

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA
MIEMBROS DE LA FIRMA

BAKER & McKENZIE

CALLE 35 No. 7-25, Piso 4
TELÉFONO: (57-1) 285-1400 / 570-0010
SANTA FE DE BOGOTÁ, D.C.
COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Solicitud: 0002431 00000001 Folios: 121
Fecha: 2000-05-22 17:21:13
Trámite: 002 PATENTES 0 1 REGISTRO/ 441 CERTIFICADO
Resolución No. 0020 MINISTERIO DE INDUSTRIA Y COMERCIO

474

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: Expediente No. 00 024.431.

Solicitud de Patente de Invención titulada :

“COMPUESTOS INHIBIDORES DE NPY PARA
TRATAR LA OBESIDAD Y COMPOSICIONES
QUE LOS COMPRENDEN”.

Solicitante : PFIZER PRODUCTS INC.

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR ESTADO No. 069
DE FECHA 18 DE MAYO DE 2000, CONCEPTO TECNICO No. 645

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Santafé de Bogotá,
identificado tal como aparece al pie de mi firma en mi carácter de apoderado de la
sociedad en referencia, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese
Despacho, dentro del término legal:

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA

MIEMBROS DE LA FIRMA

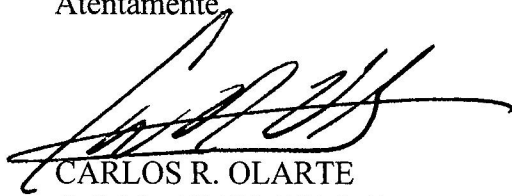
BAKER & McKENZIE

CALLE 35 No. 7-25, Piso 4
TELÉFONO: (57-1) 285-1400
SANTA FE DE BOGOTÁ, D.C.
COLOMBIA

- 3 -

4. Me permito adjuntar una nueva traducción del Capítulo Reivindicatorio del Documento de Prioridad, ya que por un error involuntario adjuntamos la traducción del Capítulo Reivindicatorio de la presente solicitud como la traducción del Capítulo Reivindicatorio del Documento de Prioridad. Sería fácil determinar dicho error, puesto que el Documento de Prioridad contiene 80 reivindicaciones y la traducción que se allegó originalmente solo contiene 41 reivindicaciones.

Atentamente



CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexos: Capítulo Reivindicatorio.
Nuevo Extracto para la Publicación.
Nuevas Tarjetas para el Archivo Temático y de Propietarios.
Traducción del Capítulo Reivindicatorio del Documento de Prioridad.

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 26,157
FECHA : ABRIL 26 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radiación : 00024431 00000001 Fellos: 121
Fecha (AMD): 2000-05-22 17:24:13
Folios : 032 PATENTES I 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Tendencia: 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CORREA ORDONEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	948038	25,410,000.00

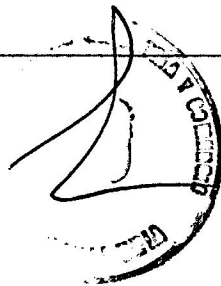
***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
50005-01-06	REGISTRO DE CESION, CAMBIO NOM	
	13 PATENTES, MODELOS, DISEÑOS, LEANAS, NO	167,000.00
	TOTAL :	167,000.00

SON: CIENTO SESENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____





479

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Radiocódigo : 00021431 00000001

Folios: 121

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 17,720

FECHA : MARZO 14 DE 2000

Fecha (AMD) : 2000-03-22 17:24:13

Trámite : 022 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 0000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
IVARO CORREA ORDONEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	950534	28,430,000.00

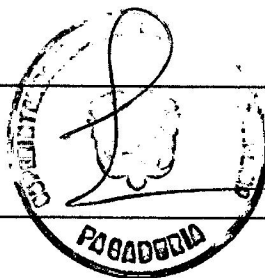
***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	22 CANCELACION DE MARCAS POR NOTORIE	371,000.00
	TOTAL :	371,000.00

SON: TRESCIENTOS SETENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

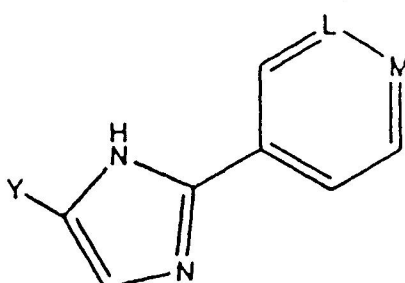
480 443
R

Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes

Reivindicaciones

1. Un compuesto de Fórmula I

5



10

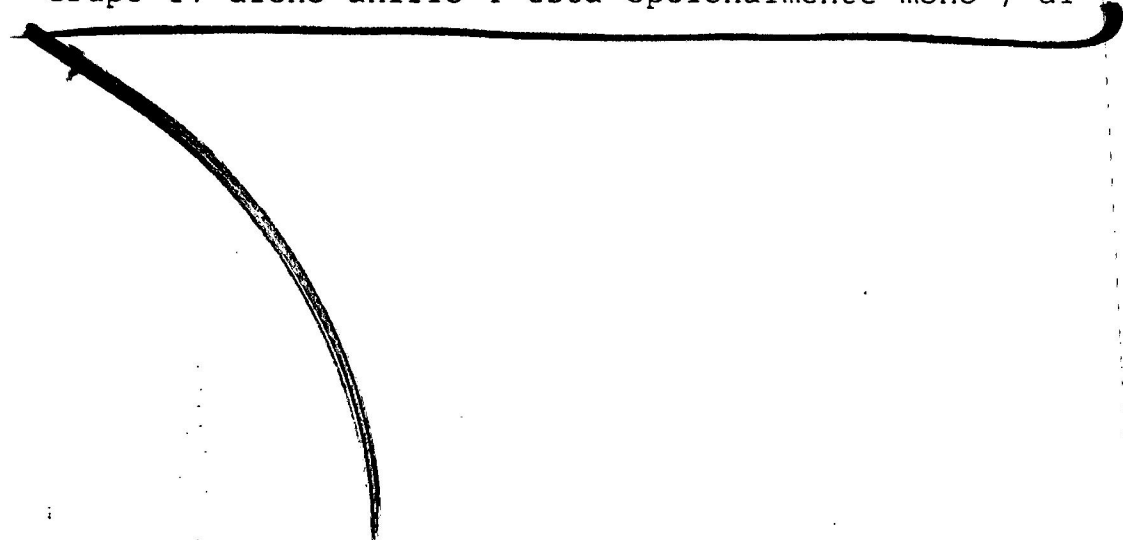
Fórmula I

~~Un profármaco del mismo~~ o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o dicho profármaco;

en la que Y es un anillo aromático de cinco a ocho
15 eslabones, que opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo aromático bicíclico que comprende dos anillos condensados de tres a seis eslabones, tomados independientemente, que opcionalmente tienen uno a cuatro
20 heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, azufre y oxígeno;

en la que dicho anillo Y tiene un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo I, Grupo II y Grupo III:

25 Grupo I: dicho anillo Y está opcionalmente mono-, di-



o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 cicloalcoxi C_3-C_6 , opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo II: dicho anillo Y está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente mono- o disustituido independientemente con alquilo C_1-C_6 , estando dicho alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor; o

Grupo III: dicho anillo Y está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino, estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-

