillo tetrahidrotiopirano que tienen un átomo de azufre en el anillo; un anillo oxazolidina, un anillo isoxazolidina y un anillo morfolina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno en el anillo; y un anillo tiazolidina, un anillo isotiazolidina y un anillo tiomorfolina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre en el anillo.

Como “anillo heteromonocíclico insaturado” en la presente invención, se prefiere un anillo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 2 a 5 átomos de carbono en el anillo y se prefiere en particular un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 a 7 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 3 a 5 átomos de carbono en el anillo. Los ejemplos específicos de “anillo heteromonocíclico insaturado” incluyen un anillo pirrol, un anillo dihidropirrol, un anillo pirazol, un anillo dihidropirazol, un anillo imidazol, un anillo dihidroimidazol, un anillo triazol, un anillo dihidrotriazol, un anillo piridina, un anillo dihidropiridina, un anillo tetrahidropiridina, un anillo piridazina, un anillo dihidropiridazina, un anillo tetrahidropiridazina, un anillo pirimidina, un anillo dihidropirimidina, un anillo tetrahidropirimidina, un anillo pirazina, un anillo dihidropirazina y un anillo tetrahidropirazina que tienen un átomo de nitrógeno en el anillo; un anillo dihidrofuran, un anillo furano, un anillo dihidropirano y un anillo pirano que tienen un átomo de oxígeno en el anillo; un anillo dihidrotiofeno, un anillo tiofeno, un anillo dihidrotiopirano y un anillo tiopirano que tienen un átomo de azufre en el anillo; un anillo oxazol, un anillo dihidrooxazol, un anillo isoxazol, un anillo dihidroisoxazol, un anillo oxazina y un anillo dihidrooxazina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno en el anillo; y un anillo tiazol, un anillo dihidrotiazol, un anillo isotiazol, un anillo dihidroisotiazol, un anillo tiazina y un anillo dihidrotiazina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre en el anillo.

Como “anillo heterobicíclico” o “anillo heterotricíclico” en la presente invención, se prefiere un anillo heteropolicíclico condensado bicíclico o tricíclico que tiene 1 a 3 heteroátomos y 7 a 13 átomos de carbono en el anillo. “Anillo heterobicíclico” o “anillo heterotricíclico” se forma por condensación del anillo heteromonocíclico saturado o insaturado antes mencionado con un anillo benceno, o similares y sus ejemplos específicos incluyen un anillo indol, un anillo dihidroindol, un anillo indazol, un anillo dihidroindazol, un anillo benzoimidazol, un anillo dihidrobenzoimidazol, un anillo benzotriazol, un anillo quinolina, un anillo dihidroquinolina, un anillo tetrahidroquinolina, un anillo isoquinolina, un anillo dihidroisoquinolina, un anillo tetrahidroisoquinolina, un anillo cinnolina, un anillo dihidrocinnolina, un anillo tetrahidrocinnolina, un anillo ftalazina, un anillo dihidroftalazina, un anillo tetrahidroftalazina, un anillo quinazolina, un anillo dihidroquinazolina, un anillo tetrahidroquinazolina, un anillo quinoxalina, un anillo dihidroquinoxalina, un anillo tetrahidroquinoxalina, un anillo fenantridina, un anillo carbazol, un anillo β -carbolina, un anillo acridina, un anillo fenantrolina, un anillo fenazina y un anillo perimidina que tienen un átomo de nitrógeno en el anillo; un anillo benzofurano, un anillo dihidrobenzofurano, un anillo isobenzofurano, un anillo dihidroisobenzofurano, un anillo cromeno, un anillo isocromeno, un anillo cromano, un anillo isocromano y un anillo xanteno que tienen un átomo de oxígeno en el anillo; un anillo benzotiofeno, un anillo dihidrobenzotiofeno, un anillo isobenzotiofeno, un anillo dihidroisobenzotiofeno, un anillo tiocromano, un anillo isotiocromano, un anillo tiocromeno y un anillo isotiocromeno que tienen un átomo de azufre en el anillo; un anillo benzoxazol, un anillo dihidrobenzoxazol, un anillo bencisoxazol, un anillo dihidrobencisoxazol, un anillo benzoxazina, un anillo dihidrobenzoxazina, un anillo furo[3,2-c]piridina y un anillo fenoxazina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno en el anillo; y un anillo benzotiazol, un anillo dihidrobenzotiazol, un anillo bencisotiazol, un anillo dihidrobencisotiazol, un anillo benzotiazina, un anillo dihidrobenzotiazina, un anillo fenoxantina y un anillo fenotiazina que tienen un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre en el anillo.

“Anillo heterocíclico que contiene nitrógeno” representa aquellos que tienen uno o varios átomos de nitrógeno en el anillo entre los anillos heterocíclicos como se mencionaron con anterioridad, y se prefiere un anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno o un anillo heterobicíclico que contiene nitrógeno.

“Anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno” representa con preferencia un anillo heteromonocíclico de 3 a 8 miembros que contiene nitrógeno que tiene 1 a 3 átomos de nitrógeno y 2 a 5 átomos de carbono en el anillo y, con preferencia particular, un anillo heteromonocíclico de 5 a 7 miembros que contiene nitrógeno que tiene 1 a 3 átomos de nitrógeno y 3 a 5 átomos de carbono en el anillo. Sus ejemplos específicos incluyen aquellos ejemplificados como el anterior “anillo heteromonocíclico insaturado o saturado que tiene un átomo de nitrógeno en el anillo”, el anterior “anillo heteromonocíclico insaturado o saturado que tiene un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno en el anillo” y el anterior “anillo heteromonocíclico insaturado o saturado que tiene un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre en el anillo”. Un ejemplo específico preferido de “anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno” en la presente invención es un anillo pirrolidina, un anillo piperidina, un anillo tetrahidropiridina (un anillo 1,2,3,6-tetrahidropiridina, o similares), un anillo piperazina o un anillo homopiperazina.

“Anillo heterobicíclico que contiene nitrógeno” representa un anillo heteropolicíclico condensado bicíclico que tiene preferentemente 1 a 3 heteroátomos y 7 a 9 átomos de carbono en el anillo y sus ejemplos específicos incluyen aquellos ejemplificados como el anterior “anillo heterobicíclico que tiene un átomo de nitrógeno en el anillo”, el

anterior “anillo heterobíciclico que tiene un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno en el anillo” y el anterior “anillo heterobíciclico que tiene un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre en el anillo”. Un ejemplo concreto preferido de “anillo heterobíciclico que contiene nitrógeno” en la presente invención es un anillo tetrahidroisoquinolina (anillo 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina).

- 5 “Grupo heterocíclico” representa un residuo formado al remover un átomo de hidrógeno del anillo heterocíclico anterior. Como “grupo heterocíclico” en la presente invención, se prefiere el “grupo heteromonocíclico” que es un residuo formado al remover un átomo de hidrógeno del “anillo heteromonocíclico saturado o insaturado de 3 a 8 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 2 a 5 átomos de carbono en el anillo” y se prefiere en particular un “grupo heteromonocíclico” que es un residuo formado al remover un átomo de hidrógeno del “anillo heteromonocíclico saturado o insaturado de 5 a 7 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos y 3 a 5 átomos de carbono en el anillo”. Además, también se prefiere el “grupo heterobíciclico” que es un residuo formado al remover un átomo de hidrógeno del “anillo heteropolicíclico condensado bíciclico que tiene 1 a 3 heteroátomos y 7 a 9 átomos de carbono en el anillo” como el “grupo heterocíclico” en la presente invención.

- 15 Los ejemplos específicos preferidos del “grupo heteromonocíclico” en la presente invención incluyen grupos tiazol (por ejemplo, grupo tiazol-2-ilo), grupos piridilo (por ejemplo, grupo 2-piridilo, grupo 3-piridilo, grupo 4-piridilo), grupos piperidilo (por ejemplo, grupo 1-piperidilo) y grupos morfonilo (por ejemplo, grupo morfolin-4-ilo (grupo morfolino)).

Los ejemplos específicos preferidos de “grupo heterobíciclico” en la presente invención incluyen grupos indolilo (por ejemplo, grupo 1H-indol-4-ilo), un grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo y un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo.

- 20 “Grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente” representa “grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste, por ejemplo, en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y preferentemente representa “grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono (por ejemplo, grupo ciclopropilo), un grupo arilo (por ejemplo, grupo fenilo), un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno (por ejemplo, grupo clorofenilo, grupo fluorofenilo) y un grupo heterocíclico (por ejemplo, grupo piridilo, grupo morfonilo).

- 35 “Grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente” representa un “grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste, por ejemplo, en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

- 45 “Grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente” representa “grupo arilo” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste, por ejemplo, en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y preferentemente representa “grupo arilo” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno (por ejemplo, átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo), un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono (por ejemplo, grupo metilo), un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno (por ejemplo, grupo trifluorometilo), un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono (por ejemplo, grupo metoxi, grupo isopropoxi) y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos

átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono (por ejemplo, grupo dimetilaminoetoxi).

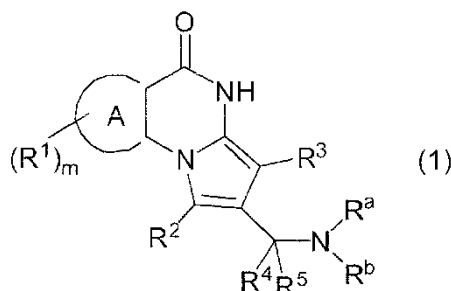
“Grupo heterocíclico que opcionalmente tiene un sustituyente” representa “grupo heterocíclico” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste, por ejemplo, en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y preferentemente representa “grupo heterocíclico” que puede estar sustituido con uno o varios átomos de halógeno (por ejemplo, átomo de cloro).

“Grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente” y/o “un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente” cada uno representa “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono”, “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono” y/o “grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono” que puede tener uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo que consiste, por ejemplo, en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

En cuanto a los “varios sustituyentes” en la presente invención, los grupos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes y los sitios de sustitución pueden ser iguales o diferentes. Los “varios sustituyentes” anteriores representan preferentemente dos o tres grupos sustituyentes y, con preferencia particular, dos grupos sustituyentes.

(A) Los ejemplos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que los grupos respectivos son los grupos como se muestran más abajo o una de sus sales en los compuestos representados por la siguiente fórmula general (1) o sus sales.

[Fórmula química 6]



- (A1) R^1 representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo nitrógeno o un grupo ciano; y/o
- (A2) R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; y/o
- (A3) R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo; y/o
- (A4) R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente o un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente; y/o
- (A5) R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ; y/o
- (A6) R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo heterocíclico que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo amino, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo;
- (A7) anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado; y/o
- (A8) m representa 0, 1 ó 2.
- En otras palabras, el presente compuesto es un compuesto que tiene una o más que una combinación seleccionada del grupo que consiste en los (A1), (A2), (A3), (A4), (A5), (A6), (A7) y (A8) anteriores o una de sus sales en los compuestos representados por la fórmula general (1) o sus sales.
- (B) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que los grupos respectivos son los grupos mostrados más abajo o una de sus sales en los compuestos representados por la fórmula general (1) o sus sales.
- (B1) R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; y/o
- (B2) R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; y/o

(B3) R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo; y/o

5 (B4) R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un átomo de deuterio, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amino o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; y/o

(B5) R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ; y/o

10 (B6) R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico y el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono; y/o

45 (B7) anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y/o

(B8) m representa 0 ó 1.

En otras palabras, el presente compuesto es preferentemente un compuesto que tiene una o más de una combinación seleccionada del grupo que consiste en los (B1), (B2), (B3), (B4), (B5), (B6), (B7) y (B8) anteriores o una de sus sales en los compuestos representados por la fórmula general (1) o sus sales.

50 (C) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que los grupos respectivos son los grupos mostrados más abajo o una de sus sales en los compuestos representados por la fórmula general (1) o sus sales.

(C1) R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

(C2) R^2 y R^3 cada uno representa un átomo de hidrógeno;

55 (C3) R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo;

(C4) R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amino o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

(C5) R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno o un anillo heterobícíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ;

(C6) R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono,

(C7) Anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y

(C8) m representa 0 ó 1.

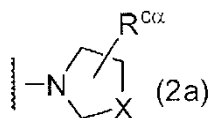
En otras palabras, el presente compuesto es preferentemente un compuesto que tiene una o más de una combinación seleccionada del grupo que consiste en los (C1), (C2), (C3), (C4), (C5), (C6), (C7) y (C8) anteriores o una de sus sales en los compuestos representados por la fórmula general (1) o sus sales.

(D) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que R^a y R^b en la fórmula general (1) pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo o sus sales y en este caso, el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo morfolilo, un grupo amino o un grupo dimetilamino.

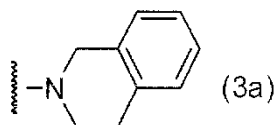
Los compuestos que satisfacen la condición (D) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(E) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que R^a y R^b en la fórmula general (1) se unen entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la siguiente fórmula (2a) o (3a) o una de sus sales.

[Fórmula química 7]



[Fórmula química 8]



En este caso, X representa CH_2 , $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$;

$\text{R}^{\text{C}\alpha}$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo; y

$\text{R}^{\text{C}\beta}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

En esta condición (E), el anillo heterocíclico que contiene nitrógeno es más preferentemente un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la fórmula anterior (2a).

En esta condición (E), $\text{R}^{\text{C}\alpha}$ es, con preferencia particular, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo metilo o un grupo fenilo.

En esta condición (E), X es preferentemente $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{C}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{C}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{C}\beta}$.

En esta condición (E), $\text{R}^{\text{C}\beta}$ es preferentemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y en este caso, el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo

formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

En esta condición (E), R^{cb} es, con preferencia particular, un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo ciclohexilo, un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo piperidilo, un grupo tiazol, un grupo morfonilo, un grupo indolilo, un grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo ciclopropilcarbonilo o un grupo dimetilamino y en este caso, el grupo metilo, el grupo ciclohexilo, el grupo fenilo, el grupo piridilo, el grupo piperidilo, el grupo tiazol, el grupo morfonilo, el grupo indolilo, el grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo o el grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo dimetilamino.

Además, con preferencia particular, en esta condición (E), en la fórmula anterior (2a), R^{ca} representa un átomo de hidrógeno, X representa CH_2NR^{cb} y R^{cb} representa un grupo fenilo que puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxilo y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

Los compuestos que satisfacen la condición (E) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(F) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que R^1 en la fórmula general (1) es un átomo de halógeno o una de sus sales.

Los compuestos que satisfacen la condición (F) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(G) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que R^2 y R^3 en la fórmula general (1) es un átomo de hidrógeno o una de sus sales.

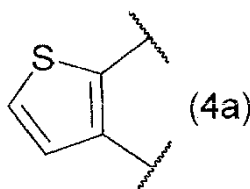
Los compuestos que satisfacen la condición (G) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(H) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que R^4 y R^5 en la fórmula general (1) es un átomo de hidrógeno o una de sus sales.

Los compuestos que satisfacen la condición (H) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(I) Los ejemplos preferidos del presente compuesto incluyen un compuesto en el que anillo A en la fórmula general (1) es un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado representado por la siguiente fórmula (4a) o una de sus sales.

[Fórmula química 9]



Los compuestos que satisfacen la condición (I) y las condiciones (A), (B) y/o (C) o sus sales son más preferidos como el presente compuesto.

(J) Los ejemplos específicos preferidos del presente compuesto incluyen los siguientes compuestos o sus sales.

- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-1" descrito más tarde),

- 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-2" descrito más tarde),
- 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-3" descrito más tarde),
- 5 • 2-(4-Fenilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-4" descrito más tarde),
- 2-(4-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-5" descrito más tarde),
- 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-6" descrito más tarde),
- 10 • 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-7" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-8" descrito más tarde),
- 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-9" descrito más tarde),
- 15 • 2-(4-Metilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-10" descrito más tarde),
- 2-(4-Bencilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-11" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-12" descrito más tarde),
- 20 • 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-13" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-14" descrito más tarde),
- 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-15" descrito más tarde),
- 25 • 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-16" descrito más tarde),
- 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-17" descrito más tarde),
- 30 • 2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-18" descrito más tarde),
- 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-19" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-20" descrito más tarde),
- 35 • 2-(3,4-Dihidroisoquinolin-2(1H)-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-21" descrito más tarde),
- 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-22" descrito más tarde),
- 40 • 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-23" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-24" descrito más tarde),

- 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-25" descrito más tarde),
- 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-26" descrito más tarde),
- 5 • 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-27" descrito más tarde),
- 2-[4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-28" descrito más tarde),
- 10 • 2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-29" descrito más tarde),
- 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-30" descrito más tarde),
- 2-(3-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-31" descrito más tarde),
- 15 • 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-32" descrito más tarde),
- 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-33" descrito más tarde),
- 2-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-34" descrito más tarde),
- 20 • 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-35" descrito más tarde),
- 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-36" descrito más tarde),
- 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-37" descrito más tarde),
- 25 • 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-38" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-39" descrito más tarde),
- 30 • 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-40" descrito más tarde),
- 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 1-41" descrito más tarde),
- 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 1-42" descrito más tarde),
- 35 • 7-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 1-43" descrito más tarde),
- 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-44" descrito más tarde),
- 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-45" descrito más tarde),
- 40 • 2-[4-(4-Fluorofenil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-46" descrito más tarde),
- 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-47" descrito más tarde),

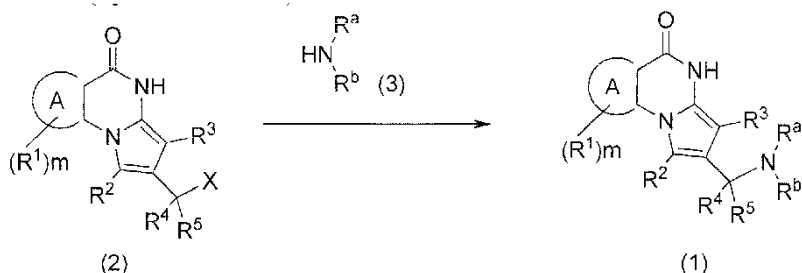
- 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-48" descrito más tarde),
- 2-(Fenilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-49" descrito más tarde),
- 5 • 2-(4-Metilhomopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-50" descrito más tarde),
- 2-[(2-Dimetilaminoetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-51" descrito más tarde),
- 2-[(Piridin-4-ilmetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-52" descrito más tarde),
- 10 • 2-[2-(Morfolin-4-iletal)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-53" descrito más tarde),
- 2-(Bencilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-54" descrito más tarde),
- 2-(2-Feniletalaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-55" descrito más tarde),
- 2-(3-Fenilpropilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-56" descrito más tarde),
- 15 • 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-57" descrito más tarde),
- 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 1-58" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-1" descrito más tarde),
- 20 • 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-2" descrito más tarde),
- 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-3" descrito más tarde),
- 2-(4-Fenilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-4" descrito más tarde),
- 2-(4-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-5" descrito más tarde),
- 25 • 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-6" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-7" descrito más tarde),
- 30 • 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-8" descrito más tarde),
- 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-9" descrito más tarde),
- 2-(4-Metilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-10" descrito más tarde),
- 2-(4-Bencilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-11" descrito más tarde),
- 35 • 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-12" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-13" descrito más tarde),
- 40 • 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-14" descrito más tarde),

- 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-15" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-16" descrito más tarde),
- 5 • 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-17" descrito más tarde),
- 2-[4-(Piridine-3-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-18" descrito más tarde),
- 10 • 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-19" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-20" descrito más tarde),
- 2-(1,2,3,4-Tetrahidroisoquinolin-2(1H)-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-21" descrito más tarde),
- 15 • 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-22" descrito más tarde),
- 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-23" descrito más tarde),
- 20 • 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-24" descrito más tarde),
- 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-25" descrito más tarde),
- 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-26" descrito más tarde),
- 25 • 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-27" descrito más tarde),
- 2-(4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-28" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-29" descrito más tarde),
- 30 • 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-30" descrito más tarde),
- 2-(3-Fenilpiperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-31" descrito más tarde),
- 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-32" descrito más tarde),
- 35 • 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-33" descrito más tarde),
- 2-(Pirrolidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-34" descrito más tarde),
- 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-35" descrito más tarde),
- 40 • 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-36" descrito más tarde),
- 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-37" descrito más tarde),

- 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-38" descrito más tarde),
- 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-39" descrito más tarde),
- 5 • 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-40" descrito más tarde),
- 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 2-41" descrito más tarde),
- 10 • 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 2-42" descrito más tarde),
- 7-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona ("Compuesto 2-43" descrito más tarde),
- 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-44" descrito más tarde),
- 15 • 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-45" descrito más tarde),
- 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-46" descrito más tarde),
- 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 2-47" descrito más tarde),
- 20 • 2-[4-(4-Hidroxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 3-1" descrito más tarde),
- 2-[1-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-il]-1,1-dideuteriometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 4-1" descrito más tarde),
- 25 • Clorhidrato de 2-(homopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 5-1" descrito más tarde),
- 2-(Piperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 5-2" descrito más tarde),
- 2-[4-Ciclopropilcarbonilhomopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona ("Compuesto 6-1" descrito más tarde).
- 30 El presente compuesto se puede producir por medio del siguiente método. Los métodos de producción concretos individuales se describirán en detalle en la sección descrita más tarde de los Ejemplos [Ejemplos de producción]. Estas ejemplificaciones se dan para una mejor comprensión de la presente invención. X en las siguientes vías de síntesis representa un átomo de halógeno.
- 35 El presente compuesto se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 1. Específicamente, haciendo reaccionar el compuesto (2) con amina (3) en un disolvente orgánico como cloruro de metileno o N,N-dimetilformamida (de ahora en más en la presente, "DMF") en presencia de una base como diisopropiletilamina (de ahora en más en la presente, "DIEA") a temperatura ambiente hasta 100 °C durante 1 hora a 24 horas, se puede obtener el presente compuesto.

[Fórmula química 10]

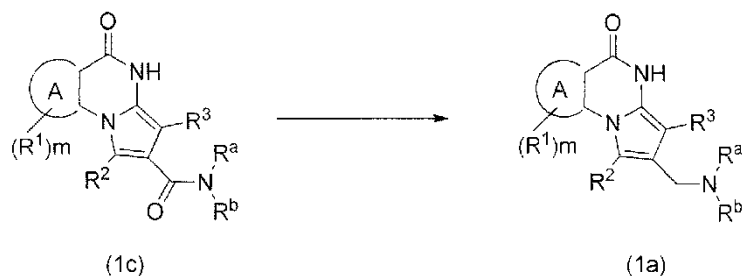
(Ruta de síntesis 1)



El presente compuesto (1a) (compuesto en el que R⁴ y R⁵ son cada uno un átomo de hidrógeno en la fórmula general (1)) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 2. Específicamente, el presente compuesto (1 a) se puede obtener haciendo reaccionar el presente compuesto (1c) (R⁴ y R⁵ representan un grupo oxo en la fórmula general (1)) en un disolvente orgánico como tetrahidrofurano (de ahora en más en la presente, "THF") en presencia de un agente de reducción como hidruro de litio y aluminio (de ahora en más en la presente, "LAH") a temperatura ambiente hasta 70 °C durante 1 hora a 24 horas,

[Fórmula química 11]

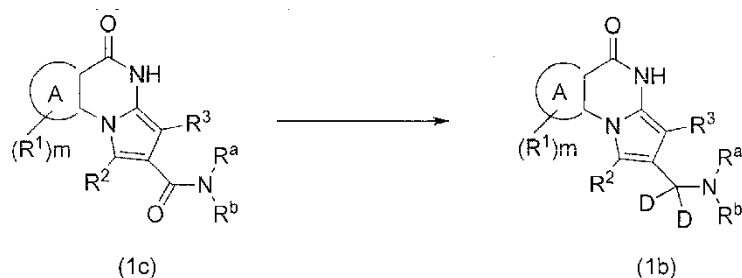
(Ruta de síntesis 2)



El presente compuesto (1b) (compuesto en el que R⁴ y R⁵ son cada uno un átomo de deuterio en la fórmula general (1)) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 3. Específicamente, el presente compuesto (1b) se puede obtener haciendo reaccionar el presente compuesto (1c) en un disolvente orgánico como THF en presencia de un agente de reducción como deuteruro de litio y aluminio a temperatura ambiente hasta 70 °C durante 1 hora a 24 horas.

[Fórmula química 12]

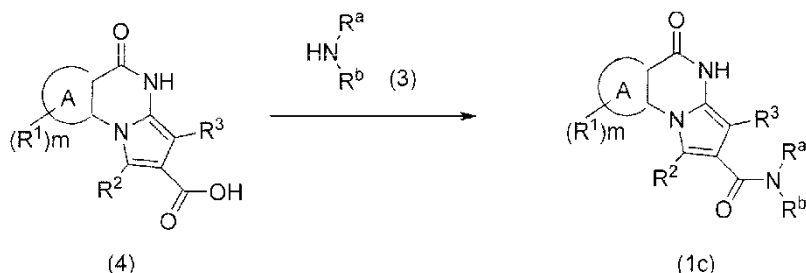
(Ruta de síntesis 3)



El presente compuesto (1c) (compuesto en el que R⁴ y R⁵ forman un grupo oxo en la fórmula general (1)) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 4. Específicamente, el presente compuesto (1c) se puede obtener haciendo reaccionar el compuesto (4) con amina (3) en un disolvente orgánico como DMF en presencia de una base como DIEA y un agente de condensación como hexafluorofosfato de O-(6-clorobenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (de ahora en más en la presente, "HCTU") a temperatura ambiente hasta 70 °C durante 1 hora a 24 horas.

[Fórmula química 13]

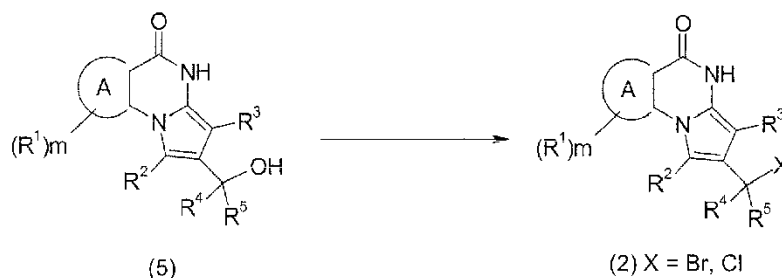
(Ruta de síntesis 4)



5 El compuesto (2) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 5. Específicamente, el compuesto (2) se puede obtener haciendo reaccionar el compuesto (5) en un disolvente orgánico como 1,4-dioxano en presencia de un agente halogenante como tribromuro de fósforo o cloruro de tionilo a 0 °C hasta temperatura ambiente durante 30 minutos a 3 horas.

[Fórmula química 14]

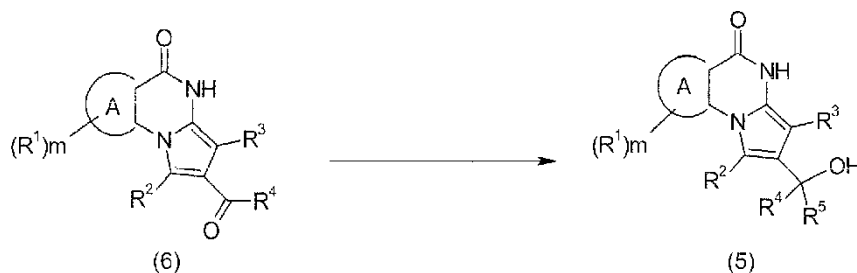
(Ruta de síntesis 5)



10 El compuesto (5) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 6. Específicamente, el compuesto (5) se puede obtener haciendo reaccionar el compuesto (6) en un disolvente orgánico como THF en presencia de un agente de reducción como LAH o un agente alquilante como metil-litio o cloruro de metil-magnesio a temperatura ambiente hasta 70 °C durante 3 horas a 24 horas.

[Fórmula química 15]

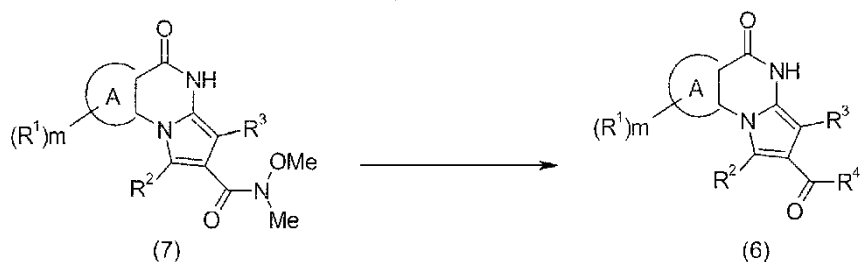
(Ruta de síntesis 6)



20 El compuesto (6) (en la fórmula general (6), R⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 7. Es decir, el compuesto (6) se puede obtener haciendo reaccionar el compuesto (7) en un disolvente orgánico como THF en presencia de un agente de reducción como LAH o un agente alquilante como cloruro de metilmagnesio a temperatura ambiente durante 3 horas a 24 horas. El compuesto (7) se puede obtener a partir del compuesto (4) y clorhidrato de metoximetilamina de acuerdo con la vía de síntesis 4.

[Fórmula química 16]

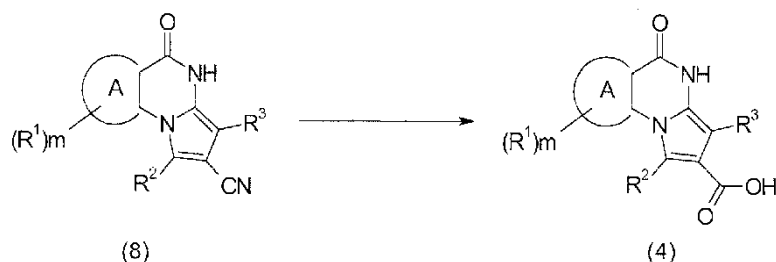
(Ruta de síntesis 7)



5 El compuesto (4) se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 8. Específicamente, el compuesto (4) se puede obtener por tratamiento del compuesto (8) en un ácido fuerte como ácido bromhídrico al 47% a 100 °C durante 3 horas a 24 horas.

[Fórmula química 17]

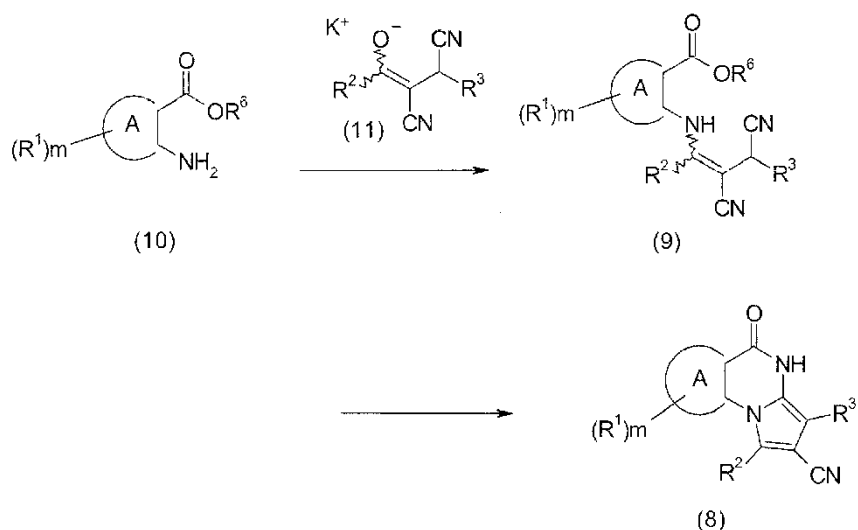
(Ruta de síntesis 8)



10 El compuesto (8) para usar en la vía de síntesis 8 se puede sintetizar de acuerdo con la vía de síntesis 9. Específicamente, el compuesto (9) se puede obtener haciendo reaccionar sal de potasio (11) (Z. Chem. 1961, 1, 349) y la correspondiente amina (10) en una solución mixta de agua y ácido acético a 100 °C durante 10 minutos a 30 minutos. El compuesto (8) se puede obtener haciendo reaccionar el compuesto (9) obtenido en un disolvente orgánico como etanol en presencia de una base como etóxido de sodio a temperatura ambiente durante 1 hora a 3
15 horas.

[Fórmula química 18]

(Ruta de síntesis 9)



20 Varias aminas (3) para usar en las vías de síntesis 1 y 4 y amina (10) para usar en la vía de síntesis 9 eran compuestos asequibles en comercios o se prepararon por medio de un procedimiento de síntesis general conocido

de la literatura. Los métodos de preparación concretos se describirán en detalle en la sección de ejemplos descrita más tarde [Ejemplos de producción].

5 Cuando el presente compuesto tiene isómeros geométricos o isómeros ópticos, estos isómeros también están implicados en el alcance de la presente invención. El presente compuesto puede estar en la forma de un hidrato o un solvato.

Cuando el presente compuesto tiene tautomerismo protónico, estos tautómeros también están implicados en la presente invención.

10 Cuando el presente compuesto tiene polimorfos cristalinos y un grupo polimórfico cristalino (sistema polimórfico cristalino), tales polimorfos cristalinos y grupo polimórfico cristalino (sistema polimórfico cristalino) también están implicados en la presente invención. El grupo polimórfico cristalino (sistema polimórfico cristalino) usado en la presente significa formas cristalinas en las respectivas etapas cuando la forma cristalina cambia según las condiciones tales como producción, cristalización, almacenamiento, y similares del cristal y sus estados (incluyendo el estado formulado) y el proceso entero.

15 “Sal” en el presente compuesto no está limitada en particular siempre que sea una sal farmacéuticamente aceptable y sus ejemplos incluyen sales con ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido yodhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico y ácido fosfórico; sales con ácidos orgánicos tales como ácido acético, ácido fumárico, ácido maleico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido tartárico, ácido adípico, ácido glucónico, ácido glucoheptónico, ácido glucurónico, ácido tereftálico, ácido metansulfónico, ácido láctico, ácido hipúrico, ácido 1,2-etandisulfónico, ácido isetiónico, ácido lactobiónico, ácido oleico, ácido pamoico, ácido poligalacturónico, ácido esteárico, ácido tánico, ácido trifluorometansulfónico, ácido bencensulfónico, ácido p-toluensulfónico, éster de laurilsulfato, sulfato de metilo, naftalensulfonato y ácido sulfosalicílico; sales de amonio cuaternario con bromuro de metilo, yoduro de metilo, etc.; sales con iones halógeno tales como ion bromo, ion cloro y ion yodo; sales con metales alcalinos tales como litio, sodio y potasio; sales con metales alcalinotérreos tales como calcio y magnesio; metal sales con hierro, zinc, etc.; sales con amoniaco; y sales con aminas orgánicas tales como trietilendiamina, 2-aminoetanol, 2,2-iminobis(etanol), 1-desoxi-1-(metilamino)-2-D-sorbitol, 2-amino-2-(hidroximetil)-1,3-propanodiol, procaina, N,N-bis(fenilmetil)-1,2-etandiamina, etc.

En la presente invención, “PARP” significa “poli(ADP ribosa) polimerasa”. PARP incluye varias isoformas tales como PARP1 y PARP2 y estas isoformas también están implicadas en “PARP” en la presente invención.

30 En la presente invención, “inhibidor de PARP” significa aquella que inhibe la actividad de PARP. Como se describirá en detalle en la sección del “Ensayo farmacológico” en los Ejemplos descritos más tarde, se puede medir fácilmente la actividad inhibidora de PARP del presente compuesto usando el kit de ensayo universal colorimétrico de PARP con cavidades con cintas recubiertas con histona (disponibles de Trevigen, N.º de cat. 4677-096-K).

En la presente invención, “composición farmacéutica” significa una composición útil como una medicina.