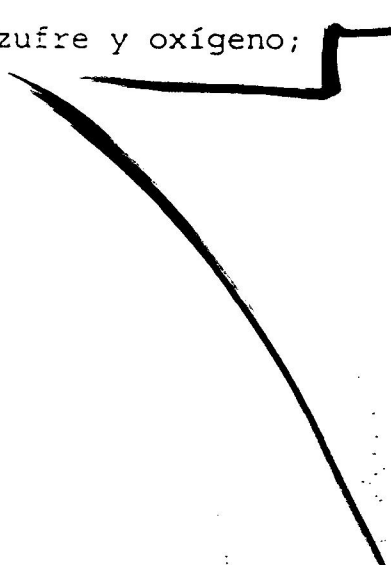
C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₃), ciano o fluoro;

5 cada uno de L y M son independientemente carbono o nitrógeno, con la condición de que L y M no sean iguales, estando dicho carbono unido a un anillo R³ a través de un nitrógeno del anillo R³;

siendo R³ un anillo saturado o parcialmente saturado que contiene nitrógeno de cuatro a ocho eslabones, que opcionalmente tiene un heteroátomo adicional seleccionado
10 independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno;

estando opcionalmente dicho anillo R³ opcional adicional monosustituido con:

1) H o un anillo T, opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₈ o carbonilo, donde dicho anillo T es un anillo
15 de cinco a ocho eslabones parcialmente saturado o totalmente insaturado que tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno o donde dicho anillo T es un anillo saturado de cuatro a siete eslabones que tiene uno a dos heteroátomos seleccionados
20 independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno o donde dicho anillo T es un anillo aromático bicíclico formado por dos anillos condensados de tres a seis eslabones, tomados independientemente, que opcionalmente tienen uno a cuatro heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno,
25 azufre y oxígeno;



estando dicho anillo T sustituido con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo IV, Grupo V y Grupo VI:

Grupo IV: dicho anillo T está opcionalmente mono-, di-
5 o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alcoxio C_1-C_6 o cicloalcoxio C_3-C_6 , estando dichos restos alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
10 alcoxio C_1-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6) y cicloalcoxio C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo V: dicho anillo T está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil
15 C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino, estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente
20 en cada uno de dichos alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-C_6 , hidroxilo, alcoxio C_1-C_3 , cicloalcoxio C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxio C_1-C_3), ciano o flúor;

Grupo VI: dicho anillo T está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno
25 de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a

dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, unido al anillo aromático T a través de un nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente monosustituido con alquilo C₁-C₃, estando dicho alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

2) alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈); estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor y estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente sustituidos con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo VII, Grupo VIII, Grupo IX y Grupo X:

Grupo VII: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)aminocarbonilo, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)aminocarbonilo, carboxi, nitro, amino, hidroxilo, alqueno C₂-C₆, (alquil C₁-C₄)tio, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, teniendo opcionalmente dichos restos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)aminocarbonilo, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)aminocarbonilo,

25 C₆)aminocarbonilo, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)aminocarbonilo,

498
485
C₆) aminocarbonilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ cicloalcoxi C₃-C₆ uno a nueve átomos de flúor;

Grupo VIII: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente
5 monosustituidos con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones, unido a través de un nitrógeno del anillo, teniendo dicho anillo opcionalmente uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro
10 a siete eslabones opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, estando dicho alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo IX: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-,
15 di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-
20 C₆) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, ciano o fluoro;

Grupo X: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o
25 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-



4186 7

499

di- o trisustituidos independientemente con (alcoxi C_1-C_6)carbonilo o (alquil C_1-C_6)formilo, estando dichos (alcoxi C_1-C_6)carbonilo o (alquil C_1-C_6)formilo opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, ciano, fluoro, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6) o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6) o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

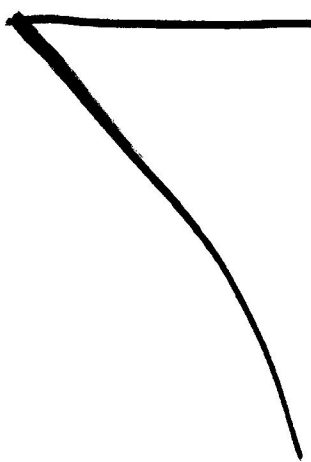
3) (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (cicloalcoxi C_3-C_8)carbonilo, (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (alquil C_1-C_8)formilo, (cicloalquil C_3-C_8)formilo o (cicloalquil C_3-C_8) (alquil C_1-C_8)formilo, estando dichos (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (cicloalcoxi C_3-C_8)carbonilo, (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8)carbonilo, (alquil C_1-C_8)formilo, (cicloalquil C_3-C_8)formilo o (cicloalquil C_3-C_8) (alquil C_1-C_8)formilo opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, ciano, fluoro, alcoxi C_1-C_6 , alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6) o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos alcoxi C_1-C_6 , alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6) o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

4) sulfonilo, estando dicho sulfonilo opcionalmente monosustituido con amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquiloxi C_1-C_8), estando dichos restos alqueno C_2-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquiloxi C_1-C_8) y cicloalcoxi C_3-C_8 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

10 o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino o N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino;

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, 15 mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino o N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada uno de dichos alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-C_6 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_6 , ciano o fluoro;

20 o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con un anillo parcialmente insaturado o totalmente insaturado de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno, un anillo saturado de cuatro a siete 25 eslabones que tiene uno a dos heteroátomos seleccionados



5

10

20

25

502
4189
C₁-C₈) y cicloalcoxi C₃-C₈ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor u opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí;

2) mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-
5 N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada uno de dichos
10 alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), ciano o tienen uno a nueve átomos de flúor;

3) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-
15 C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo, estando dichos (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo
20 opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, ciano, fluoro, alcoxi C₁-C₆ o alquilo C₁-C₆, estando dichos alcoxi C₁-C₆ o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

4) un anillo X, opcionalmente unido a través de un
25 alquilo C₁-C₈ o carbonilo, siendo dicho anillo X un anillo

parcialmente insaturado o totalmente insaturado de cinco a
ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos
seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y
nitrógeno o dicho anillo X es un anillo saturado de cuatro
5 a siete eslabones que tiene uno a tres heteroátomos
seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y
nitrógeno, o dicho anillo X es un anillo aromático bicíclico
formado por dos anillos condensados de tres a seis eslabones,
tomados independientemente, que opcionalmente tienen uno a
10 cuatro heteroátomos seleccionados independientemente de
nitrógeno, azufre y oxígeno; estando dicho anillo X
opcionalmente sustituido con un máximo de tres sustituyentes
seleccionados independientemente del Grupo XI, Grupo XII o
Grupo XIII

15 Grupo XI: dicho anillo X está opcionalmente mono-, di-
o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxil,
alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, alquilo
 C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6)(alquilo C_1-C_6),
(cicloalquil C_3-C_6)(alcoxi C_1-C_6), alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi
20 C_3-C_6 , estando dichos restos alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
alcoxi C_1-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6)(alquilo C_1-C_6), (cicloalquil
 C_3-C_6)(alcoxi C_1-C_6) y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente
sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo XII: dicho anillo X está opcionalmente mono- o
25 disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N-(alquil

C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino;

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, ciano o fluoro; o

Grupo XIII: dicho anillo X está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, unidos al anillo X aromático a través de un nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, estando dicho alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