35 La composición farmacéutica que comprende el presente compuesto como un ingrediente activo se puede usar para prevención o terapia de, por ejemplo, enfermedades oculares posteriores tales como degeneración macular relacionada con la edad (incluyendo maculopatía temprana relacionada con la edad, degeneración macular atrófica relacionada con la edad y degeneración macular exudativa relacionada con la edad), retinopatía diabética, edema macular diabético, distrofia de conos, retinopatía relacionada con cáncer, retinitis pigmentosa, vitreorretinopatía proliferativa, oclusión arterial retinal, oclusión venosa retinal, uveítis, enfermedad de Leber, retinopatía de premadurez, desprendimiento de la retina, desprendimiento del epitelio pigmentario de la retina, coriorretinopatía serosa central, coriorretinopatía exudativa central, vasculopatía coroidal polipoidal, coroiditis múltiple, maculopatía neovascular, macroaneurisma arterial retinal, trastorno del nervio óptico causado por estas enfermedades, trastorno del nervio óptico causado por glaucoma, constricción glaucomatosa del campo visual, neuropatía óptica isquémica, y similares; enfermedades oculares anteriores tales como ojo seco, queratopatía punteada superficial, defecto epitelial de la córnea, erosión de la córnea, úlcera de la córnea, defecto epitelial de la conjuntiva, queratoconjuntivitis seca, queratoconjuntivitis límbica superior, queratoconjuntivitis filamentosa, queratitis infecciosa, queratitis no infecciosa, conjuntivitis infecciosa, conjuntivitis no infecciosa, blefaritis, xeroftalmia, conjuntivitis alérgica, uveítis anterior, y similares; inflamación anterior del ojo después de cirugía; inflamación debida a rechazo al trasplante de tejido ocular, etc., a pesar de que su aplicación de uso no está limitada en particular.

50 Las composiciones farmacéuticas que comprenden el presente compuesto como un ingrediente activo se pueden usar como fármacos terapéuticos para tumores y sus metástasis (incluyendo un adyuvante en el tratamiento del cáncer o un potenciador para la terapia por radiación ionizante o un agente quimioterapéutico); fármaco terapéutico para enfermedad neurodegenerativa y trastorno neurogénico causado por isquemia, lesión o hemorragia masiva o enfermedades neurodegenerativas y trastornos neurogénicos tales como apoplejía o lesión en la cabeza, epilepsia, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Huntington, y similares; fármacos terapéuticos para inmunodeficiencia o trastorno reumático o artritis reumatoidea; fármacos terapéuticos para inflamaciones tales como sepsis; fármacos terapéuticos para trastorno cardíaco después de enfermedad cardíaca isquémica; fármacos terapéuticos para una arteria coronaria severamente estenosada o arteria periférica severamente estenosada;

fármacos para la terapia de infarto agudo de miocardio o daño durante y después de solución médica o solución mecánica; fármacos terapéuticos para diabetes mellitus; fármacos terapéuticos para sepsis de falla tisular múltiple y síndrome de distrés respiratorio agudo; fármacos terapéuticos para trastorno renal después de isquemia renal; fármacos terapéuticos para usar durante o después de trasplante renal; etc.

5 Como se describirá en detalle en la sección de "ensayo farmacológico" en los Ejemplos descritos más tarde, el presente compuesto es de utilidad en particular como un fármaco preventivo o terapéutico para la enfermedad ocular posterior y los ejemplos específicos de la enfermedad ocular posterior en la que es particularmente útil el presente compuesto incluyen degeneración macular relacionada con la edad, retinitis pigmentosa, desprendimiento de la retina, edema macular diabético, oclusión venosa retinal y desprendimiento del epitelio pigmentario de la retina.

10 El presente compuesto se puede administrar por vía oral o parenteral. En cuanto a las formas de dosis, se mencionan comprimido, cápsula, gránulo, polvo, inyección, solución oftálmica, supositorio, preparación transdérmica, ungüento, aerosol (incluyendo inhalante), y similares y se pueden formular usando técnicas de uso común.

15 Por ejemplo, las preparaciones orales tales como comprimido, cápsula, gránulo y polvo se pueden preparar usando cantidades requeridas de excipientes tales como lactosa, manitol, almidón, celulosa cristalina, ácido silícico anhidro liviano, carbonato de calcio e hidrógeno-fosfato de calcio, lubricantes tales como ácido esteárico, estearato de magnesio y talco; aglutinantes tales como almidón, hidroxipropilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa y polivinilpirrolidona; disgregantes tales como carboximetilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa de baja sustitución y citrato de calcio; agentes de revestimiento tales como hidroxipropilmetilcelulosa, macrogol y resina siliconada; estabilizantes tales como paraoxibenzoato de etilo y alcohol bencílico; agentes saborizantes tales como endulzante, acidulante y sabor, etc., según se requiera.

20 Las preparaciones parenterales tales como inyección y solución oftálmica se pueden preparar usando cantidades requeridas de agentes de tonicidad tales como cloruro de sodio, glicerina concentrada, propilenglicol, polietilenglicol, cloruro de potasio, sorbitol y manitol; tampones tales como fosfato de sodio, hidrógeno-fosfato de sodio, acetato de sodio, ácido cítrico, ácido acético glacial y trometamol; tensioactivos tales como polisorbato 80, polioxi 40 estearato y aceite de ricino hidrogenado con polioxietileno 60; estabilizantes tales como citrato de sodio y edetato de sodio; conservantes tales como cloruro de benzalconio, parabeno, cloruro de bencetonio, éster de ácido paraoxibenzoico, benzoato de sodio, clorobutanol y ácido sórbico; ajustadores del pH tales como ácido clorhídrico, ácido cítrico, ácido fosfórico, ácido acético glacial, hidróxido de sodio, carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de sodio; agentes suavizantes tales como alcohol bencílico, etc., según se requiera.

25 La dosis del presente compuesto se puede seleccionar apropiadamente según el síntoma, la edad, la forma de dosificación, y similares. Por ejemplo, se puede administrar una preparación oral en una dosis de típicamente 0,01 a 1000 mg, con preferencia, 1 a 100 mg por día en una dosis simple o en varias dosis. Una gota oftálmica se puede administrar en una concentración de típicamente 0,0001 % al 10% (p/v) y preferentemente 0,01 % al 5% (p/v) en una dosis simple o en varias dosis.

EJEMPLOS

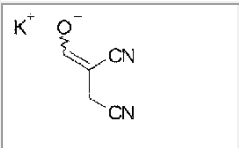
A continuación, se mostrarán los Ejemplos de producción, Ejemplos de formulación y los resultados de un ensayo farmacológico del presente compuesto. Se ha de observar que estas ejemplificaciones se brindan para una mejor comprensión de la presente invención.

40 [Ejemplos de producción]

(Ejemplo de referencia 1: sal potásica de 2-formilsuccinonitrilo (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 1-1))

45 En una solución de succinonitrilo (27,5 g, 0,344 mol) y formiato de etilo (33 mL, 0,410 mol) en tolueno (230 mL)/t-butanol (46 mL), se añadió una solución de t-butoxido de potasio (39,3 g, 0,350 mol) en t-butanol (300 mL) después de enfriar en hielo. La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. El sólido precipitado se recolectó por filtración y se lavó con etanol (50 mL) y éter t-butilmetílico (100 mL). Al secar a presión reducida a 80 °C, se obtuvo el compuesto de referencia del título 1-1 (49,3 g, rendimiento: 98%) en forma de un sólido marrón pálido (ver Z. Chem. 1961, 1, 349).

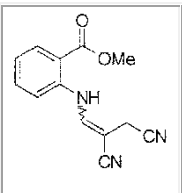
[Tabla 1]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,06 (s, 2H), 8,28 (s, 1H).
---	--

(Ejemplo de referencia 2: éster metílico de ácido 2-(2,3-dicianopropen-1-ilamino)benzoico (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 2-1))

- 5 En una solución de sal potásica de 2-formilsuccinonitrilo (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 1-1, 32,8 g, 0,224 mmol) y éster metílico de ácido antranílico (33,0 mL, 0,225 mmol) en agua (100 mL), se añadió ácido acético (100 mL) y la solución de reacción se agitó a 100 °C durante 10 minutos. Después de dejar enfriar la solución de reacción hasta temperatura ambiente, el sólido precipitado se recolectó por filtración y se lavó con agua y etanol. El sólido obtenido se secó a presión reducida, para obtener el compuesto de referencia del título
- 10 2-1(40,1 g, rendimiento: 74%) en forma de un sólido marrón (ver Z. Chem. 1961, 1, 349).

[Tabla 2]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,70 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 3,90 (s, 3H), 7,06-7,13 (m, 1H), 7,44 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,58-7,67 (m, 1H), 7,94-7,80 (m, 1H), 8,10-8,20 (m, 1H), 10,30 (d, J = 12,4 Hz, 1H).
--	--

- A continuación, usando éster metílico de ácido 3-aminotiofen-2-carboxílico y éster metílico de ácido 2-amino-5-fluorobenzoico, se obtuvieron los Compuestos de referencia 2-2 y 2-3 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 2-1.
- 15

[Tabla 3]

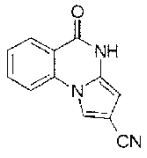
éster metílico del ácido 3-(2,3-dicianopropen-1-ilamino)tiofen-2-carboxílico (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 2-2)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,63 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 7,31 (d, J = 5,6 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 5,6 Hz, 1H), 8,08 (d, J = 13,4 Hz, 1H), 9,65 (d, J = 13,4 Hz, 1H).
	
éster metílico del ácido 2-(2,3-dicianopropen-1-ilamino)-5-fluorobenzoico (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 2-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,64 (s, 2H), 3,91 (s, 3H), 7,49 (dd, J = 9,3, 4,5 Hz, 1H), 7,60 (td, J = 9,3, 3,2 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 9,3, 3,2 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 13,0 Hz, 1H), 10,51 (d, J = 13,0 Hz, 1H).
	

(Ejemplo de referencia 3: 5-Oxo-4,5-dihidropirrol[1,2-a]quinazolin-2-carbonitrilo (Compuesto de referencia 3-1))

- 20 Bajo enfriamiento en hielo, en una solución de éster metílico del ácido 2-(2,3-dicianopropen-1-ilamino)benzoico (mezcla de isómero E / isómero Z) (Compuesto de referencia 2-1, 40,1 g, 0,166 mol) en etanol (700 mL), se añadió

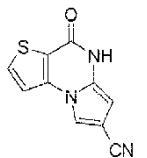
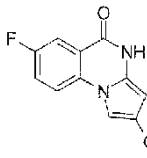
una solución de etóxido de sodio (28,2 g, 0,414 mol) en etanol (300 mL) gota a gota. Después de agitar la solución de reacción a temperatura ambiente durante 2 horas, se añadió ácido clorhídrico 1 M (500 mL) después de enfriar en hielo. El sólido precipitado se recolectó por filtración y se lavó con agua. Al secar a presión reducida, se obtuvo el compuesto de referencia del título (33,8 g, rendimiento: 97%) en forma de un polvo incoloro (ver Z. Chem. 1961, 1, 349).

[Tabla 4]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,95 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J = 7,3, 7,0, 0,7 Hz, 1H), 7,87 (ddd, J = 7,3, 7,0, 1,5 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 7,3, 0,7 Hz, 1H), 8,14 (dd, J = 7,0, 1,5 Hz, 1H), 8,52 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 11,98 (s, 1H).
---	---

A continuación, usando los Compuestos de referencia 2-2 y 2-3, los Compuestos de referencia 3-2 y 3-3 se obtuvieron de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 3-1.

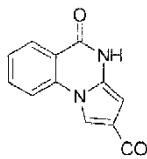
[Tabla 5]

4-Oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidine-7-carbonitrilo (Compuesto de referencia 3-2)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,99 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,81 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,27 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 12,07 (s, 1H).
	
7-Fluoro-5-oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]quinazolin-2-carbonitrilo (Compuesto de referencia 3-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,80 (td, J = 8,9, 2,9 Hz, 1H), 7,84 (dd, J = 8,9, 2,9 Hz, 1H), 8,18 (dd, J = 8,9, 4,3 Hz, 1H), 8,52 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 12,14 (s, 1H).
	

(Ejemplo de referencia 4: ácido 5-oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]quinazolin-2-carboxílico (Compuesto de referencia 4-1))

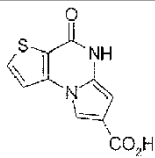
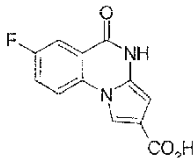
Una solución de 5-oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]quinazolin-2-carbonitrilo (Compuesto de referencia 3-1, 33,8 g, 0,162 mol) en ácido bromhídrico al 47% (400 mL) se agitó a 100 °C durante 4 horas. La solución de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y se añadió agua (1,0 L). El sólido precipitado se recolectó por filtración y se secó a 80 °C a presión reducida, para obtener el compuesto de referencia del título 4-1 (36,2 g, rendimiento: 98%) en forma de un polvo marrón.

[Tabla 6]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,86 (s, 1H), 7,47 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 7,81 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 8,20 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 8,22 (s, 1H), 11,80 (s, 1H), 12,30 (brs, 1H).
---	--

A continuación, usando los Compuestos de referencia 3-2 y 3-3, los Compuestos de referencia 4-2 y 4-3 se obtuvieron de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 4-1.

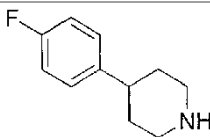
[Tabla 7]

ácido 4-oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidine-7-carboxílico (Compuesto de referencia 4-2)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,89 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 8,08 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,23 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 11,86 (s, 1H).
	
ácido 7-fluoro-5-oxo-4,5-dihidropirrollo[1,2-a]quinazolin-2-carboxílico (Compuesto de referencia 4-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 5,87 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,72 (td, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 7,81 (dd, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 8,24 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,29 (dd, J = 8,8, 4,4 Hz, 1H), 11,95 (s, 1H), 12,29 (s, 1H).
	

5 (Ejemplo de referencia 5: clorhidrato de 4-(4-fluorofenil)piperidina (Compuesto de referencia 5-1))

En una solución de clorhidrato de 4-(4-fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridina (1,07 g, 5,0 mmol) en metanol (20 mL), se añadió paladio sobre carbón al 10% (0,10 g) y se agitó durante la noche en una atmósfera de hidrógeno a temperatura ambiente. La mezcla se filtró usando Celite y se lavó con metanol (20 mL). El filtrado se concentró a presión reducida, para obtener el compuesto de referencia del título 5-1 (1,02 g, rendimiento: 94%) en forma de un sólido blanco amarillento.

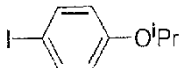
[Tabla 8]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,71-1,97 (m, 4H), 2,80-2,91 (m, 1H), 2,91-3,03 (m, 2H), 3,33-3,40 (m, 2H), 7,13-7,20 (m, 2H), 7,22-7,30 (m, 2H), 8,75 (s, 2H).
---	--

(Ejemplo de referencia 6: 4-Isopropoxyiodobenceno (Compuesto de referencia 6-1))

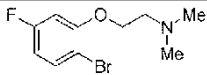
En una suspensión de 4-yodofenol (2,20 g, 10,0 mmol) y carbonato de potasio (2,77 g, 20,0 mmol) en N,N-dimetilformamida anhidra (40 mL), se añadió yoduro de isopropilo (1,10 mL, 11,0 mmol). La solución de reacción se agitó durante la noche a 80 °C. Después de dejar enfriar la solución de reacción hasta temperatura ambiente, la solución de reacción se diluyó con agua (200 mL) y se extrajo con éter dietílico (200 mL). La capa orgánica se lavó con salmuera (100 mL) y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Por concentración a presión reducida, se obtuvo el compuesto de referencia del título 6-1 (2,45 g, rendimiento: 94%) en forma de una sustancia oleosa marrón.

[Tabla 9]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,24 (d, J = 6,1 Hz, 6H), 4,55-4,61 (m, 1H), 6,76 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,56 (d, J = 9,0 Hz, 2H).
---	---

A continuación, usando 2-bromo-5-fluorofenol y clorhidrato de N-(2-cloroetil)dimetilamina, se obtuvo el Compuesto de referencia 6-2 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 6-1.

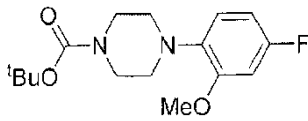
[Tabla 10]

[2-(2-Bromo-5-fluorofenoxi)etil]dimetilamina (Compuesto de referencia 6-2)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,24 (s, 6H), 2,66 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 4,14 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 6,74-6,80 (m, 1H), 7,10 (dd, J = 12,0, 3,1 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 8,9, 6,4 Hz, 1H).
	

5 **(Ejemplo de referencia 7: éster ter-butílico del ácido 4-(4-fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carboxílico (Compuesto de referencia 7-1))**

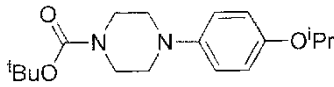
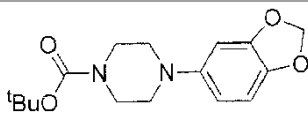
En una atmósfera de argón, en una suspensión de 1-Boc-piperazina (2,98 g, 16,0 mmol), acetato de paladio (115 mg, 0,0512 mmol), rac-BINAP (391 mg, 0,628 mmol) y ter-butoxido de sodio (2,10 g, 21,9 mmol) en tolueno anhidro (50 mL), se añadió 2-bromo-5-fluoroanisol (1,88 mL, 14,6 mmol) y la solución de reacción se calentó a reflujo durante la noche. Después de dejar enfriar la solución de reacción, se añadió solución acuosa saturada de cloruro de amonio (20 mL) y la solución de reacción se extrajo con acetato de etilo (100 mL). La capa orgánica se lavó con salmuera (100 mL) y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano / acetato de etilo), para obtener el compuesto de referencia del título 7-1 (2,63 g, rendimiento: 58%) en forma de una sustancia oleosa marrón.

15 [Tabla 11]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,41 (s, 9H), 2,80-2,86 (m, 4H), 3,39-3,46 (m, 4H), 3,79 (s, 3H), 6,65-6,70 (m, 1H), 6,84-6,90 (m, 2H).
---	--

A continuación, usando 1-Boc-piperazina y los Compuestos de referencia 6-1, 6-2 o compuestos asequibles en los comercios, se obtuvieron los Compuestos de referencia 7-2 a 7-4 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 7-1.