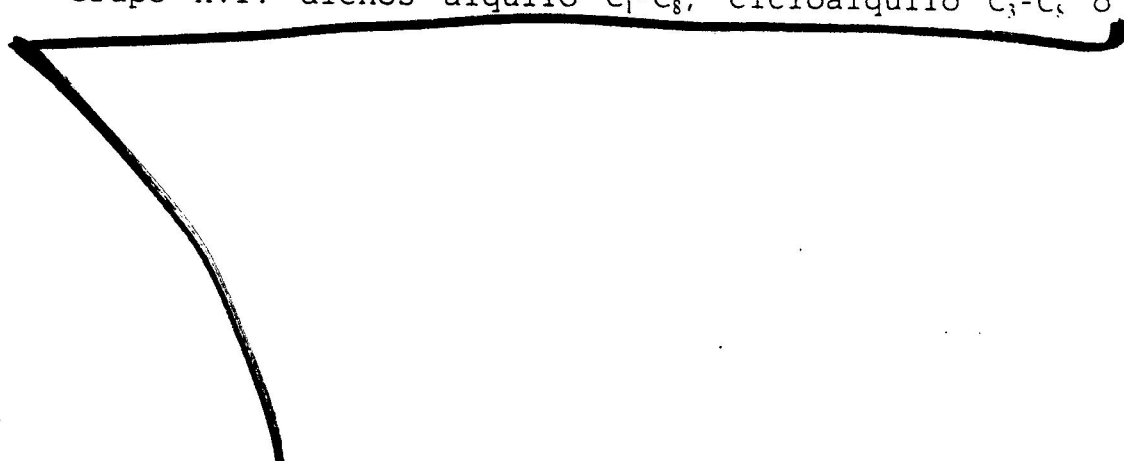
5) alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈); estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor y dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) están opcionalmente sustituidos con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo XIV, Grupo XV, Grupo XVI o Grupo XVII: en los que

505
492 \$

Grupo XIV: dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6)aminocarbonilo, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6)aminocarbonilo, carboxi, nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 o (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, estando dichos restos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6)aminocarbonilo, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6)aminocarbonilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

15 Grupo XV: dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) están opcionalmente monosustituidos con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones, unido a través de un nitrógeno del anillo, que tiene opcionalmente uno a dos heteroátomos
20 adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente sustituido con alquilo C_1-C_3 , estando dicho alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

25 Grupo XVI: dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o



(cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, estando dichos
5 mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxil, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-
10 C₆, ciano o fluoro;

Grupo XVII: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con (alcoxi C₁-C₆) carbonilo o (alquil C₁-C₆) formilo, estando dichos (alcoxi
15 C₁-C₆) carbonilo o (alquil C₁-C₆) formilo opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxil, ciano, fluoro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
20 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

6) sulfonilo, estando dicho sulfonilo opcionalmente monosustituido con amino, hidroxil, alqueno C₂-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-
25 C₈, estando dichos restos alqueno C₂-C₈, (cicloalquil C₃-

507
494 2

C₈) (alquilo C₁-C₈), (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈), alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈ o cicloalcoxi C₃-C₈, opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con mono-
5 N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino;

estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino opcionalmente mono-, di- o
10 trisustituidos independientemente en cada uno de dichos alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, ciano o fluoro.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos
15 anillos aromáticos Y están opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es carbono;

20 M es nitrógeno;

R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones;

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

25 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o



(cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente sustituido en un nitrógeno con un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno o azufre, estando unido dicho anillo T opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o trisustituido opcionalmente y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆),

(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

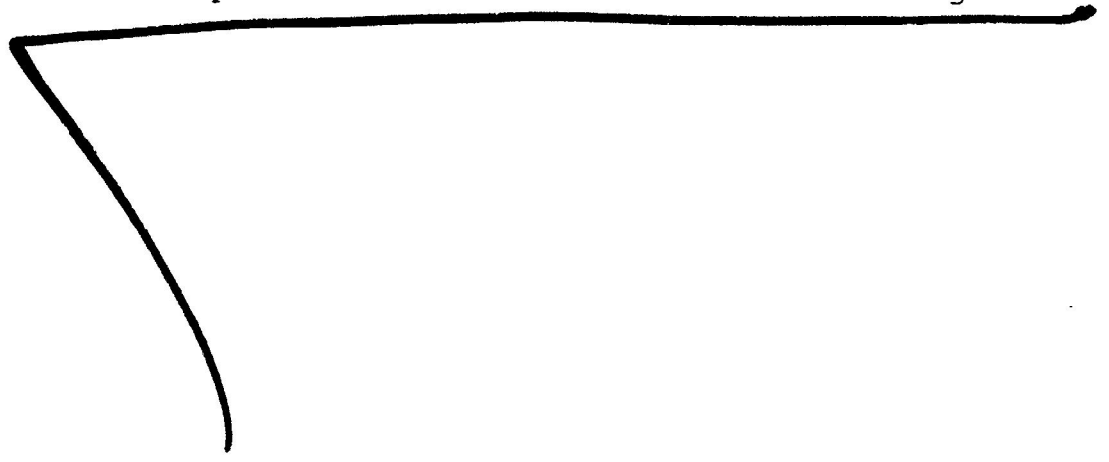
5 3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a seis eslabones; R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

10 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
15 fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-
20 C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

 estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

25 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con



piridilo o pirimidilo, estando unidos dichos piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

4. Un compuesto según la reivindicación 3, en el que
5 Y es fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alquilo C₁-C₂, ciano o trifluorometilo; y

R³ es piperazinilo opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o (cicloalquil
10 C₃-C₆) (alquilo C₁-C₄), estando dichos sustituyentes opcionalmente monosustituidos con hidroxilo o mono-, di- o trisustituidos con fluoro,
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
15 dicho compuesto

1-{4-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

20 1-{4-[4-(3,4-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-propil-piperazina;

25 1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(4-cloro-3-metil-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-
piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(3,4-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-piridin-
2-il}-4-ciclopropiletil-piperazina;

5 1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-
piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina; o

las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

6. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
dicho compuesto

10 1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-
piridin-2-il}-4-ciclopropiletil-piperazina;

1-{4-[4-(3-etil-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-piridin-2-il}-
4-isobutil-piperazina;

15 1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-piridin-2-il}-
4-(2,2,2-trifluoroetil)-piperazina;

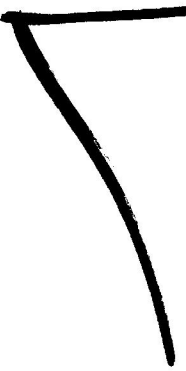
1-{4-[4-(4-trifluorometil-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-
piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(3,5-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-piridin-
2-il}-4-isobutil-piperazina;

20 3-(4-{4-[5-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]}-piridin-2-
il}-piperazin-1-il)-2-metil-butan-1-ol;

3-{2-[2-(4-isobutil-piperazin-1-il)-piridin-4-il]}-1H-
imidazol-4-il}-benzonitrilo;

25 3-{2-[2-(4-ciclopropilmetil-piperazin-1-il)-piridin-4-
il]}-1H-imidazol-4-il}-benzonitrilo; o las sales



512
499 #

farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

7. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, estando dichos anillos aromáticos Y opcionalmente mono- o
5 disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es nitrógeno;

M es carbono;

10 R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones; R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o
15 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxilo y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo
20 T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido opcionalmente y de forma independiente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆,
25 estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),

513
500 \$

(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
5 un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido dicho anillo T opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo T mono-, di- o trisustituido
10 opcionalmente y de forma independiente con hidroxi, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),
15 (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

8. Un compuesto según la reivindicación 7, en el que
20 R³ es un anillo diaza saturado de cinco a seis eslabones; y R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o
25 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o



disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 , y estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo de piridilo o pirimidilo, estando unido dicho anillo de piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo C_1-C_6 ,

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

9. Un compuesto según la reivindicación 8, en el que Y es fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alquilo C_1-C_2 , ciano o trifluorometilo; y