20 [Tabla 12]

éster ter-butílico del ácido 4-(4-isopropoxifenil)piperazin-1-carboxílico (Compuesto de referencia 7-2)	4-(4- ¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,21 (d, J = 6,1 Hz, 6H), 1,41 (s, 9H), 2,94 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 3,44 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 4,40-4,51 (m, 1H), 6,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,88 (d, J = 9,0 Hz, 2H).
	
éster ter-butílico del ácido 4-benzo[1,3]dioxol-5-il-piperazin-1-carboxílico (Compuesto de referencia 7-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,41 (s, 9H), 2,90-2,98 (m, 4H), 3,40-3,45 (m, 4H), 5,92 (s, 2H), 6,36 (dd, J = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 6,69 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 6,77 (d, J = 8,3 Hz, 1H).
	
éster ter-butílico del ácido 4-[2-(2-dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-carboxílico (Compuesto de referencia 7-4)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,41 (s, 9H), 2,23 (s, 6H), 2,64 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 2,85-2,90 (m, 4H), 3,35-3,45 (m, 4H), 4,04 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 6,63-6,70 (m, 1H), 6,84-6,90 (m, 2H).



(Ejemplo de referencia 8: diclorhidrato de 1-(4-fluoro-2-metoxifenil)piperazina (Compuesto de referencia 8-1))

- 5 Una solución de cloruro de hidrógeno 4 M en 1,4-dioxano (20 mL) se añadió a una solución de éster ter-butilico del ácido 4-(4-fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carboxílico (Compuesto de referencia 7-1, 2,59 g, 8,34 mmol) en metanol (5 mL) y se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. El sólido precipitado se recolectó por filtración y se secó a presión reducida, para obtener el compuesto de referencia del título 8-1 (1,55 g, rendimiento: 66%) en forma de un polvo incoloro.

[Tabla 13]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,10-3,23 (m, 8H), 3,81 (s, 3H), 6,10 (brs, 2H), 6,68-6,76 (m, 1H), 6,90-7,00 (m, 2H), 9,28 (brs, 1H).
--	---

- 10 A continuación, usando los Compuestos de referencia 7-2 a 7-5, se obtuvieron los Compuestos de referencia 8-2 a 8-4 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto de referencia 8-1.

[Tabla 14]

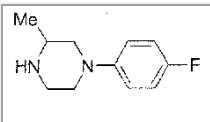
clorhidrato de 1-(4-isopropoxifenil)piperazina (Compuesto de referencia 8-2)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,24 (d, J = 5,9 Hz, 6H), 3,32 (s, 4H), 3,42 (s, 4H), 4,49-4,59 (m, 1H), 6,91 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,13 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 9,47 (s, 2H).
diclorhidrato de 1-benzo[1,3]dioxol-5-il-piperazina (Compuesto de referencia 8-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,18-3,30 (m, 8H), 5,95 (s, 2H), 6,44 (dd, J = 8,2, 2,1 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 7,00 (brs, 2H), 9,38 (brs, 1H).
triclorhidrato de 1-[2-(2-dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazina (Compuesto de referencia 8-4)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,86 (d, J = 4,9 Hz, 6H), 3,10-3,30 (m, 8H), 3,53-3,60 (m, 2H), 4,38-4,60 (m, 2H), 6,00 (brs, 1H), 6,77-6,83 (m, 1H), 6,99-7,08 (m, 1H), 9,47 (brs, 2H), 11,10 (brs, 1H).

(Ejemplo de referencia 9: 1-(4-Fluorofenil)-3-metilpiperazina (Compuesto de referencia 9-1))

- 15 En una atmósfera de argón, se añadió 1-bromo-4-fluorobenceno (3,14 mL, 28,5 mmol) a una solución de 2-metilpiperazina (3,15 g, 31,3 mmol), acetato de paladio (220 mg, 0,980 mmol), rac-BINAP (750 mg, 1,20 mmol) y ter-butóxido de sodio (4,00 g, 42,0 mmol) en tolueno anhidro (90 mL). La solución de reacción se calentó a reflujo durante la noche y se dejó enfriar y luego se añadió agua (30 mL). La capa de tolueno se lavó con salmuera (30 mL)

y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano / acetato de etilo), para obtener el compuesto de referencia del título 9-1 (4,24 g, rendimiento: 77%) en forma de una sustancia oleosa marrón.

[Tabla 15]

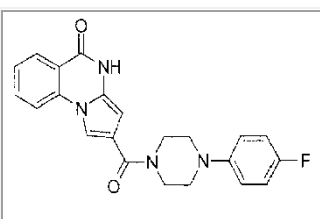
	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,00 (d, J = 6,1 Hz, 3H), 2,12 (t, J = 10,7 Hz, 1H), 2,20 (brs, 1H), 2,44-2,55 (m, 1H), 2,70-2,80 (m, 2H), 2,90-2,95 (m, 1H), 3,35-3,43 (m, 2H), 6,85-6,94 (m, 2H), 6,98-7,05 (m, 2H).
---	---

5

(Ejemplo 1: 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-1))

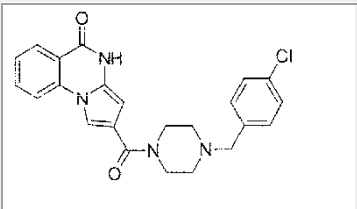
Diisopropiletilamina (11,4 mL, 65,5 mmol) y HCTU (8,11 g, 19,6 mmol) se añadieron a una solución de ácido 5-oxo-4,5-dihidropirrolo[1,2-a]quinazolin-2-carboxílico (Compuesto de referencia 4-1, 3,00 g, 13,1 mmol) y diclorhidrato de 4-fluorofenilpiperazina (3,98 g, 15,7 mmol) en N,N-dimetilformamida (50 mL) y la solución de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Agua (100 mL) y acetato de etilo (100 mL) se añadieron a esta solución de reacción y la solución de reacción se agitó durante 10 minutos. El sólido precipitado en la capa orgánica se recolectó por filtración y se secó a 50 °C a presión reducida, para obtener el Compuesto del título 1-1 (2,80 g) en forma de un polvo marrón pálido. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (100 mL), se lavó con salmuera (100 mL), se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se concentró a presión reducida y el sólido precipitado se recolectó por filtración y se secó a 50 °C a presión reducida para obtener el Compuesto del título 1-1 (0,48 g) en forma de un polvo marrón pálido (cantidad total: 3,28 g, rendimiento: 63%).

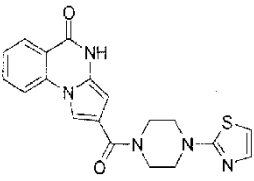
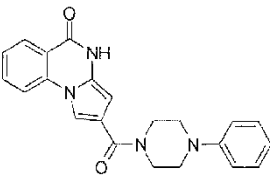
[Tabla 16]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,15-3,25 (m, 4H), 3,70-3,90 (m, 4H), 5,76 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,96-7,03 (m, 2H), 7,04-7,12 (m, 2H), 7,40-7,48 (m, 1H), 7,79-7,88 (m, 1H), 7,96 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).
--	--

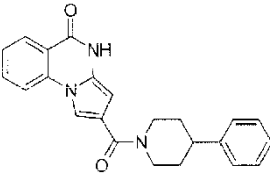
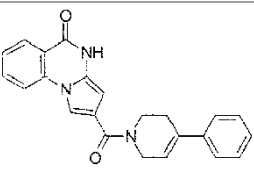
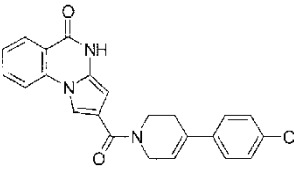
A continuación, usando los Compuestos de referencia 4-1 a 4-3, 5-1, 8-1 a 8-5, 9-1 y los compuestos asequibles en los comercios, se obtuvieron los Compuestos 1-2 a 1-58 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto 1-1.

[Tabla 17]

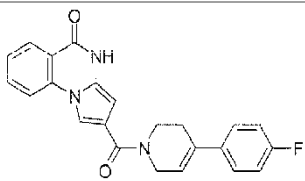
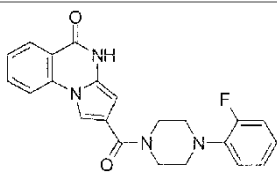
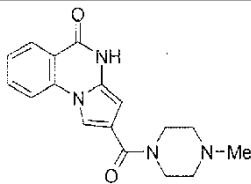
2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-2)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,30-2,50 (m, 4H), 3,51 (s, 2H), 3,55-3,70 (m, 4H), 5,71 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,30-7,50 (m, 5H), 7,81 (t, J = 7,0 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,10-8,13 (m, 2H), 11,78 (s, 1H).
	
2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-3)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,48-3,51 (m, 4H), 3,79-3,81 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,91 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 11,81 (s, 1H).

	
2-(4-Fenilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-4)	¹H-RMN (500 MHz, DMSO-d₆) δ 3,19 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 3,78-3,85 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,82 (tt, J = 7,5, 1,3 Hz, 1H), 6,97 (dt, J = 7,5, 1,3 Hz, 2H), 7,24 (td, J = 7,5, 1,3 Hz, 2H), 7,45 (ddd, J = 8,4, 7,5, 1,4 Hz, 1H), 7,82 (ddd, J = 8,4, 7,5, 1,4 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,12-8,14 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
	

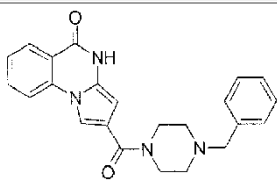
[Tabla 18]

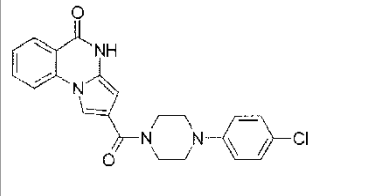
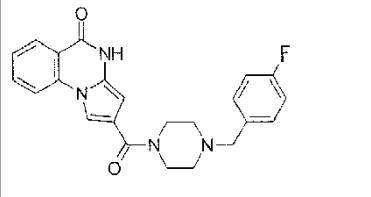
2-(4-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-5)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1,49-1,71 (m, 2H), 1,75-1,96 (m, 2H), 2,77-3,11 (m, 3H), 4,29-4,67 (m, 2H), 5,75 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,13-7,37 (m, 5H), 7,44 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,77-7,86 (m, 1H), 7,92 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,16 (m, 2H), 11,78 (s, 1H).
	
2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-6)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,60 (s, 2H), 3,86 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 4,34 (s, 2H), 5,80 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,21 (s, 1H), 7,27 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 7,43-7,45 (m, 1H), 7,47 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 7,82 (dd, J = 8,0, 1,7 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 8,0, 1,7 Hz, 1H), 8,15 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 11,82 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-7)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,58 (s, 2H), 3,85 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 4,34 (s, 2H), 5,80 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,25 (s, 1H), 7,40-7,50 (m, 5H), 7,82 (ddd, J = 8,1, 7,3, 1,4 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 8,1, 1,4 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 11,81 (s, 1H).
	

[Tabla 19]

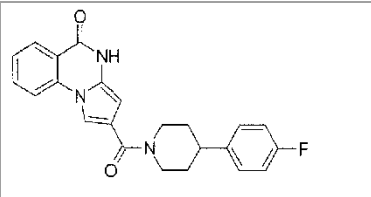
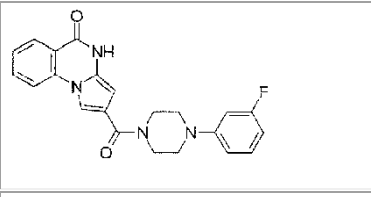
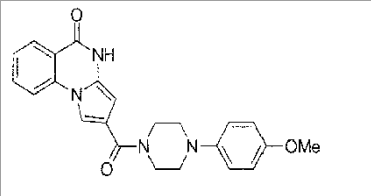
2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-8)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,58 (s, 2H), 3,85 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 4,33 (s, 2H), 5,80 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,18 (s, 1H), 7,19 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 7,43-7,47 (m, 1H), 7,49-7,52 (m, 2H), 7,82 (ddd, J = 8,0, 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 11,80 (s, 1H).
	
2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-9)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,03-3,07 (m, 4H), 3,79-3,86 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,98-7,20 (m, 4H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,6 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,11-8,15 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).
	
2-[4-(Metilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-10)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,51-2,55 (m, 4H), 2,73 (s, 3H), 3,00-3,15 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,46 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,84 (td, J = 7,9, 1,4 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,14 (dd, J = 7,9, 1,4 Hz, 1H), 11,85 (s, 1H).
	

[Tabla 20]

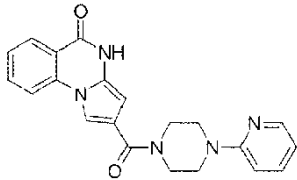
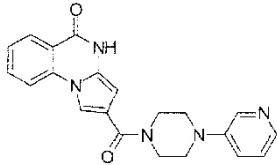
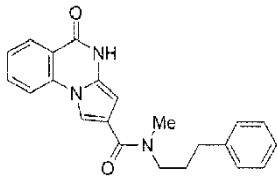
2-[4-(Bencilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-11)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,30-2,50 (m, 4H), 3,52 (s, 2H), 3,60-3,70 (m, 4H), 5,71 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,24-7,40 (m, 5H), 7,43 (ddd, J = 8,0, 7,0, 1,0 Hz, 1H), 7,80 (ddd, J = 8,0, 7,0, 1,5 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,05-8,14 (m, 2H), 11,77 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-12)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,20 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 3,79 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 5,76 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 6,98 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,26 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,45 (ddd, J = 8,2, 7,5, 1,3 Hz, 1H), 7,82 (ddd, J = 8,2, 7,5, 1,3 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 2,0

	Hz, 1H), 8,11-8,14 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).
2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-13)	^1H -RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 2,39 (t, J = 4,9 Hz, 4H), 3,50 (s, 2H), 3,65 (s, 4H), 5,71 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,13-7,18 (m, 2H), 7,34-7,38 (m, 2H), 7,43 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 7,81 (ddd, J = 8,0, 7,3, 1,6 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,11 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,12 (dd, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 11,78 (s, 1H).
	

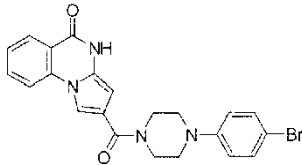
[Tabla 21]

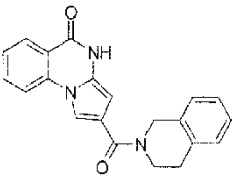
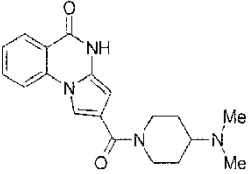
2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-14)	^1H -RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 1,48-1,69 (m, 2H), 1,75-1,90 (m, 2H), 2,80-3,16 (m, 3H), 4,48 (s, 2H), 5,75 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,09-7,17 (m, 2H), 7,29-7,36 (m, 2H), 7,44 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,76-7,86 (m, 1H), 7,92 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13-8,14 (m, 2H), 11,78 (s, 1H).
	
2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-15)	^1H -RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 3,22-3,28 (m, 4H), 3,77-3,82 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,58 (td, J = 8,2, 2,2 Hz, 1H), 6,75-6,81 (m, 2H), 7,24 (q, J = 8,2 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,1 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 7,9, 1,1 Hz, 2H), 11,81 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-16)	^1H -RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 3,03-3,07 (m, 4H), 3,69 (s, 3H), 3,76-3,82 (m, 4H), 5,75 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 9,3 Hz, 2H), 6,94 (d, J = 9,3 Hz, 2H), 7,44 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,8, 1,4 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,11-8,14 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).
	

[Tabla 22]

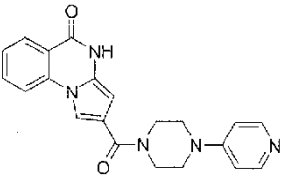
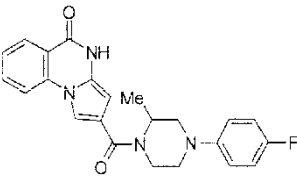
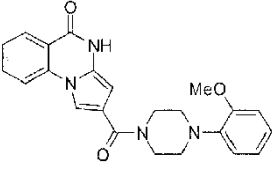
2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-17)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,55-3,59 (m, 4H), 3,74-3,79 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,67 (dd, J = 7,0, 5,0 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,54-7,59 (m, 1H), 7,82 (td, J = 7,7, 1,4 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,12-8,15 (m, 3H), 11,81 (s, 1H).
	
2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-18)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,25-3,29 (m, 4H), 3,79-3,84 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,24 (dd, J = 8,5, 4,5 Hz, 1H), 7,36 (ddd, J = 8,5, 2,9, 1,2 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,3 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,03 (dd, J = 4,5, 1,2 Hz, 1H), 8,12-8,15 (m, 2H), 8,34 (d, J = 2,9 Hz, 1H), 11,82 (s, 1H).
	
2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-19)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,86-1,90 (m, 2H), 2,58 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,48 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 5,76 (s, 1H), 7,20-7,24 (m, 5H), 7,30-7,34 (m, 1H), 7,44 (t, J = 7,4 Hz, 1H), 7,82 (ddd, J = 7,9, 7,4, 1,5 Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 8,13 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,77 (s, 1H).
	

[Tabla 23]

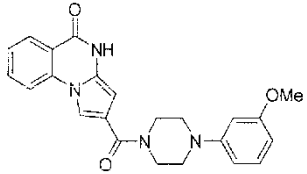
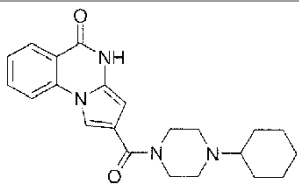
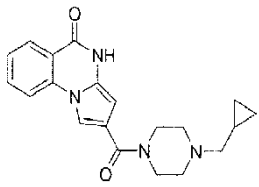
2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-20)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,15-3,25 (m, 4H), 3,75-3,85 (m, 4H), 5,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,40-7,47 (m, 1H), 7,79-7,85 (m, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
	
2-(3,4-Dihidroisoquinolin-2(1H)-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-21)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,87-2,93 (m, 2H), 3,83-3,90 (m, 2H), 4,76-4,86 (m, 2H), 5,80 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,18-7,22 (m, 4H), 7,44 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,7, 1,3 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,12-8,15 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).

	
2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-22)	¹H-RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 1,65-1,76 (m, 2H), 2,12-2,19 (m, 2H), 2,86-2,91 (m, 1H), 2,90 (s, 6H), 3,47-3,56 (m, 2H), 4,65-4,74 (m, 2H), 5,90 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,47 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 8,0, 1,2 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,24 (dd, J = 8,0, 1,2 Hz, 1H).
	

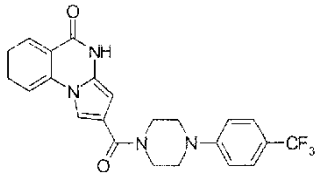
[Tabla 24]

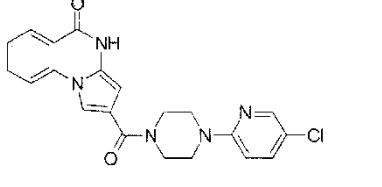
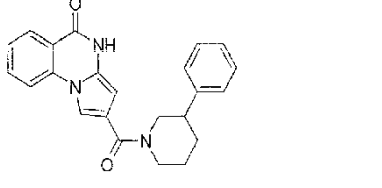
2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-23)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 3,41-3,45 (m, 4H), 3,76-3,82 (m, 4H), 5,78 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 5,1, 1,5 Hz, 2H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,11-8,15 (m, 2H), 8,19 (dd, J = 5,1, 1,5 Hz, 2H), 11,82 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-24)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1,35 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 2,60-2,70 (m, 1H), 2,78-2,84 (m, 1H), 3,30-3,50 (m, 2H), 3,56 (d, J = 12,0 Hz, 1H), 4,26 (d, J = 12,0 Hz, 1H), 4,67 (s, 1H), 5,74 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,94-7,00 (m, 2H), 7,03-7,11 (m, 2H), 7,44 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,82 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,80 (s, 1H).
	
2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-25)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,97-3,00 (m, 4H), 3,78-3,83 (m, 4H), 3,80 (s, 3H), 5,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,87-7,01 (m, 4H), 7,44 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 11,82 (s, 1H).
	

[Tabla 25]

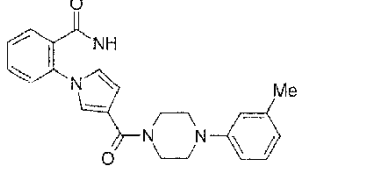
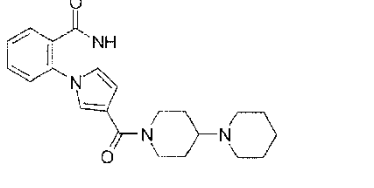
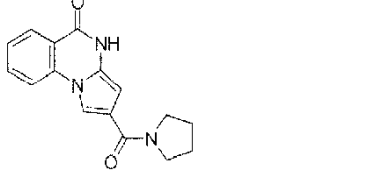
2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-26)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,17-3,21 (m, 4H), 3,72 (s, 3H), 3,76-3,81 (m, 4H), 5,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,40 (dd, J = 8,2, 2,2 Hz, 1H), 6,49 (t, J = 2,2 Hz, 1H), 6,56 (dd, J = 8,2, 2,2 Hz, 1H), 7,13 (t, J = 8,2 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 11,78 (s, 1H).
	
2-[4-(Ciclohexil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-27)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,00-1,30 (m, 5H), 1,50-1,60 (m, 1H), 1,64-1,82 (m, 4H), 2,10-2,35 (m, 1H), 2,40-2,60 (m, 4H), 3,50-3,70 (m, 4H), 5,70 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,43 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,77-7,84 (m, 1H), 7,89 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,79 (s, 1H).
	
2-[4-(Ciclopropilmetil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-28)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 0,03-0,12 (m, 2H), 0,44-0,50 (m, 2H), 0,80-0,90 (m, 1H), 2,21 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 2,40-2,50 (m, 4H), 3,50-3,80 (m, 4H), 5,71 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,40-7,46 (m, 1H), 7,78-7,85 (m, 1H), 7,91 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,10-8,14 (m, 2H), 11,79 (s, 1H).
	

[Tabla 26]

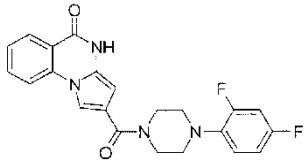
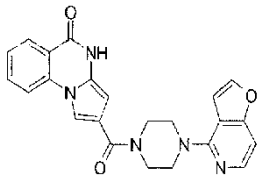
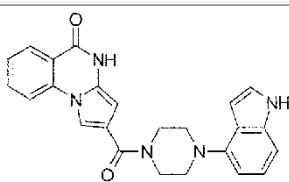
2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-29)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,36-3,41 (m, 4H), 3,78-3,84 (m, 4H), 5,78 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,09 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,54 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,82 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,12-8,14 (m, 2H), 11,83 (s, 1H).
	
2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-30)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,55-3,62 (m, 4H), 3,73-3,80 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 9,1 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 9,1, 2,6 Hz, 1H), 7,82 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,12-8,13 (m,

	2H), 8,14 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 11,82 (s, 1H).
2-(3-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-31)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,50-1,63 (m, 1H), 1,75-1,85 (m, 2H), 1,92-2,01 (m, 1H), 2,70-2,78 (m, 2H), 2,84-2,89 (m, 1H), 4,28-4,49 (m, 2H), 5,73 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,21-7,25 (m, 1H), 7,28-7,33 (m, 4H), 7,43 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,81 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,09-8,13 (m, 2H), 11,77 (s, 1H).
	

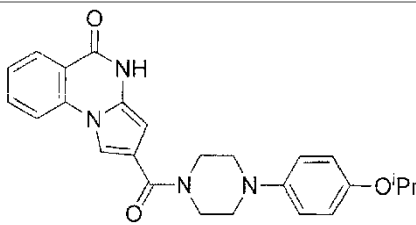
[Tabla 27]

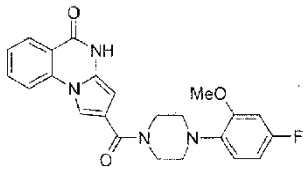
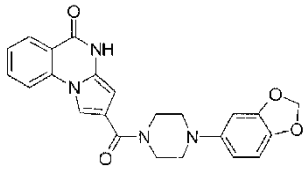
2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-32)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,26 (s, 3H), 3,12-3,21 (m, 4H), 3,74-3,84 (m, 4H), 5,76 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 6,64 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 6,70-6,85 (m, 2H), 7,12 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,79-7,85 (m, 1H), 7,96 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,10-8,16 (m, 2H), 11,80 (s, 1H).
	
2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-33)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,23-1,56 (m, 8H), 1,66-1,84 (m, 2H), 2,36-2,55 (m, 6H), 2,78-2,98 (m, 1H), 4,15-4,52 (m, 2H), 5,70 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 7,43 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,77-7,85 (m, 1H), 7,89 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,08-8,16 (m, 2H), 11,78 (s, 1H).
	
2-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-34)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,78-2,00 (m, 4H), 3,40-3,50 (m, 2H), 3,65-3,80 (m, 2H), 5,89 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,40-7,50 (m, 1H), 7,78-7,85 (m, 1H), 7,99 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 1H), 8,19 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 11,79 (s, 1H).
	

[Tabla 28]

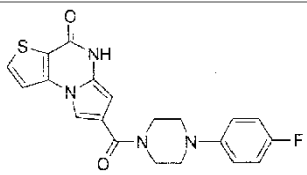
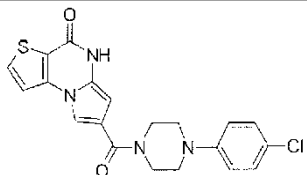
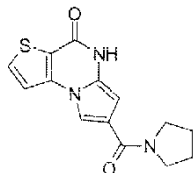
2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-35)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,97-3,02 (m, 4H), 3,78-3,85 (m, 4H), 5,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,99-7,05 (m, 1H), 7,08-7,15 (m, 1H), 7,20-7,27 (m, 1H), 7,45 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,12-8,15 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
	
2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-36)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,71-3,76 (m, 4H), 3,81-3,87 (m, 4H), 5,79 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,08 (dd, J = 5,8, 0,9 Hz, 1H), 7,22 (dd, J = 2,3, 0,9 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,83 (td, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 5,8 Hz, 1H), 8,12-8,16 (m, 2H), 11,83 (s, 1H).
	
2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-37)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,13 3,18 (m, 4H), 3,87-3,92 (m, 4H), 5,78 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,44-6,51 (m, 2H), 6,98 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 7,27 (t, J = 2,8 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,6, 1,7 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,11-8,16 (m, 2H), 11,07 (s, 1H), 11,82 (s, 1H).
	

[Tabla 29]

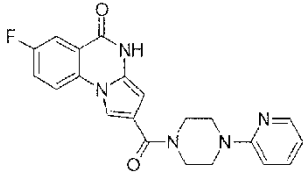
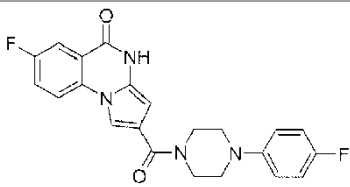
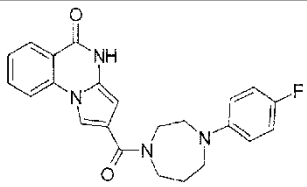
2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-38)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,22 (d, J = 5,9 Hz, 6H), 2,99-3,11 (m, 4H), 3,70-3,88 (m, 4H), 4,40-4,54 (m, 1H), 5,76 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,91 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,45 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,82 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,09-8,17 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-39)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,88-2,97 (m, 4H), 3,70-3,87 (m, 4H), 3,81 (s, 3H), 5,76 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,67-6,72 (m, 1H), 6,86-6,94 (m, 2H), 7,44 (dd, J = 7,8, 7,3 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 7,8, 6,8 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 1,5 Hz,

	1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-yl)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-40)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,00-3,10 (m, 4H), 3,70-3,85 (m, 4H), 5,76 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 5,93 (s, 2H), 6,38 (dd, J = 8,5, 2,2 Hz, 1H), 6,72 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,45 (dd, J = 8,0, 7,6 Hz, 1H), 7,75-7,85 (m, 1H), 7,95 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,16 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
	

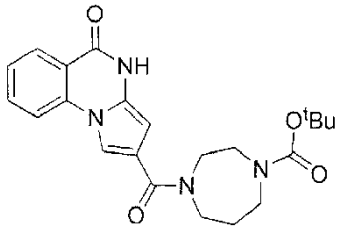
[Tabla 30]

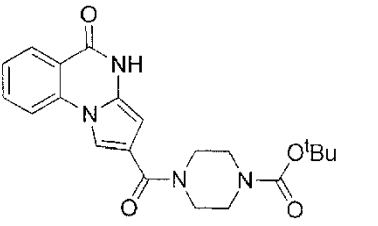
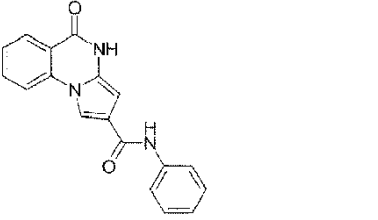
7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 1-41)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,10-3,20 (m, 4H), 3,70-3,90 (m, 4H), 5,80 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,98-7,12 (m, 4H), 7,82 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,23 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 11,86 (s, 1H).
	
7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 1-42)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,15-3,30 (m, 4H), 3,70-3,90 (m, 4H), 5,80 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,98 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,26 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,82 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,23 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 11,87 (s, 1H).
	
7-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 1-43)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,77-2,00 (m, 4H), 3,40-3,55 (m, 2H), 3,60-3,80 (m, 2H), 5,94 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,23 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 11,84 (s, 1H).
	

[Tabla 31]

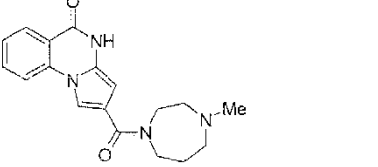
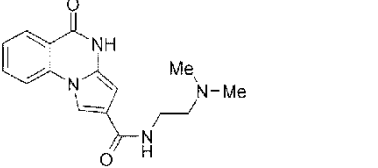
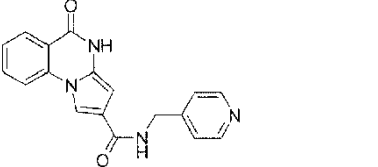
7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pinolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-44)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,54-3,60 (m, 4H), 3,73-3,79 (m, 4H), 5,78 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,67 (dd, J = 7,0, 4,9 Hz, 1H), 6,86 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,57 (ddd, J = 8,8, 7,0, 2,0 Hz, 1H), 7,74 (td, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,14 (dd, J = 4,9, 2,0 Hz, 1H), 8,23 (dd, J = 8,8, 4,3 Hz, 1H), 11,97 (s, 1H).
	
7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-45)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 3,10-3,14 (m, 4H), 3,76-3,82 (m, 4H), 5,77 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,98-7,12 (m, 4H), 7,75 (td, J = 8,8, 3,2 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 8,8, 3,2 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,23 (dd, J = 8,8, 4,3 Hz, 1H), 11,97 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Fluorofenil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-46)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆ , 100 °C) δ 1,90-2,00 (m, 2H), 3,55 (t, J = 6,1 Hz, 2H), 3,58-3,65 (m, 4H), 3,82 (t, J = 5,8 Hz, 2H), 5,71 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,70-6,80 (m, 2H), 6,90-7,00 (m, 2H), 7,43 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,63 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,77-7,81 (m, 1H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,15 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 11,44 (s, 1H).
	

[Tabla 32]

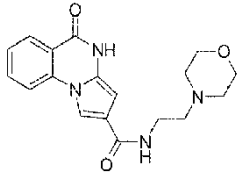
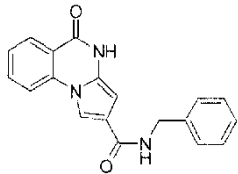
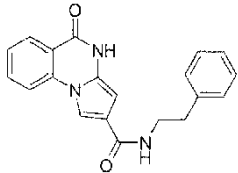
2-[4-(ter-Butoxicarbonil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-47)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆ , 100 °C) δ 1,39 (s, 9H), 1,76-1,82 (m, 2H), 3,42 (t, J = 5,8 Hz, 2H), 3,51 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 3,64 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 3,75 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 5,79 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,41-7,45 (m, 1H), 7,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,77-7,82 (m, 1H), 8,01 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 8,15 (dd, J = 7,9, 1,2 Hz, 1H), 11,46 (s, 1H).
	
2-[4-(ter-Butoxicarbonil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-48)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,42 (s, 9H), 3,30-3,45 (m, 4H), 3,57-3,70 (m, 4H), 5,74 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,40-7,50 (m, 1H), 7,79-7,83 (m, 1H), 7,92 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,10-8,16 (m, 2H), 11,80 (s, 1H).

	
2-(Fenilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-49)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 6,27 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,07 (tt, J = 8,3, 1,1 Hz, 1H), 7,34 (t, J = 8,3 Hz, 2H), 7,47 (t, J = 8,1 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 8,3, 1,1 Hz, 2H), 7,85 (td, J = 8,1, 1,3 Hz, 1H), 8,09 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 8,15 (dd, J = 8,1, 1,3 Hz, 1H), 8,29 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 9,81 (s, 1H), 11,96 (s, 1H).
	

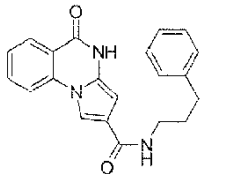
[Tabla 33]

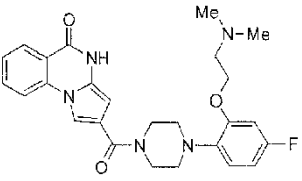
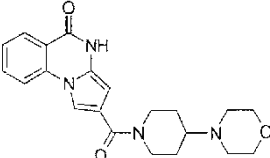
2-(4-Metilhomopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-50)	¹H-RMN (500 MHz, DMSO-d₆, 100 °C) δ 1,15-1,90 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,55-2,64 (m, 2H), 2,65-2,83 (m, 2H), 3,60-3,73 (m, 4H), 5,79 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,43 (ddd, J = 8,2, 7,3, 0,9 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,79 (ddd, J = 8,2, 7,3, 1,5 Hz, 1H), 8,03 (dd, J = 8,2, 0,9 Hz, 1H), 8,15 (dd, J = 7,3, 1,5 Hz, 1H), 11,43 (s, 1H).
	
2-[(2-Dimetilaminoetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-51)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,21 (s, 6H), 2,35-2,45 (m, 2H), 3,20-3,40 (m, 2H), 6,04 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,40-7,48 (m, 1H), 7,79-7,86 (m, 1H), 7,95-8,14 (m, 4H), 11,86 (s, 1H).
	
2-[(Piridin-4-ilmetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-52)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 4,46 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 6,12 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 7,30 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 7,45 (t, J = 8,3 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 8,3, 1,6 Hz, 1H), 8,06 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 8,3, 1,6 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,50 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 8,72 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 11,90 (s, 1H).
	

[Tabla 34]

2-[2-(Morfolin-4-iletil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-53)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,35-2,48 (m, 4H), 2,49-2,55 (m, 2H), 3,27-3,41 (m, 2H), 3,58 (t, J = 4,5 Hz, 4H), 6,04 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,44 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,82 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,95-8,10 (m, 3H), 8,12 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 11,86 (s, 1H).
	
2-(Bencilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-54)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 4,45 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 6,11 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,22-7,35 (m, 5H), 7,44 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,9, 1,3 Hz, 1H), 8,03 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,13 (dd, J = 7,9, 1,3 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,61 (t, J = 6,0 Hz, 1H), 11,87 (s, 1H).
	