R^3 es piperazinilo opcionalmente monosustituido en el nitrógeno con alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 o (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_4), estando dichos sustituyentes

opcionalmente monosustituidos con hidroxí o mono-, di- o trisustituidos con fluoro, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

10. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
5 dicho compuesto

1-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

1-ciclopropilmetil-4-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-piperazina;

10 1-ciclopropilmetil-4-{5-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-piperazina;

1-{5-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

15 1-{5-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

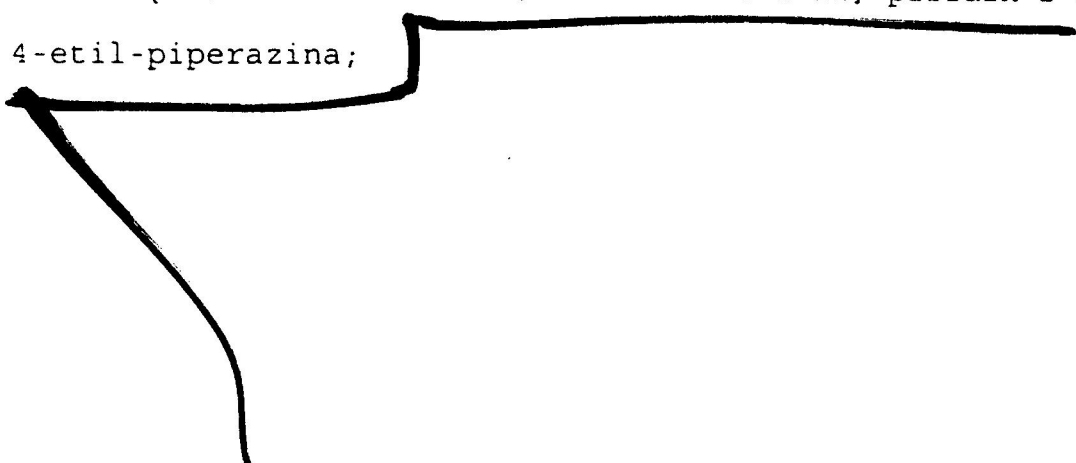
1-{5-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

20 11. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que dicho compuesto es

1-{5-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

25 1-{5-[4-(2-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;



1-{4-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina;

5 1-{4-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina;

1-{5-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos
10 compuestos.

12. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, estando dichos anillos aromáticos Y opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi,
15 C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es carbono;

M es nitrógeno;

R³ es un anillo monoaza saturado de cuatro a seis eslabones,
20 opcionalmente monosustituido en un carbono;

R³ está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con hidroxilo, oxo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)amino-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈,
25 cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi

504

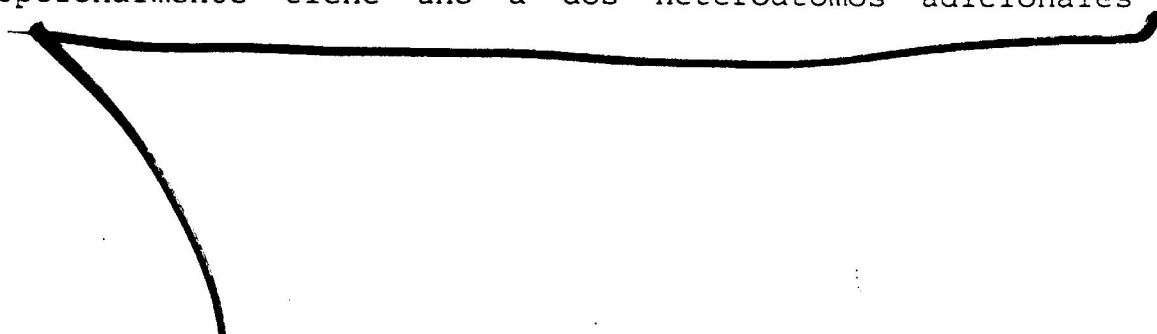
C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 ,
5 (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8), alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido con un anillo X
10 aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 o carbonilo

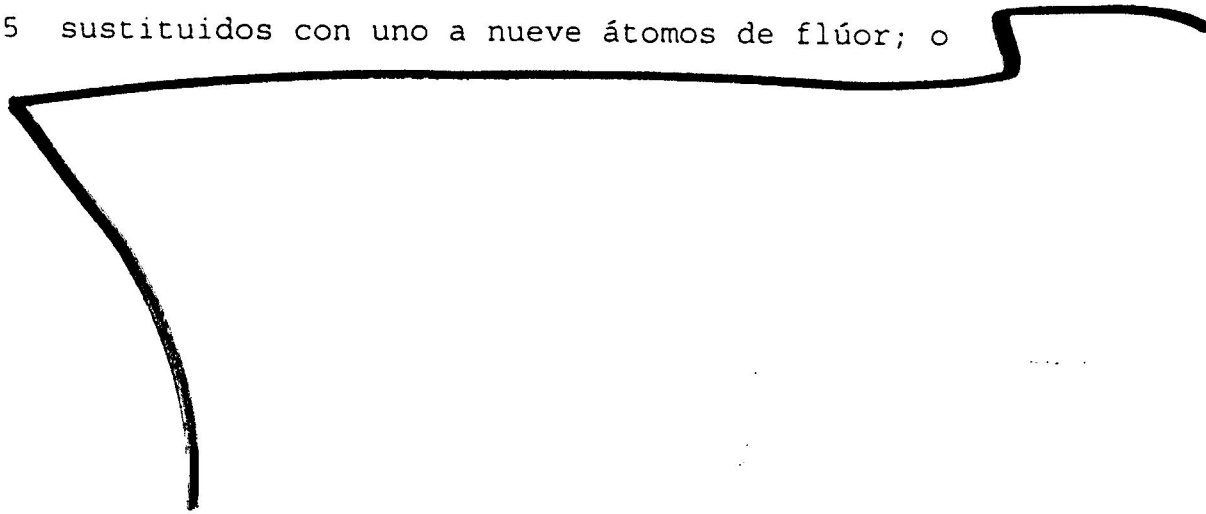
estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o
15 trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6),
20 (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido con un anillo X que contiene nitrógeno saturado de cuatro a siete eslabones, que
25 opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales



seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R^3 a través de N y conteniendo dicho enlace opcionalmente un alquilo C_1-C_6 , o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

- 5 13. Un compuesto según la reivindicación 12, en el que R^3 está opcionalmente monosustituido con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo
- 10 C_1-C_8), estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos
- 15 de flúor; o
- R^3 está opcionalmente monosustituido con X, siendo X fenilo, opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 o carbonilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-
- 20 C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente
- 25 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
- 

R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X de piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo X unido opcionalmente a través de un carbonilo, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

- 5 14. Un compuesto según la reivindicación 13, en el que Y es fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;
- 10 R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;
- R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo u opcionalmente tienen uno a nueve átomos de flúor; o
- 15
- 20 R³ está opcionalmente monosustituido con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente monosustituido con hidroxilo, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo
- 25