2-(2-Feniletilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-55)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,83 (t, J = 7,4 Hz, 2H), 3,44 (td, J = 7,4, 5,6 Hz, 2H), 6,04 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,18-7,32 (m, 5H), 7,44 (t, J = 8,1 Hz, 1H), 7,81 (td, J = 8,1, 1,5 Hz, 1H), 8,03 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 8,06 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,12 (dd, J = 8,1, 1,5 Hz, 1H), 8,15 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 11,85 (s, 1H).
	

[Tabla 35]

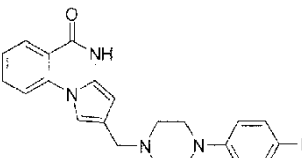
12-(3-Fenilpropilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-56)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,77-1,85 (m, 2H), 2,63 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 3,24 (td, J = 7,6, 5,6 Hz, 2H), 6,07 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,16-7,31 (m, 5H), 7,44 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,81 (td, J = 8,0, 1,3 Hz, 1H), 8,04 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,07 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,07 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 8,12 (dd, J = 8,0, 1,3 Hz, 1H), 11,85 (s, 1H).
	
2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-57)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,25 (s, 6H), 2,66 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 2,90-3,03 (m, 4H), 3,70-3,83 (m, 4H), 4,06 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 5,75 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,65-6,72 (m, 1H), 6,86-6,91 (m, 2H), 7,42-7,48 (m, 1H), 7,79-7,85 (m, 1H), 7,95 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,10-8,17 (m, 2H), 11,81 (s, 1H).

	
2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 1-58)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1,39-1,51 (m, 2H), 1,88-2,02 (m, 2H), 2,47-2,49 (m, 2H), 2,84-2,90 (m, 3H), 3,41-3,46 (m, 2H), 3,59-3,79 (m, 4H), 4,34-4,48 (m, 2H), 5,72 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,45 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,82 (td, J = 7,6, 1,7 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,10-8,15 (m, 2H), 11,82 (s, 1H).
	

(Ejemplo 2: 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-1))

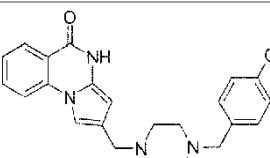
5 Bajo enfriamiento en hielo, hidruro de litio y aluminio (657 mg, 17,3 mmol) se añadió a una solución de 2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (el Compuesto 1-1 anterior, 3,38 g, 8,66 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (75 mL). Esta solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una pequeña cantidad de acetato de etilo se añadió gota a gota a la solución de reacción y luego se añadieron una solución acuosa saturada de tartrato de sodio y potasio tetrahidrato (100 mL) y agua (100 mL) de modo secuencial. La mezcla se extrajo dos veces con cloroformo (100 mL). La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se recolectó por filtración con etanol, para obtener el compuesto del título (2,85 g, rendimiento: 87%) en forma de un polvo amarillo pálido.

[Tabla 36]

	¹H-RMN (500 MHz, DMSO-d₆) δ 2,45-2,60 (m, 4H), 3,00-3,15 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,90-6,98 (m, 2H), 7,00-7,10 (m, 2H), 7,36 (dd, J = 8,0, 7,3 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,74-7,80 (m, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,66 (s, 1H).
---	--

A continuación, usando cualquiera de los Compuestos 1-2 a 1-45, 1-57 y 1-58, se obtuvieron los Compuestos 2-2 a 2-47 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto 2-1.

15 [Tabla 37]

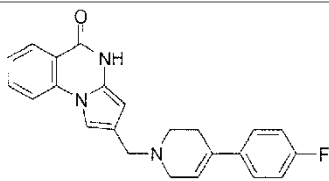
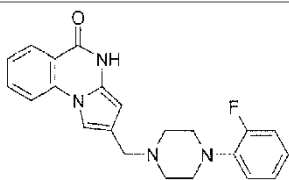
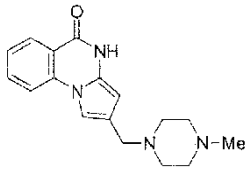
2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-2)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,20-2,60 (m, 8H), 3,37 (s, 2H), 3,44 (s, 2H), 5,52 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,29-7,40 (m, 5H), 7,42 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,75 (ddd, J = 8,5, 7,1, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,1, 1,5 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	
2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-3)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,51-2,53 (m, 4H), 3,38-3,41 (m, 4H), 3,45 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 7,15 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).

2-(4-Fenilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-4)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,54 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 3,13 (t, J = 5,0 Hz, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,76 (tt, J = 7,5, 1,3 Hz, 1H), 6,91 (dt, J = 7,5, 1,3 Hz, 2H), 7,19 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 7,36 (ddd, J = 8,0, 7,3, 1,3 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (ddd, J = 8,0, 7,3, 1,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 8,0, 1,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,3, 1,3 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).

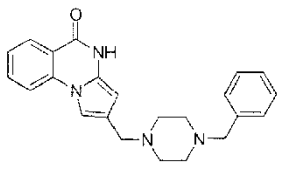
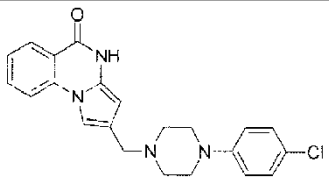
[Tabla 38]

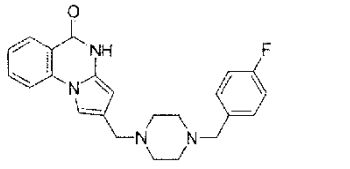
2-(4-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-5)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,57-1,82 (m, 4H), 1,97-2,12 (m, 1H), 2,40-2,60 (m, 2H), 2,93-3,10 (m, 2H), 3,36-3,51 (m, 2H), 5,54-5,61 (m, 1H), 7,17 (t, J = 7,2 Hz, 1H), 7,20-7,33 (m, 4H), 7,36 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,43-7,51 (m, 1H), 7,73-7,81 (m, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,2 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-6)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,49 (s, 2H), 2,68 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 3,10 (s, 2H), 3,50 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,15 (s, 1H), 7,23 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 7,30-7,38 (m, 3H), 7,42 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J = 8,0, 7,3, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,80 (s, 1H).
2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pinolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-7)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,46 (s, 2H), 2,67 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 3,09 (d, J = 3,2 Hz, 2H), 3,50 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,20 (s, 1H), 7,34-7,39 (m, 3H), 7,43-7,46 (m, 2H), 7,49 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J = 8,0, 7,3, 1,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).

[Tabla 39]

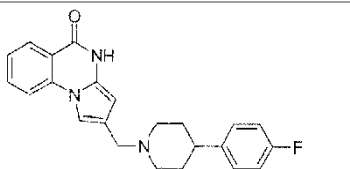
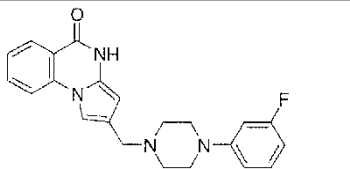
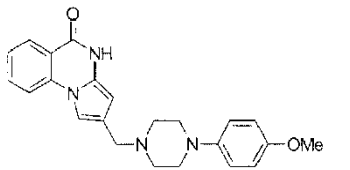
2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-8)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,47 (s, 2H), 2,67 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 3,09 (s, 2H), 3,50 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,12 (s, 1H), 7,14 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 7,36 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,44-7,47 (m, 2H), 7,49 (brs, 1H), 7,76 (ddd, J = 8,1, 7,3, 1,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,1, 1,6 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-9)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,53-2,61 (m, 4H), 2,98-3,05 (m, 4H), 3,45 (s, 2H), 5,58 (s, 1H), 6,92-7,15 (m, 4H), 7,36 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,77 (td, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-(4-Metilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-10)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,14 (s, 3H), 2,22-2,32 (m, 4H), 2,35-2,44 (m, 4H), 3,35 (s, 2H), 5,53 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,35 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,43 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,76 (td, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	

[Tabla 40]

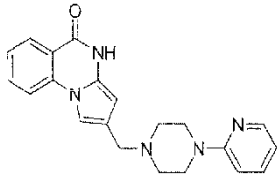
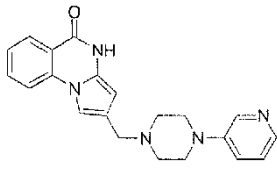
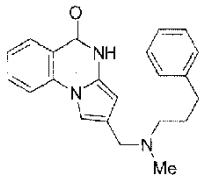
2-(4-Bencilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-11)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,20-2,60 (m, 8H), 3,36 (s, 2H), 3,45 (s, 2H), 5,52 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,20 - 7,38 (m, 6H), 7,43 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,75 (td, J = 7,3, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,3, 1,5 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-12)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,40-2,60 (m, 4H), 3,13 (t, J = 4,8 Hz, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,21 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,36 (ddd, J = 8,2, 7,3, 1,3 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J = 8,2, 7,3, 1,3 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
	

2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-13)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,37 (brs, 8H), 3,36 (s, 2H), 3,43 (s, 2H), 5,52 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,10-7,14 (m, 2H), 7,29-7,32 (m, 2H), 7,35 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,42 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,75 (ddd, J = 8,0, 7,6, 1,6 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,6, 1,6 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	

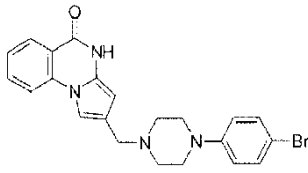
[Tabla 41]

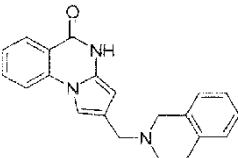
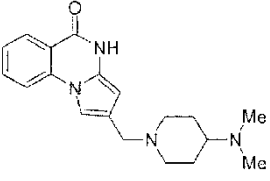
2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-14)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,53-1,79 (m, 4H), 1,95-2,08 (m, 2H), 2,43-2,54 (m, 1H), 2,99 (d, J = 11,5 Hz, 2H), 3,41 (s, 2H), 5,56 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,05-7,14 (m, 2H), 7,24-7,32 (m, 2H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,72-7,80 (m, 1H), 7,94 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,2 Hz, 1H), 11,66 (s, 1H).
	
2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-15)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,51-2,54 (m, 4H), 3,15-3,19 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,52 (td, J = 8,1, 2,1 Hz, 1H), 6,69-6,75 (m, 2H), 7,19 (q, J = 8,1 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-16)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,52-2,55 (m, 4H), 2,99-3,03 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 3,67 (s, 3H), 5,57 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 6,87 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,36 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,6 Hz, 1H), 11,66 (s, 1H).
	

[Tabla 42]

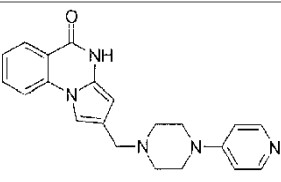
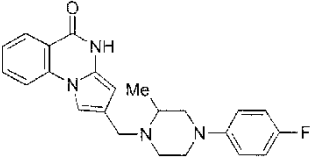
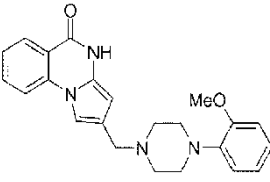
2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-17)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,46-2,49 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 3,45-3,49 (m, 4H), 5,58 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,62 (dd, J = 7,0, 5,0 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,51 (ddd, J = 8,5, 7,0, 1,5 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 5,0, 1,5 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
	
2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-18)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,53-2,58 (m, 4H), 3,17-3,22 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,19 (dd, J = 8,3, 4,6 Hz, 1H), 7,30 (ddd, J = 8,3, 2,9, 1,2 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 8,1 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,1, 1,3 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,1, 1,3 Hz, 1H), 8,28 (d, J = 2,9 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-19)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,71-1,79 (m, 2H), 2,18 (s, 3H), 2,36 (s, 2H), 2,59 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 3,41 (s, 2H), 5,56 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,11-7,15 (m, 1H), 7,17-7,25 (m, 4H), 7,36 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,77 (ddd, J = 8,0, 7,6, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 7,6, 1,5 Hz, 1H), 11,66 (s, 1H).
	

[Tabla 43]

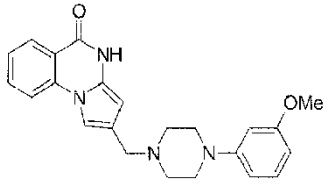
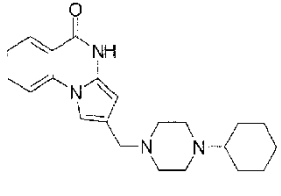
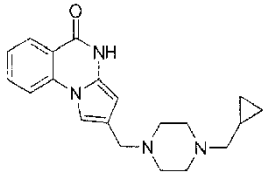
2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-20)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,40-2,60 (m, 4H), 3,00-3,20 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,88 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,29-7,40 (m, 3H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J = 8,5, 8,3, 1,5 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,3, 1,5 Hz, 1H), 11,82 (br s, 1H).
	
2-(1,2,3,4-Tetrahidroisoquinolin-2(1H)-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-21)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,68-2,73 (m, 2H), 2,79-2,84 (m, 2H), 3,56 (s, 4H), 5,59 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,00-7,11 (m, 4H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,51 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,76 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).

	
2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-22)	^1H-RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 1,55-1,66 (m, 2H), 1,90-1,97 (m, 2H), 2,10-2,18 (m, 2H), 2,40 (s, 6H), 2,41-2,47 (m, 1H), 3,09-3,15 (m, 2H), 3,56 (s, 2H), 5,77 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,35-7,39 (m, 2H), 7,75-7,82 (m, 2H), 8,19 (d, J = 8,0 Hz, 1H).
	

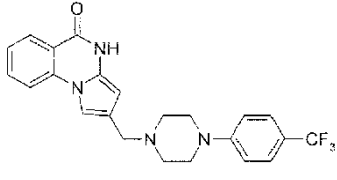
[Tabla 44]

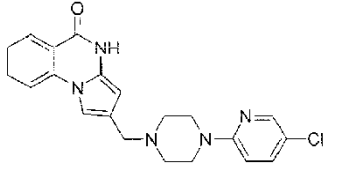
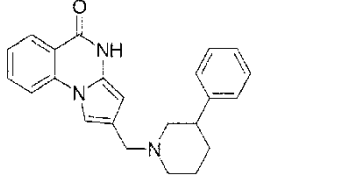
2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-23)	^1H-RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 2,63-2,69 (m, 4H), 3,40-3,47 (m, 4H), 3,57 (s, 2H), 5,80 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,84 (dd, J = 5,2, 1,6 Hz, 2H), 7,38 (td, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 5,2, 1,6 Hz, 2H), 8,20 (dd, J = 7,7, 1,5 Hz, 1H).
	
2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-24)	^1H-RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 1,17 (d, J = 5,6 Hz, 3H), 2,26-2,35 (m, 1H), 2,40-2,50 (m, 2H), 2,68-2,76 (m, 1H), 2,80-2,90 (m, 1H), 3,30-3,43 (m, 3H), 3,82 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 5,56 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,89-6,94 (m, 2H), 6,96-7,06 (m, 2H), 7,34-7,40 (m, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,75-7,81 (m, 1H), 7,96 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,10-8,15 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-25)	^1H-RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 2,51-2,57 (m, 4H), 2,93-2,99 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 3,76 (s, 3H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,84-6,95 (m, 4H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,9, 1,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,6 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
	

[Tabla 45]

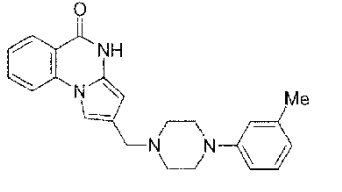
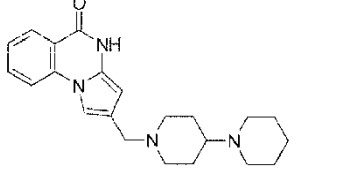
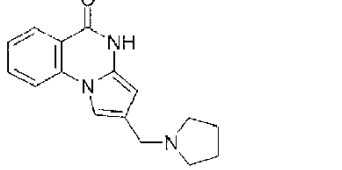
2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-26)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,51-2,54 (m, 4H), 3,10-3,15 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 3,70 (s, 3H), 5,57 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,35 (dd, J = 8,2, 2,2 Hz, 1H), 6,42 (t, J = 2,2 Hz, 1H), 6,51 (dd, J = 8,2, 2,2 Hz, 1H), 7,09 (t, J = 8,2 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
	
2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-27)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,00-1,25 (m, 5H), 1,50-1,60 (m, 1H), 1,65-1,80 (m, 4H), 2,10-2,35 (m, 1H), 2,20-2,50 (m, 10H), 5,52 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,33-7,38 (m, 1H), 7,43 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,72-7,80 (m, 1H), 7,93 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	
2-(4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-28)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 0,01-0,60 (m, 2H), 0,40-0,46 (m, 2H), 0,75-0,85 (m, 1H), 2,14 (d, J = 6,3 Hz, 2H), 2,20-2,60 (m, 10H), 5,53 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,30-7,40 (m, 1H), 7,43 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,73-7,78 (m, 1H), 7,93 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,66 (s, 1H).
	

[Tabla 46]

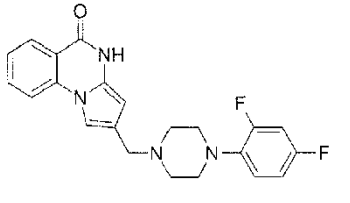
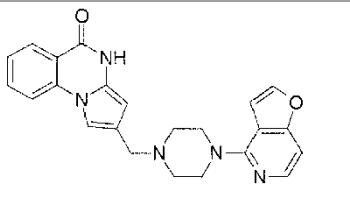
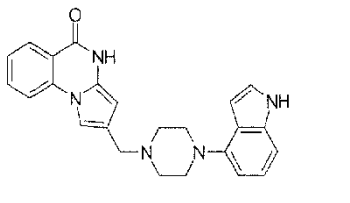
2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-29)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,52-2,56 (m, 4H), 3,25-3,30 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,36 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-30)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,44-2,49 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 3,45-3,50 (m, 4H), 5,57 (s, 1H), 6,85 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,58 (dd, J = 9,2, 2,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,6, 1,7 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,6, 1,7 Hz, 1H), 8,09 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 11,69 (s, 1H).