520
507
C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

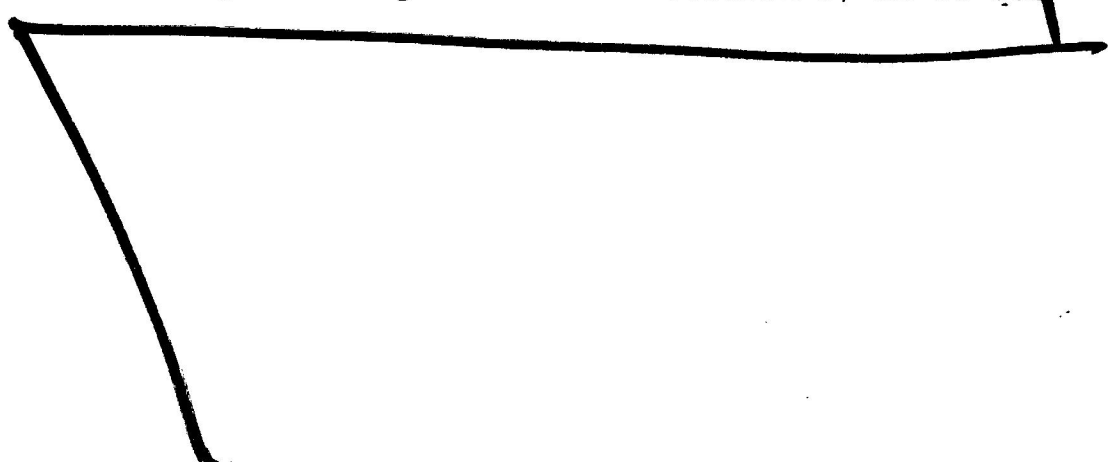
15. Un compuesto según la reivindicación 14, en el que
- 5 R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;
- R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈), o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor,
- 10 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

16. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

4'-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ol;

- 20 2-{4'-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il}-etanol; o

1-{4-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-pirrolidin-3-ol; o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

- 25 17. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que
- 

Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos anillos aromáticos Y están opcionalmente mono- o disustituídos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o

5 trifluorometoxi;

L es nitrógeno;

M es carbono;

R³ es un anillo monoaza saturado de cuatro a seis eslabones opcionalmente sustituido en un carbono;

10 R³ está opcionalmente mono- o disustituido, independientemente, con hidroxí, oxo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈);

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituídos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

20

R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X

25 aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene

uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 o carbonilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o
5 trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6),
10 (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido con un anillo X que
contiene nitrógeno saturado de cuatro a siete eslabones, que
15 opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R^3 a través de N y conteniendo dicha unión opcionalmente un alquilo C_1-C_6 , o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

20 18. Un compuesto según la reivindicación 17, en el que R^3 está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo
25 C_1-C_8), estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino,

alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

- R³ está opcionalmente monosustituido con X, siendo X fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
- 15 R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X de piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo X unido opcionalmente a través de un carbonilo,
- o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

19. Un compuesto según la reivindicación 18, en el que Y es fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;

25 R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxí, amino,

halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈,
 cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
 (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo
 C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo
 5 C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o
 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o
 disustituídos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno
 a nueve átomos de flúor; o
 R³ está opcionalmente monosustituído con fenilo, estando
 10 dicho fenilo opcionalmente monosustituído con hidroxí,
 (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi
 C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
 cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-
 C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo
 15 C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆
 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor,
 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

20. Un compuesto según la reivindicación 19, en el que
 R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;
 20 R³ está opcionalmente monosustituído con hidroxí, amino,
 halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈,
 cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
 (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo
 C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo
 25 C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o

(cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5 21. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

5' - [4- (3,4-dicloro-fenil) -1H-imidazol-2-il] -3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ol; o

(1-{5-[4- (3,4-dicloro-fenil) -1H-imidazol-2-il] -piridin-
10 2-il}-pirrolidin-3-il)-isobutil-amina; o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

22. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos anillos Y están opcionalmente mono- o disustituidos
15 independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C_1-C_4 , hidroxí, alquilo C_1-C_4 , ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es carbono;

M es nitrógeno;

R^3 es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones
20 disustituido; estando

R^3 opcionalmente mono- o disustituido en un carbono, independientemente, con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, alquilo
25 C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8),

alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8);

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, N-(alquil C_1-C_6) amino-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8), alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

10 o

R^1 está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 ,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

25 R^1 está opcionalmente monosustituido en un carbono con un

anillo X a través de un carbonilo, siendo X fenilo, furanilo o tiofenilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X que contiene nitrógeno, saturado, de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R³ a través de N y conteniendo dicha unión opcionalmente un alquilo C₁-C₆, y

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxilo y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido dicho anillo T a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

23. Un compuesto según la reivindicación 22, en el que R^3 es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones monosustituídos en un carbono;

5 R^3 está opcionalmente monosustituído con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8), estando dichos alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo
10 C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituídos con hidroxí u opcionalmente sustituídos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituído con fenilo,

15 estando dicho fenilo opcionalmente monosustituído con hidroxí, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo
20 C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituídos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

24. Un compuesto según la reivindicación 22, en el que R^3 es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones,
25 estando dicho anillo monosustituído en un carbono y

monosustituido en un nitrógeno;

estando R^3 opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8),

5 estando dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, halógeno, cicloalquilo C_3-C_6 ; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
10 fenilo, estando dicho fenilo unido opcionalmente a través de un alquilo C_1-C_6 y estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-
15 C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

20 R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo piridilo o pirimidilo opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 ; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un carbono con
25 hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-

5 C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

25. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que
10 Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dicho anillo aromático Y está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es nitrógeno;

15 M es carbono;

R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones mono- o disustituido; en el que

R³ está opcionalmente mono- o disustituido, independientemente, en un carbono, con hidroxí, amino, 20 halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)amino-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈);

25 estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino,

mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) opcionalmente mono-
5 o disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno
10 o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
15 cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
20 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X unido a través de un carbonilo, siendo X fenilo, furanilo o tiofenilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o
25 trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno,

(cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X que contiene nitrógeno, saturado, de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R³ a través de N y conteniendo dicha unión opcionalmente un alquilo C₁-C₆, y

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente sustituido en un nitrógeno con un anillo T unido por un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido de forma independiente con

5 hidroxi, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),
(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo
C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos
(cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi
C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve
átomos de flúor; o

10 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que
opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados
independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido dicho
anillo T opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o
trisustituido y de forma independiente con hidroxi, halógeno,
15 (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi
C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),
(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo
20 C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

26. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones
25 monosustituido en un carbono;

en el que

R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
5 (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con
10 uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente monosustituido con hidroxí, (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
15 cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

20 27. Un compuesto según la reivindicación 26, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones, estando dicho anillo opcionalmente sustituido en un carbono y monosustituido en un nitrógeno;

estando R³ opcionalmente monosustituido en un nitrógeno
25 con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-

536
523 F
C₈) (alquilo C₁-C₈);

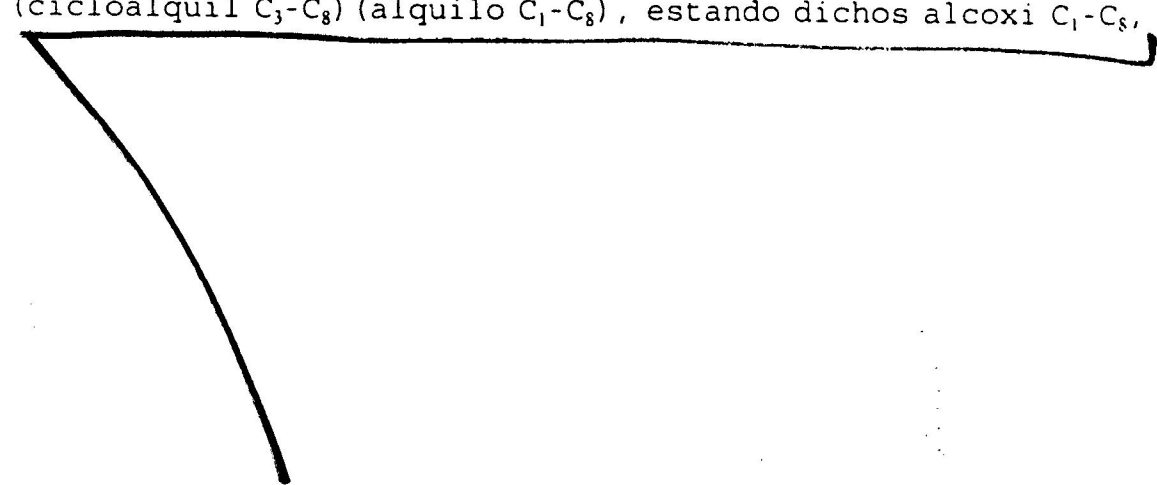
estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o
(cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono-, di- o
trisustituidos independientemente con hidroxí, halógeno o
5 cicloalquilo C₃-C₆; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de
un alquilo C₁-C₆, estando dicho fenilo opcionalmente mono-,
di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno,
10 (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi
C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),
(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo
15 C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
un anillo piridilo o pirimidilo, estando unido dicho anillo
piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo
20 C₁-C₆; y

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con
hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-
C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈,
cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o
25 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈,



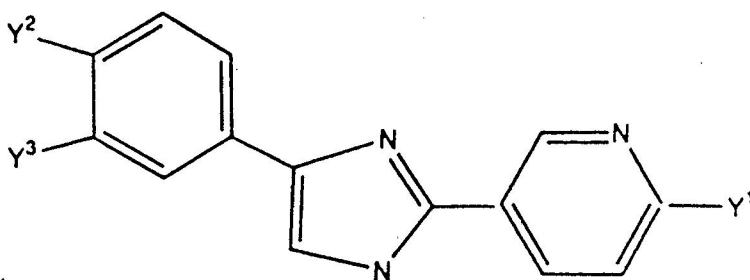
cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 ,
(cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo
 C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxil u
opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
5 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

28. Un compuesto según la reivindicación 27, en el que
Y es 4-fluorofenilo; y
 R^1 es 4-isobutil-3-metilpiperazinilo;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

10 29. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
dicho compuesto

4-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-
il}-1-isobutil-2-metil-piperazina o sus sales
farmacéuticamente aceptables.

15 30. Un compuesto que tiene la Fórmula LXX



LXX

en la que

Y^1 es halógeno, mesilato, p-tosilato, nosilato, piperazinilo
25 o besilato; e

525 7
538
Y² e Y³ son, independientemente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos sustituyentes Y² e Y³ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor.

5 31. Un compuesto según la reivindicación 30, en el que Y¹ es halógeno; e

Y² e Y³ son, independientemente, H, cloro, fluoro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o ciano, estando dichos sustituyentes Y² e Y³ opcionalmente sustituidos con uno a tres átomos de flúor.

10 32. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que Y¹ es cloro; e
Y² e Y³ son cloro.

33. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que Y¹ es cloro; e
15 Y² es cloro e Y³ es fluoro.

34. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que Y¹ es cloro; e
Y² es H e Y³ es ciano.

35. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que
20 Y¹ es piperazinilo ; e
Y² e Y³ son cloro.

36. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que Y¹ es piperazinilo; e
Y² es cloro e Y³ es fluoro.

25 37. Un compuesto según la reivindicación 31, en el que

Y¹ es piperazinilo; e

Y² es H e Y³ es ciano.

38. Un procedimiento para tratar obesidad, que comprende administrar, a un mamífero que necesite dicho
5 tratamiento, una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto según la reivindicación 1, o uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco.

39. Una composición farmacéutica que comprende una
10 cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto según la reivindicación 1, ~~[o uno de sus profármacos]~~ o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, y un portador, vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

15 40. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la obesidad que comprende una cantidad para tratar la obesidad de un compuesto según la reivindicación 1, ~~[o uno de sus profármacos]~~ o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, y un portador,
20 vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

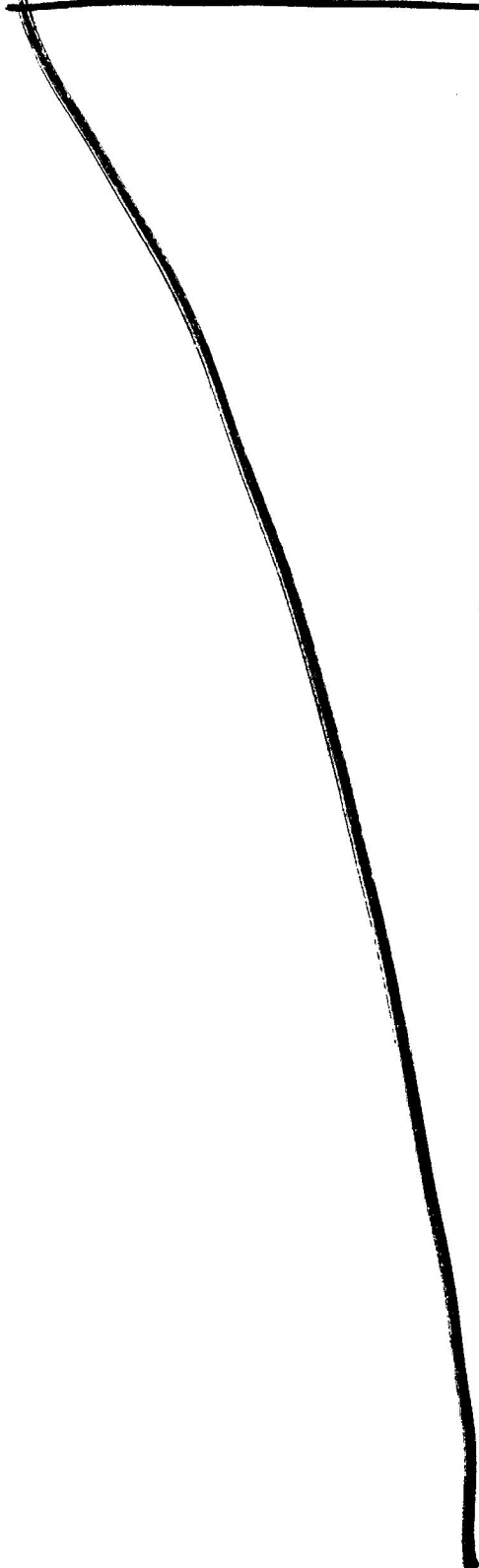
41. Una composición farmacéutica de combinación que comprende: una cantidad terapéuticamente eficaz de una composición que comprende

un primer compuesto, siendo dicho primer compuesto un
25 compuesto según la reivindicación 1, ~~[uno de sus profármacos]~~

o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármco;

un-segundo compuesto, siendo dicho segundo compuesto un agonista β_3 , un agente tiromimético, un agente que modifica 5 el comportamiento de la alimentación, o un antagonista de NPY; y

un portador, vehículo o diluyente farmacéutico.



541
528
66
Esta es una traducción parcial al idioma español de un documento escrito originalmente en el idioma inglés.