	
2-(3-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-31)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1,36-1,47 (m, 1H), 1,54-1,65 (m, 1H), 1,67-1,75 (m, 1H), 1,77-1,84 (m, 1H), 1,96 (t, J = 11,5 Hz, 2H), 2,69-2,77 (m, 1H), 2,87-2,95 (m, 2H), 3,38 (d, J = 13,4 Hz, 1H), 3,43 (d, J = 13,4 Hz, 1H), 5,54 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,15-7,20 (m, 4H), 7,21-7,29 (m, 1H), 7,34 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,43 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,74 (td, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,64 (s, 1H).
	

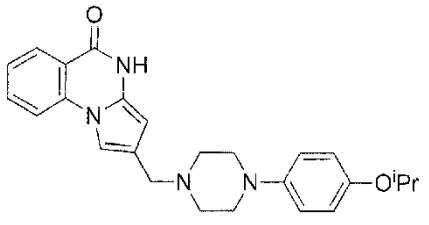
[Tabla 47]

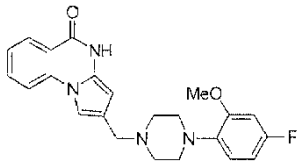
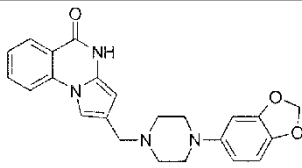
2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-32)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 2,23 (s, 3H), 2,51-2,57 (m, 4H), 3,07-3,16 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,58 (s, 1H), 6,58 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 6,66-6,76 (m, 2H), 7,07 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,73-7,81 (m, 1H), 7,95 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,3 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-33)	¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1,25-1,52 (m, 6H), 1,58-1,71 (m, 2H), 1,78-1,93 (m, 2H), 2,07-2,20 (m, 1H), 2,36-2,46 (m, 4H), 2,83-2,96 (m, 2H), 3,27-3,39 (m, 4H), 5,52 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,35 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,42 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,76 (td, J = 7,8, 1,3 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,8, 1,3 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H).
	
2-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-34)	¹H-RMN (500 MHz, DMSO-d₆) δ 1,65-1,80 (m, 4H), 2,40-2,75 (m, 4H), 3,50-3,70 (m, 2H), 5,61 (s, 1H), 7,30-7,40 (m, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,74-7,82 (m, 1H), 7,93 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,70 (s, 1H).
	

[Tabla 48]

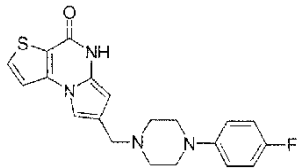
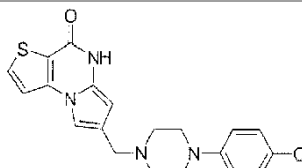
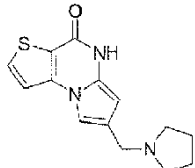
2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-35)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,53-2,59 (m, 4H), 2,93-3,00 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 6,95-7,09 (m, 2H), 7,15-7,21 (m, 1H), 7,36 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 8,0, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-36)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,53-2,58 (m, 4H), 3,45 (s, 2H), 3,62-3,67 (m, 4H), 5,59 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 5,8, 0,9 Hz, 1H), 7,15 (dd, J = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 7,36 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 5,8 Hz, 1H), 8,10 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,69 (s, 1H).
	
2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-37)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,61-2,73 (m, 4H), 3,08-3,20 (m, 4H), 3,51 (s, 2H), 5,61 (s, 1H), 6,35-6,37 (m, 1H), 6,44 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 6,92-7,03 (m, 2H), 7,21-7,23 (m, 1H), 7,36 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,78 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,10 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 11,01 (s, 1H), 11,69 (s, 1H).
	

[Tabla 49]

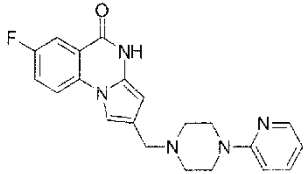
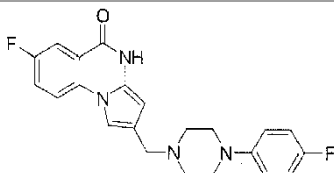
2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-38)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1,21 (d, J = 6,1 Hz, 6H), 2,45-2,59 (m, 4H), 2,94-3,08 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 4,37-4,49 (m, 1H), 5,58 (s, 1H), 6,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 6,85 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,36 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,77 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 8,09 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-39)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,40-2,60 (m, 4H), 2,80-3,00 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 3,77 (s, 3H), 5,56 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,66 (td, J = 8,6, 2,7 Hz, 1H), 6,80-6,90 (m, 2H), 7,34-7,38 (m, 1H), 7,48 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,75-8,00

	(m, 1H), 7,95 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 8,08 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-40)	^1H -RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 2,40-2,55 (m, 4H), 2,97-3,05 (m, 4H), 3,42 (s, 2H), 5,56 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 5,90 (s, 2H), 6,32 (dd, J = 8,3, 2,4 Hz, 1H), 6,65 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 6,75 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 7,8, 7,3 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,74-7,80 (m, 1H), 7,95 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	

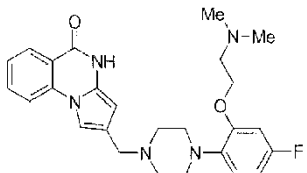
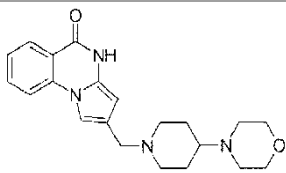
[Tabla 50]

7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 2-41)	^1H -RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 2,40-2,60 (m, 4H), 3,00-3,13 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,60 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 5,90-5,96 (m, 2H), 6,00-6,08 (m, 2H), 7,34 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 8,17 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 11,71 (s, 1H).
	
7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 2-42)	^1H -RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 2,40-2,60 (m, 4H), 3,08-3,20 (m, 4H), 3,44 (s, 2H), 5,60 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,21 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,34 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 11,71 (s, 1H).
	
7-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona (Compuesto 2-43)	^1H -RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 1,64-1,73 (m, 4H), 2,40-2,50 (m, 4H), 3,48 (s, 2H), 5,57 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,29 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 8,17 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 11,69 (s, 1H).
	

[Tabla 51]

7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-44)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,50-2,55 (m, 4H), 3,41-3,51 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,59 (s, 1H), 6,62 (dd, J = 7,0, 5,1 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,51 (ddd, J = 8,5, 7,0, 1,5 Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,68 (td, J = 8,8, 3,0 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,8, 3,0 Hz, 1H), 8,04 (dd, J = 8,8, 4,4 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 5,1, 1,5 Hz, 1H), 11,84 (s, 1H).
	
7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-45)	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,52-2,56 (m, 4H), 3,05-3,09 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,58 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,90-6,96 (m, 2H), 7,00-7,07 (m, 2H), 7,51 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,68 (td, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 8,8, 3,1 Hz, 1H), 8,04 (dd, J = 8,8, 4,3 Hz, 1H), 11,83 (s, 1H).
	

[Tabla 52]

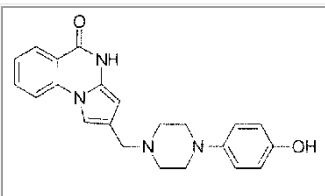
2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-46)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,22 (s, 6H), 2,40-2,60 (m, 4H), 2,63 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 2,85-3,05 (m, 4H), 3,42 (s, 2H), 4,02 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 5,57 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 6,60-6,70 (m, 1H), 6,80-6,88 (m, 2H), 7,33-7,40 (m, 1H), 7,48 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,74-7,79 (m, 1H), 7,95 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,68 (s, 1H).
	
2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 2-47)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) 1,50-1,61 (m, 2H), 1,89-1,95 (m, 2H), 2,03-2,11 (m, 2H), 2,15-2,24 (m, 1H), 2,54-2,59 (m, 4H), 3,04-3,10 (m, 2H), 3,51 (s, 2H), 3,66-3,71 (m, 4H), 4,32 (s, 1H), 5,77 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,35-7,39 (m, 2H), 7,74-7,83 (m, 2H), 8,19 (dd, J = 7,9, 0,9 Hz, 1H).
	

5 (Ejemplo 3: 2-[4-(4-Hidroxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 3-1))

Bajo enfriamiento en hielo, se añadió tribromuro de boro (0,100 mL, 1,04 mmol) a una solución de 2-[4-(4-metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (el Compuesto 2-16 anterior, 200 mg, 0,515 mmol) en cloruro de metileno (3,0 mL). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La solución de reacción se diluyó con metanol (2,0 mL) después de enfriar en hielo y luego se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se disolvió en solución acuosa 1 M de hidróxido de sodio (2,0 mL) y se añadió ácido clorhídrico 2 M de modo que el pH de la solución fuera de 7. El precipitado se recolectó por filtración y se secó a

presión reducida, para obtener el Compuesto del título 3-1 (43,2 mg, rendimiento: 22%) en forma de un polvo anaranjado.

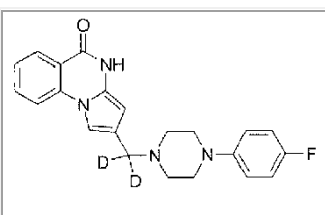
[Tabla 53]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,52-2,56 (m, 4H), 2,93-2,98 (m, 4H), 3,43 (s, 2H), 5,57 (s, 1H), 6,63 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,76 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,36 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,77 (td, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 8,78 (s, 1H), 11,67 (s, 1H).
---	---

5 **(Ejemplo 4: 2-[1-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-yl]-1,1-dideuteriometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 4-1))**

Bajo enfriamiento en hielo, se añadió deutero de litio y aluminio (66,4 mg, 1,42 mmol) a una solución de 2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (el Compuesto 1-1 anterior, 278 mg, 0,712 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (6 mL). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A la solución de reacción, se añadió una pequeña cantidad de acetato de etilo gota a gota y luego se agregaron una solución acuosa saturada de tartrato de sodio y potasio tetrahidrato (3 mL) y agua (20 mL) de modo secuencial. La mezcla se extrajo dos veces con cloroformo (40 mL). La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego el disolvente se destiló a presión reducida. El residuo obtenido se recolectó por filtración con etanol, para obtener el compuesto del título (174 mg, rendimiento: 65%) en forma de un polvo amarillo pálido.

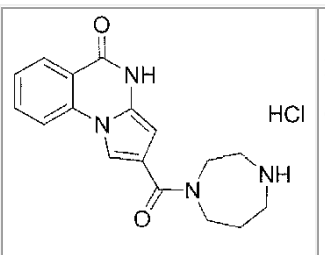
15 [Tabla 54]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,30-2,60 (m, 4H), 3,00-3,15 (m, 4H), 5,57 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 6,90-6,97 (m, 2H), 6,99-7,07 (m, 2H), 7,36 (t, J = 7,3 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,77 (td, J = 7,3, 1,5 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 8,09 (dd, J = 7,3, 1,5 Hz, 1H), 11,67 (s, 1H).
---	---

(Ejemplo 5: Clorhidrato de 2-(homopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 5-1))

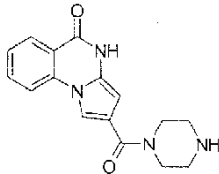
Cloruro de hidrógeno al 10% en metanol (3 mL) se añadió a una solución de 2-[4-(ter-butoxicarbonil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (el Compuesto 1-47 anterior, 156 mg, 0,380 mmol) en metanol (1 mL) y la solución de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El sólido precipitado se recolectó por filtración y se secó a presión reducida, para obtener el compuesto del título (102 mg, rendimiento: 87%) en forma de un polvo incoloro.

[Tabla 55]

	¹ H-RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,05-2,15 (m, 2H), 3,21 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 3,28 (t, J = 5,2 Hz, 2H), 3,80 (t, J = 6,1 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 5,2 Hz, 2H), 5,84 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,42-7,46 (m, 1H), 7,76-7,82 (m, 1H), 7,82 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,03 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 8,16 (dd, J = 7,9, 1,2 Hz, 1H), 9,17 (s, 2H), 11,51 (s, 1H).
---	--

25 A continuación, usando el Compuesto 1-48, se obtuvo el Compuesto 5-2 de acuerdo con el método de producción para el Compuesto 5-1.

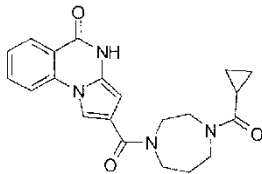
[Tabla 56]

2-(Piperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 5-2)	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆) δ 2,65-2,80 (m, 4H), 3,50-3,75 (m, 4H), 5,71 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,40-7,50 (m, 1H), 7,75-7,85 (m, 1H), 7,90 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,10-8,14 (m, 2H), 12,00 (s, 1H).
	

(Ejemplo 6: 2-[4-Ciclopropilcarbonilhomopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 6-1))

- 5 Diisopropiletilamina (0,11 mL, 0,63 mmol) y cloruro de ciclopropancarbonilo (30 µL, 0,33 mmol) se añadieron de modo secuencial a una solución de clorhidrato de 2-(homopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona (Compuesto 5-1, 70,0 mg, 0,20 mmol) en N,N-dimetilformamida anhidra (0,50 mL) y la solución de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La solución de reacción se diluyó con acetato de etilo (20 mL) y se lavó de modo secuencial con solución acuosa 0,1 M de hidróxido de sodio (20 mL) y salmuera (20 mL). La capa acuosa se extrajo dos veces con cloroformo (20 mL) y se combinó con la capa de acetato de etilo y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de concentrar a presión reducida, el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo), para obtener el compuesto del título (25,8 mg, rendimiento: 34%) en forma de un polvo incoloro.
- 10

[Tabla 57]

	¹ H-RMN (500 MHz, DMSO-d ₆ , 100 °C) δ 0,60-0,80 (m, 4H), 1,70-2,00 (m, 3H), 3,50-4,00 (m, 8H), 5,78 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,40-7,45 (m, 1H), 7,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,77-7,83 (m, 1H), 8,01 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 8,15 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 11,46 (s, 1H).
---	--

15

[Ejemplos de formulación]

A continuación, se muestran típicos ejemplos de formulación que contienen el presente compuesto.

1) Comprimido (en 150 mg)

Presente compuesto	1 mg
Lactosa	100 mg
Almidón de maíz	40 mg
Carboximetilcelulosa de calcio	4,5 mg
Hidroxipropilcelulosa	4 mg
Estearato de magnesio	0,5 mg

- 20 Al recubrir el comprimido de la formulación anterior con 3 mg de un agente de recubrimiento (agentes de recubrimiento ordinarios tales como hidroxipropilmetilcelulosa, macrogol, resina siliconada, y similares), se puede obtener un comprimido deseado. También al cambiar apropiadamente el tipo y/o la cantidad del presente compuesto y aditivos, se puede obtener un comprimido deseado.

2) Cápsula (en 150 mg)

Presente compuesto	5 mg
Lactosa	135 mg
Carboximetilcelulosa de calcio	4,5 mg
Hidroxipropilcelulosa	4 mg
Estearato de magnesio	1,5 mg

Al cambiar apropiadamente el tipo y/o la cantidad del presente compuesto y aditivos, se puede obtener una cápsula deseada.

5 3) Solución oftálmica (en 100 mL)

Presente compuesto	100 mg
Cloruro de sodio	900 mg
Polisorbato 80	500 mg
Hidróxido de sodio	c. s.
Ácido clorhídrico	c. s.
Agua purificada esterilizada	c. s.

Al cambiar apropiadamente el tipo y/o la cantidad del presente compuesto y aditivos, se puede obtener una solución oftálmica deseada.

[Ensayo farmacológico]**10 1. Ensayo de medición de la actividad inhibidora de PARP**

Para evaluar la actividad inhibidora de PARP del presente compuesto, se midió la actividad inhibidora de cada compuesto de ensayo respecto de PARP1 recombinante humana usando el kit de ensayo colorimétrico universal de PARP con cavidades con tiras recubiertas con histona (Cat N.º: 4677-096-K) disponible de Trevigen. El ensayo se realizó de acuerdo con el procedimiento en la instrucción adjunta a este kit. La operación concreta se describirá más abajo.

(Preparación de la solución de compuesto de ensayo)

Tras disolver el compuesto de ensayo en dimetilsulfóxido, la solución se diluyó con un tampón de PARP adjunto al kit para preparar una solución de 50 µM de compuesto de ensayo.

(Método de ensayo y método de medición)

- 20 En cada cavidad de una placa de 96 cavidades recubierta con histona, se añadieron 10 µL de solución de compuesto de ensayo (50 µM), 15 µL de PARP1 recombinante humana (33,3 unidades/mL) y 25 µL de cóctel de PARP (con contenido de ADN activado y NAD biotinado) y se incubaron a temperatura ambiente durante 1 hora (cantidad de reacción final: 50 µL). Cada cavidad se lavó dos veces con 200 µL de tampón de fosfato de Dulbecco con contenido de Triton X al 0,1% y luego se lavó dos veces con 200 µL de tampón de fosfato de Dulbecco y luego se añadieron 50 µL de estrep-HRP, seguido de incubación a temperatura ambiente durante 1 hora. Cada cavidad se lavó dos veces con 200 µL de tampón de fosfato de Dulbecco con contenido de Triton X al 0,1% y luego se lavó dos veces con 200 µL de tampón de fosfato de Dulbecco y luego se añadieron 50 µL de sustrato colorimétrico TACS-Sapphire, seguido de incubación a temperatura ambiente durante 15 minutos. Después de detener la reacción por

adición de 50 µL de HCl 0,2 M, se midió la absorbancia a 450 nm (Abs 450) por medio de un lector de microplacas. La cantidad de ejemplos en cada grupo era de 1 a 2.

(Control negativo)

- 5 Usando una cavidad en la que se añadieron dimetilsulfóxido y un tampón de PARP en vez de la solución de compuesto de ensayo y PARP1 recombinante humana, se realizó la operación anterior como un control negativo.

(Positive control)

Usando una cavidad en la que se añadió un tampón de PARP con contenido de dimetilsulfóxido en vez de la solución de compuesto de ensayo, se realizó la operación anterior como un control positivo.