5

LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

A TODOS AQUELLOS A QUIEN ESTE DOCUMENTO SE LES PRESENTE:

DEPARTAMENTO DE COMERCIO DE LOS ESTADOS UNIDOS

10

Oficina de Patentes y Marcas de los Estados Unidos

Marzo 3, 2000

5

ESTO ES PARA CERTIFICAR QUE LO ANEXADO A LA PRESENTE ES UNA FIEL COPIA DE LOS EXPEDIENTES DE LA OFICINA DE PATENTES Y MARCAS DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AQUELLOS DOCUMENTOS DE LA SOLICITUD DE PATENTE IDENTIFICADA A CONTINUACION QUE REUNIERON LOS REQUERIMIENTOS PARA QUE SE LE CONCEDA UNA FECHA DE PRESENTACION BAJO 35 USC (Código de los Estados Unidos)

20

111.

NO. DE SOLICITUD: 60/132,029

FECHA DE PRESENTACION: 30 de Abril de 1999

25

SELLO DE LA
OFICINA DE MARCAS Y PATENTES
DE LOS ESTADOS UNIDOS DE

Por la Autoridad del
COMISIONADO DE PATENTES Y MARCAS

[firma ilegible]

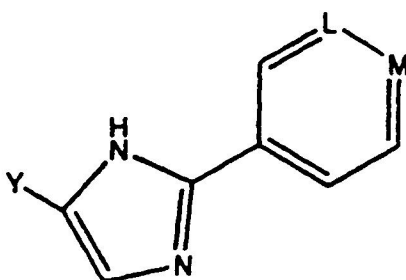
30

H. PHILLIPS
Oficial de Certificación

Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes

Reivindicaciones

1. Un compuesto de Fórmula I



Fórmula I

un profármaco del mismo, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o dicho profármaco;

en la que Y es un anillo aromático de cinco a ocho eslabones, que opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo aromático bicíclico que comprende dos anillos condensados de tres a seis eslabones, tomados independientemente, que opcionalmente tienen uno a cuatro heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, azufre y oxígeno;

en la que dicho anillo Y tiene un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo I, Grupo II y Grupo III:

Grupo I: dicho anillo Y está opcionalmente mono-, di-

- o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
- 10 Grupo II: dicho anillo Y está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, estando dicho anillo de
- 15 cuatro a siete eslabones opcionalmente mono- o disustituido independientemente con alquilo C_1-C_3 , estando dicho alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor; o
- 20 Grupo III: dicho anillo Y está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino, estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino
- 25 opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente

544
531
697

en cada alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-C_6 , hidroxí, alcoxi C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_3), ciano o fluoro;

5 cada uno de L y M son independientemente carbono o nitrógeno, con la condición de que L y M no sean iguales, estando dicho carbono unido a un anillo R^3 a través de un nitrógeno del anillo R^3 ;

siendo R^3 un anillo saturado o parcialmente saturado que contiene nitrógeno de cuatro a ocho eslabones, que 10 opcionalmente tiene un heteroátomo adicional seleccionado independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno;

estando opcionalmente dicho anillo R^3 opcional adicional monosustituido con:

1) H o un anillo T, opcionalmente unido a través de un 15 alquilo C_1-C_8 o carbonilo, donde dicho anillo T es un anillo de cinco a ocho eslabones parcialmente saturado o totalmente insaturado que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno o donde dicho anillo T es un anillo saturado de 20 cuatro a siete eslabones que tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno o donde dicho anillo T es un anillo aromático bicíclico formado por dos anillos condensados de tres a seis eslabones, tomados independientemente, que opcionalmente 25 tienen uno a cuatro heteroátomos seleccionados

independientemente de nitrógeno, azufre y oxígeno;

estando dicho anillo T sustituido con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo IV, Grupo V y Grupo VI:

- 5 Grupo IV: dicho anillo T está opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquiloxi C_1-C_6), alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquiloxi C_1-C_6) y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
- 10

- Grupo V: dicho anillo T está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino, estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C_3-C_6) amino o N- (alquil C_1-C_6) -N- (cicloalquil C_3-C_6) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada uno de dichos alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-C_6 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_3), ciano o fluoro;
- 15
- 20

- Grupo VI: dicho anillo T está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno
- 25

547
534
77

72

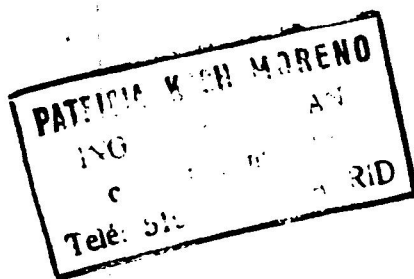
72

72

72

535

3) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo, estando dichos (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxilo, ciano, fluoro, alcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆) o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos alcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆) o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno



549
536
7-4-

-205-

a nueve átomos de flúor;

4) sulfonilo, estando dicho sulfonilo opcionalmente monosustituido con amino, hidroxí, alquénilo C_2-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 ,
5 (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) (alquilo C_1-C_8), estando dichos restos alquénilo C_2-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) y cicloalcoxi C_3-C_8 opcionalmente sustituidos con uno a nueve
10 átomos de flúor;

o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino o N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino;

15 estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) amino o N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada uno de dichos alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 con cicloalquilo C_3-C_6 ,
20 hidroxí, alcoxi C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_6 , ciano o fluoro;

o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con un anillo parcialmente insaturado o totalmente insaturado de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno,
25 azufre y nitrógeno, un anillo saturado de cuatro a siete

550
37
7

eslabones que tiene uno a dos heteroátomos seleccionados
independientemente de oxígeno, azufre o nitrógeno, o un
anillo bicíclico aromático formado por dos anillos
condensados de tres a seis eslabones, tomados
independientemente, que opcionalmente tienen uno a cuatro
heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno,
azufre y oxígeno;

estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

estando dicho anillo R^3 opcionalmente mono- o
disustituido independientemente en un único carbono u
20 opcionalmente monosustituido independientemente en dos átomos
de carbono con R^5 o R^6 , siendo R^5 y R^6 independientemente

1) H, carboxi, oxo, amino, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, alcoxi C_1-C_8 , (cicloalcoxi C_3-C_8), (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8), estando
25 dichos sustituyentes alcoxi C_1-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi

PATRICIA KOCH MORENO
INGLES Y AL VIAN
c. 111
Telé. 111-1111
L. RID

-207-

\$51
538
76

Teñi... (C₁-C₈) y cicloalcoxi C₃-C₈ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor u opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí;

2) mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-
5 N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada uno de dichos
10 alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), ciano o tienen uno a nueve átomos de flúor;

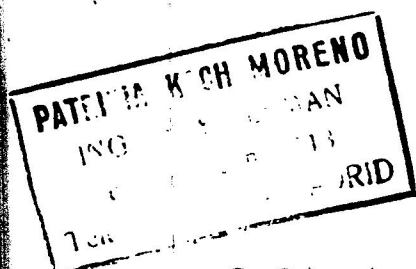
3) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-
15 C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo, estando dichos (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (cicloalcoxi C₃-C₈)carbonilo, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)carbonilo, (alquil C₁-C₈)formilo, (cicloalquil C₃-C₈)formilo o (cicloalquil C₃-C₈) (alquil C₁-C₈)formilo
20 opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, ciano, fluoro, alcoxi C₁-C₆ o alquilo C₁-C₆, estando dichos alcoxi C₁-C₆ o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

4) un anillo X, opcionalmente unido a través de un
25 alquilo C₁-C₈ o carbonilo, siendo dicho anillo X un anillo

parcialmente insaturado o totalmente insaturado de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno o dicho anillo X es un anillo saturado de cuatro a siete eslabones que tiene uno a tres heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, azufre y nitrógeno, o dicho anillo X es un anillo aromático bicíclico formado por dos anillos condensados de tres a seis eslabones, tomados independientemente, que opcionalmente tienen uno a cuatro heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, azufre y oxígeno; estando dicho anillo X opcionalmente sustituido con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo XI, Grupo XII o Grupo XIII