(Cálculo de la tasa de inhibición de PARP1)

- 10 La tasa de inhibición de PARP1 (%) se calculó de acuerdo con la siguiente fórmula 1.

[Fórmula 1]

$$\text{Tasa de inhibición de PARP1 (\%)} = (\text{Abs}_B - \text{Abs}_X) / (\text{Abs}_B - \text{Abs}_A) \times 100$$

Abs_A: absorbancia del control negativo (Abs 450)

Abs_B: absorbancia del control positivo (Abs 450)

Abs_x: absorbancia del grupo tratado con compuesto de ensayo (Abs 450)

- 15 **(Resultado)**

Se muestra la tasa de inhibición de PARP de cada compuesto de ensayo (concentración del compuesto: 10 µM) en las siguientes Tablas 58 y 59.

[Tabla 58]

Compuesto	Tasa de inhibición (%)	Compuesto	Tasa de inhibición (%)
1-1	90	1-52	94
1-2	55	1-53	96
1-3	100	1-54	81
1-4	99	1-55	81
1-5	71	1-56	83
1-6	23	2-1	100
1-7	44	2-2	78
1-8	51	2-3	99
1-10	68	2-4	100
1-11	86	2-5	96
1-12	64	2-6	100
1-13	67	2-7	99

ES 2 562 903 T3

Compuesto	Tasa de inhibición (%)	Compuesto	Tasa de inhibición (%)
1-14	44	2-8	100
1-15	74	2-9	99
1-21	84	2-10	98
1-47	93	2-11	99
1-49	36	2-12	100
1-50	92	2-13	96
1-51	92	2-14	100

[Tabla 59]

Compuesto	Tasa de inhibición (%)	Compuesto	Tasa de inhibición (%)
2-15	98	2-34	96
2-16	100	2-35	100
2-17	100	2-36	82
2-18	95	2-37	71
2-19	93	2-38	98
2-20	90	2-39	100
2-21	65	2-40	100
2-22	97	2-41	100
2-23	100	2-42	100
2-24	99	2-43	91
2-25	100	2-44	98
2-26	78	2-45	100
2-27	99	2-46	85
2-28	99	2-47	99
2-29	40	3-1	100
2-30	100	4-1	100
2-31	66	5-1	99

Compuesto	Tasa de inhibición (%)	Compuesto	Tasa de inhibición (%)
2-32	97	5-2	85
2-33	96	6-1	90

(Discusión)

Como resulta obvio de las Tablas 58 y 59, se demostró que el presente compuesto tiene una fuerte actividad inhibidora de PARP.

5 2. Ensayo de evaluación de la actividad inhibidora de la degeneración de la retina en un modelo de rata inducido con MNU

Para examinar la influencia del presente compuesto sobre la degeneración de la retina, se evaluó la actividad inhibidora de la degeneración de la retina del compuesto de ensayo, usando un modelo de degeneración de la retina inducido por N-metil-N-nitrosourea de rata (de ahora en más en la presente, "MNU"). El modelo de degeneración de la retina inducido por MNU de rata es un modelo animal en el que se induce la muerte celular de la célula fotorreceptora de la retina por administración de MNU que es un agente de alquilación de ADN y se usa en general como un modelo animal para las enfermedades degenerativas coriorretinales tales como retinitis pigmentosa (Exp. Eye. Res., 84(2), 285-292 (2007)).

(Método de ensayo y método de medición)

El día previo a la administración de MNU, se midieron los volúmenes retinales de ratas macho Brown Norway de 8 semanas de edad usando tomografía de coherencia óptica (OCT) (producto de Carl Zeiss, número de modelo: STRATUS OCT Modelo 3000). Se administró por vía intraperitoneal un líquido de administración de MNU a las ratas en una dosis de 50 a 60 mg/kg y el séptimo día después de la administración, se midieron los volúmenes retinales usando OCT. El grupo de control normal no se sometió a un tratamiento y los volúmenes retinales se midieron el mismo día que el grupo de administración de MNU. La cantidad de ejemplos en cada grupo era de 4 ratas (8 ojos).

(Método de administración)

- Grupo administrado con compuesto de ensayo: Una solución de cada compuesto de ensayo suspendido en solución acuosa al 1% (p/v) de metilcelulosa se administró por vía oral una vez 30 minutos antes de la administración de MNU en una dosis de 1 a 30 mg/kg.
- Grupo de control normal y grupo administrado con vehículo: se administró por vía oral solución acuosa al 1% (p/v) de metilcelulosa una vez 30 minutos antes de la administración de MNU.

(Cálculo de la tasa de inhibición de reducción del volumen retinal)

De acuerdo con la siguiente fórmula 2, se calculó la tasa de inhibición del volumen retinal (%).

[Fórmula 2]

$$\text{Tasa de inhibición de reducción del volumen retinal (\%)} = \frac{(RV_{X\text{-pre}}/RV_{X\text{-post}} - RV_{B\text{-pre}}/RV_{B\text{-post}})}{(RV_{A\text{-pre}}/RV_{A\text{-post}} - RV_{B\text{-pre}}/RV_{B\text{-post}})} \times 100$$

RV_{A-pre}: volumen retinal antes de la administración de MNU del grupo de control normal (mm³)

RV_{A-post}: volumen retinal al séptimo día después de la administración de MNU de grupo de control normal (mm³)

RV_{B-pre}: volumen retinal antes de la administración de MNU del grupo administrado con vehículo (mm³)

RV_{B-post}: volumen retinal al séptimo día después de la administración de MNU del grupo administrado con vehículo (mm³)

RV_{X-pre}: volumen retinal antes de la administración de MNU del grupo administrado con el compuesto de ensayo (mm³)

RV_{X-post}: volumen retinal al séptimo día después de la administración de MNU del grupo administrado con el compuesto de ensayo (mm³)

(Resultados)

Se muestra la tasa de inhibición de la reducción del volumen retinal por medio de cada compuesto de ensayo (dosis: 1, 10 ó 30 mg/kg) en la Tabla 60.

[Tabla 60]

Compuesto	Dosis de administración de MNU (mg/kg)	Dosis de administración del compuesto de ensayo (mg/kg)	Tasa de inhibición (%)
2-1	60	10	65
2-5	50	10	16
2-7	50	10	69
2-8	50	10	39
2-9	50	10	25
2-12	60	30	47
2-14	50	10	33
2-16	50	10	29
2-17	50	10	48
2-30	50	10	72
2-35	50	10	61
2-39	50	10	84
2-40	50	10	88
2-44	50	10	81
2-45	50	1	81
4-1	50	10	94

5

(Discusión)

Como resulta obvio de la Tabla 60, se demostró que el presente compuesto suprime la reducción del volumen retinal observado en el modelo de rata inducido por MNU. En consecuencia, se considera que el presente compuesto tiene el potencial de volverse un agente terapéutico para las enfermedades oculares posteriores como degeneración macular relacionada con la edad, retinitis pigmentosa, desprendimiento de la retina, edema macular diabético, distrofia de conos, retinopatía relacionada con cáncer, obstrucción de la vena retinal y desprendimiento del epitelio pigmentario de la retina.

10

3. Ensayo de evaluación de la actividad inhibidora de la hiperpermeabilidad vascular retinal en el modelo de trombina de rata

15

Para examinar la influencia del presente compuesto sobre la hiperpermeabilidad vascular retinal, se evaluó actividad inhibidora de la hiperpermeabilidad vascular retinal del compuesto de ensayo usando un modelo de hiperpermeabilidad vascular retinal inducida por trombina de rata. El modelo de hiperpermeabilidad vascular retinal inducida por trombina de rata es un animal en el que se incrementa la permeabilidad vascular retinal por

administración de trombina y se usa como un modelo animal para la retinopatía diabética, edema macular diabético, etc. (IOVS, 2000, 41(4), S 18, 92).

(Método de ensayo y método de medición)

- 5 Se administró por vía intravítrea una preparación líquida de trombina a una rata macho Brown Norway de 8 semanas de edad en una dosis de 3 U/ojo y se recolectó el cuerpo vítreo al día siguiente de la administración y se midió la concentración de la proteína intravítrea por medio del método de Bradford. Un grupo de control normal recibió administración intravítrea de DPBS. La cantidad de ejemplos en cada grupo era de 4 ratas (7-8 ojos).

(Método de administración)

- 10 • Grupo administrado con compuesto de ensayo: Una solución de cada compuesto de ensayo suspendido en solución acuosa al 1% (p/v) de metilcelulosa se administró por vía oral en una dosis de 100 mg/kg, 1,5 horas antes y 22,5 horas después de la administración de trombina.

- Grupo de control normal y grupo administrado con vehículo

- 15 Una solución de cada compuesto de ensayo suspendido en solución acuosa al 1% (p/v) de metilcelulosa se administró por vía oral en una dosis de mg/kg 1,5 horas antes y 22,5 horas después de la administración de trombina.

(Cálculo de la tasa de inhibición de la hiperpermeabilidad vascular retinal)

De acuerdo con la siguiente fórmula 3, se calculó la tasa de inhibición de la hiperpermeabilidad vascular retinal.

[Fórmula 3]

$$\text{Tasa de inhibición de la hiperpermeabilidad vascular retinal (\%)} = (P_B - P_X) / (P_B - P_A) \times 100$$

100

P_A : concentración de proteína intravítrea del grupo de control normal

- 20 P_B : concentración de proteína intravítrea del grupo administrado con vehículo

P_X : concentración de proteína intravítrea del grupo administrado con el compuesto de ensayo

(Resultado)

La tasa de inhibición de la hiperpermeabilidad vascular retinal del compuesto de ensayo se muestra en la Tabla 61.

[Tabla 61]

Compuesto	Dosis de administración (mg/kg)	Tasa de inhibición (%)
2-1	100	63

25

(Discusión)

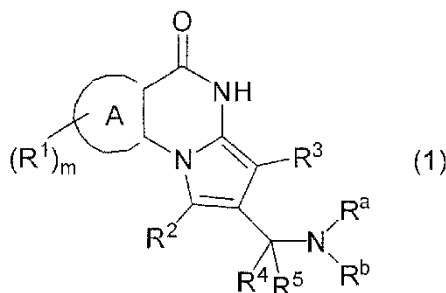
- 30 Como resulta obvio de la Tabla 61, se demostró que el presente compuesto suprime la hiperpermeabilidad vascular retinal. En consecuencia, se considera que el presente compuesto tiene el potencial de volverse un agente terapéutico para las enfermedades oculares posteriores tales como retinopatía diabética y edema macular diabético acompañado por hiperpermeabilidad vascular retinal.

El presente compuesto es de utilidad porque tiene una fuerte actividad inhibidora de PARP y tiene el potencial de volverse un agente terapéutico para diversas enfermedades que incluyen enfermedades oculares posteriores.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la siguiente fórmula general (1) o una de sus sales;

[Fórmula química 1]



5 (en donde R^1 representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo nitrógeno o un grupo ciano;

R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

10 R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo;

R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente o un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente;

15 R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ;

R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo arilo que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo heterocíclico que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono que opcionalmente tiene un sustituyente, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo;

35 anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado; y

m representa 0, 1 ó 2).

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1),

R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

40 R^2 y R^3 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo;

R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un átomo de deuterio, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amino o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ;

R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de deuterio, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y

m representa 0 ó 1.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1),

R^1 representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

R^2 y R^3 cada uno representa un átomo de hidrógeno;

R^4 y R^5 pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de deuterio o un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o R^4 y R^5 pueden formar un grupo oxo;

R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo arilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo arilo puede estar sustituido con un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo amino o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono;

R^a y R^b se pueden unir entre sí para formar un anillo heteromonocíclico que contiene nitrógeno o un anillo heterobícíclico que contiene nitrógeno que puede estar sustituido con uno o varios R^c ;

R^c representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heterocíclico, un grupo hidroxil, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo amino, un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo carboxilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heterocíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxil con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono,

anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado de 5 miembros; y

m representa 0 ó 1.

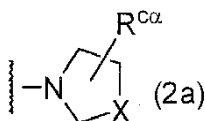
4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1),

R^a y R^b pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono puede estar sustituido con un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo morfonilo, un grupo amino o un grupo dimetilamino.

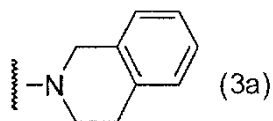
5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1),

R^a y R^b se unen entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la siguiente fórmula (2a) o (3a);

[Fórmula química 2]



[Fórmula química 3]



en la fórmula anterior (2a),

X representa CH_2 , $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{c}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{c}\beta}$, $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{c}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{\text{c}\beta}$;

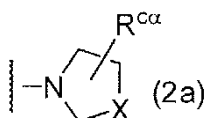
- 5 $\text{R}^{\text{c}\alpha}$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo; y

$\text{R}^{\text{c}\beta}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.

6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1),

- 30 R^{a} y R^{b} se unen entre sí para formar un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la siguiente fórmula (2a);

[Fórmula química 4]



en la fórmula anterior (2a),

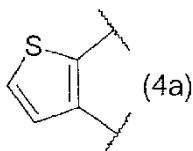
- 35 $\text{R}^{\text{c}\alpha}$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o un grupo fenilo;

X representa $\text{CH}_2\text{CHR}^{\text{c}\beta}$, $\text{CH}=\text{CR}^{\text{c}\beta}$ o $\text{CH}_2\text{NR}^{\text{c}\beta}$; y

$\text{R}^{\text{c}\beta}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo heteromonocíclico, un grupo heterobícíclico, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono o un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amina con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y el grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, el grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, el grupo arilo, el grupo heteromonocíclico, el grupo heterobícíclico, el grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono o el grupo formado al reemplazar

- un átomo de hidrógeno de un grupo formilo con un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo arilo, un grupo arilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo formado al reemplazar uno o ambos átomos de hidrógeno de un grupo amino con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.
7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5 ó 6 o una de sus sales, en donde en la fórmula anterior (2a), R^{ca} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo metilo o un grupo fenilo; y R^{cb} representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo ciclohexilo, un grupo fenilo, un grupo piridilo, un grupo piperidilo, un grupo tiazol, un grupo morfonilo, un grupo indolilo, un grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo ciclopropilcarbonilo o un grupo dimetilamino y el grupo metilo, el grupo ciclohexilo, el grupo fenilo, el grupo piridilo, el grupo piperidilo, el grupo tiazol, el grupo morfonilo, el grupo indolilo, el grupo furo[3,2-c]piridin-4-ilo o el grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un átomo de halógeno, un grupo cicloalquilo que tiene 3 a 10 átomos de carbono, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido con un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono sustituidos con un grupo dimetilamino.
8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7 o una de sus sales, en donde en la fórmula anterior (2a), R^{ca} representa un átomo de hidrógeno, X representa CH_2NR^{cb} , R^{cb} representa un grupo fenilo y el grupo fenilo puede estar sustituido con uno o varios grupos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono, un grupo hidroxilo y un grupo formado al reemplazar un átomo de hidrógeno de un grupo hidroxilo con un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene 1 a 8 átomos de carbono.
9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1), R^1 representa un átomo de halógeno.
10. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1), R^2 y R^3 cada uno representa un átomo de hidrógeno.
11. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1), R^4 y R^5 cada uno representa un átomo de hidrógeno.
12. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una de sus sales, en donde en la fórmula general (1), anillo A representa un anillo benceno o un anillo heteromonocíclico insaturado representado por la siguiente fórmula (4a).

[Fórmula química 5]



13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del grupo que consiste en:
- 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
- 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,

- 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona;
 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Metilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 5 2-(4-Bencilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 10 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 15 2-(3,4-Dihidroisoquinolin-2(1H)-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 20 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 25 2-(3-Fenilpiperidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 30 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 35 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
 7-(Pirrolidin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,

- 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)homopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 5 2-[4-(ter-Butoxicarbonil)piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(Fenilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Metilhomopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[(2-Dimetilaminoetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[(Piridin-4-ilmetil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 10 2-[2-(Morfolin-4-iletil)aminocarbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(Bencilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(2-Feniletilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(3-Fenilpropilaminocarbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 15 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Clorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Tiazol-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Fenilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 20 2-(4-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Clorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(2-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 25 2-(4-Metilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Bencilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorobencil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 30 2-[4-(3-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piridin-3-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[N-Metil-N-(3-fenilpropil)aminometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 35 2-[4-(4-Bromofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(1,2,3,4-Tetrahidroisoquinolin-2(1H)-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Dimetilaminopiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,

- 2-[4-(Piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluorofenil)-2-metilpiperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(2-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(3-Metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 5 2-(4-Ciclohexilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(4-Ciclopropilmetilpiperazin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Trifluorometilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(5-Cloropiridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(3-Fenilpiperidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 10 2-[4-(3-Metilfenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Piperidin-1-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(2,4-Difluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(Furo[3,2-c]piridin-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 15 2-[4-(1H-Indol-4-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Isopropoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Fluoro-2-metoxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(1,3-Benzodioxol-5-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 7-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
 20 7-[4-(4-Clorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
 7-(Pirrolidin-1-ilmetil)pirrolo[1,2-a]tieno[2,3-e]pirimidin-4(5H)-ona,
 7-Fluoro-2-[4-(piridin-2-il)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 7-Fluoro-2-[4-(4-fluorofenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-[2-(2-Dimetilaminoetoxi)-4-fluorofenil]piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 25 2-[4-(Morfolin-4-il)piperidin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[4-(4-Hidroxifenil)piperazin-1-ilmetil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-[1-[4-(4-Fluorofenil)piperazin-1-il]-1,1-dideuteriometil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 Clorhidrato de 2-(homopiperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 2-(Piperazin-1-carbonil)pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona, y
 30 2-[4-Ciclopropilcarbonilhomopiperazin-1-carbonil]pirrolo[1,2-a]quinazolin-5(4H)-ona o una de sus sales.

14. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 o una de sus sales para usar en la inhibición de la actividad de PARP.

15. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 o una de sus sales para usar en la prevención o la terapia de la enfermedad ocular posterior.