Grupo XI: dicho anillo X está opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4)tio, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6) y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo XII: dicho anillo X está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil

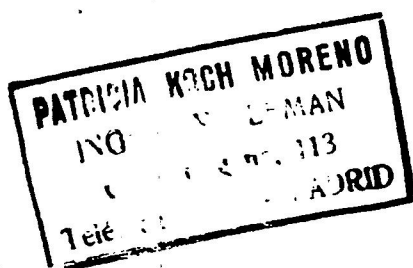


C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆) amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino;

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆) amino o N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, ciano o flúor; o

Grupo XIII: dicho anillo X está opcionalmente monosustituido con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, unido al anillo X aromático a través de un nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₃, estando dicho alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

5) alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈); estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor y dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) están opcionalmente sustituidos con un máximo de tres sustituyentes seleccionados independientemente del Grupo XIV, Grupo XV, Grupo XVI o Grupo XVII; en los que



-210-

Grupo XIV: dichos alquilo C_1-C_8 , o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) cicloalquilo C_3-C_8 están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) aminocarbonilo, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) aminocarbonilo, carboxi, nitro, amino, hidroxilo, alqueno C_2-C_6 , (alquil C_1-C_4) tio, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 o (alcoxi C_1-C_6) carbonilo, estando dichos restos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) aminocarbonilo, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C_3-C_6) aminocarbonilo, N-(alquil C_1-C_6)-N-(cicloalquil C_3-C_6) aminocarbonilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo XV: dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) están opcionalmente monosustituidos con un anillo saturado que contiene nitrógeno de cuatro a siete eslabones, unido a través de un nitrógeno del anillo, que tiene opcionalmente uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, estando dicho anillo de cuatro a siete eslabones opcionalmente sustituido con alquilo C_1-C_5 , estando dicho alquilo C_1-C_5 opcionalmente sustituido con uno a nueve átomos de flúor;

Grupo XVI: dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o

(cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, estando dichos
5 mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente en cada alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxí, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-
10 C₆, ciano o fluoro;

Grupo XVII: dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) están opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con (alcoxi C₁-C₆) carbonilo o (alquil C₁-C₆) formilo, estando dichos (alcoxi
15 C₁-C₆) carbonilo o (alquil C₁-C₆) formilo opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxí, ciano, fluoro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
20 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

6) sulfonilo, estando dicho sulfonilo opcionalmente monosustituido con amino, hidroxí, alqueno C₂-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-
25 C₈, estando dichos restos alqueno C₂-C₈, (cicloalquil C₃-

C₈) (alquilo C₁-C₈), (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈), alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈ o cicloalcoxi C₃-C₈, opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o dicho sulfonilo está opcionalmente monosustituido con mono-
5 N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino;

estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino o N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino opcionalmente mono-, di- o
10 trisustituidos independientemente en cada uno de dichos alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆ con cicloalquilo C₃-C₆, hidroxilo, alcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, ciano o fluoro.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos
15 anillos aromáticos Y están opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es carbono;

20 M es nitrógeno;

R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones;

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

25 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o

(cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno o azufre, estando unido dicho anillo T opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o trisustituido opcionalmente y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),

(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5 3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a seis eslabones; y R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

10 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
15 fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-
20 C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

 estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

25 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con

piridilo o pirimidilo, estando unidos dichos piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

4. Un compuesto según la reivindicación 3, en el que
5 Y es fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alquilo C₁-C₂, ciano o trifluorometilo; y

R³ es piperazinilo opcionalmente monosustituido en el nitrógeno con alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o (cicloalquil
10 C₃-C₆) (alquilo C₁-C₄), estando dichos sustituyentes opcionalmente monosustituidos con hidroxilo o mono-, di- o trisustituidos con fluoro,
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
15 Y es 3,4-diclorofenilo, y
R³ es N-etilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

6. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-clorofenilo; y
20 R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

7. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3,4-difluorofenilo; y
R³ es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;
25 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- 560
547
4
*
8. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-clorofenilo; y
R³ es N-(n-propil)piperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 5 9. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-cloro-4-fluorofenilo; y
R³ es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 10 10. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 4-cloro-3-metilfenilo; y
R³ es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 15 11. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3,4-difluorofenilo; y
R³ es N-(2-ciclopropiletil)-piperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 20 12. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-cloro-4-fluorofenilo; y
R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 25 13. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-cloro-4-fluorofenilo; y
R³ es N-(2-ciclopropiletil)-piperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
14. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que

- Y es 3-etilfenilo; y
R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 5 15. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-clorofenilo; y
R³ es N-2,2,2-trifluoroetilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 10 16. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 4-trifluorometilfenilo; y
R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 15 17. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3,5-difluorofenilo; y
R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 20 18. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-clorofenilo; y
R³ es N-(3-hidroxi-1,2-dimetil-n-propil)piperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 25 19. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que
Y es 3-cianofenilo; y
R³ es N-isobutilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
20. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que

Y es 3-cianofenilo; y

R³ es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

5 21. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

1-{4-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

10 1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

1-{4-[4-(3,4-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-propil-piperazina;

15 1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

1-{4-[4-(4-cloro-3-metil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

20 1-{4-[4-(3,4-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-ciclopropiletil-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina; o

las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

22. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
25 dicho compuesto

563
550
8

-219-

1-{4-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-
piridin-2-il}-4-ciclopropiletil-piperazina;

1-{4-[4-(3-etil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-
4-isobutil-piperazina;

5 1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-
4-(2,2,2-trifluoroetil)-piperazina;

1-{4-[4-(4-trifluorometil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-
piridin-2-il}-4-ciclopropilmetil-piperazina;

10 1-{4-[4-(3,5-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-
2-il}-4-isobutil-piperazina;

3-(4-{4-[5-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-
il}-piperazin-1-il)-2-metil-butan-1-ol;

3-{2-[2-(4-isobutil-piperazin-1-il)-piridin-4-il]-1H-
imidazol-4-il}-benzonitrilo; o

15 3-{2-[2-(4-ciclopropilmetil-piperazin-1-il)-piridin-4-
il]-1H-imidazol-4-il}-benzonitrilo o las sales
farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

23. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que
Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, estando
20 dichos anillos aromáticos Y opcionalmente mono- o
disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi
C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o
trifluorometoxi;

L es nitrógeno;

25 M es carbono;

R^3 es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones;
 R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo
 C_1-C_8);

5 estando dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o
(cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o
disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente
sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
10 un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo
T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo
opcionalmente mono-, di- o trisustituido opcionalmente y de
forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-
 C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo
15 C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ,
estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6),
(cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo
 C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente
sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

20 R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que
opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados
independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido dicho
anillo T opcionalmente a través de un alquilo C_1-C_6 ,

25 estando dicho anillo T mono-, di- o trisustituido

opcionalmente y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

5 estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

10 24. Un compuesto según la reivindicación 23, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a seis eslabones; y R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

15 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con
20 fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆, y estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-
25 C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

5 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo de piridilo o pirimidilo, estando unido dicho anillo de piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆,

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

10 25. Un compuesto según la reivindicación 24, en el que Y es fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alquilo C₁-C₂, ciano o trifluorometilo; y

R³ es piperazinilo opcionalmente monosustituido en el
15 nitrógeno con alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₄), estando dichos sustituyentes opcionalmente monosustituidos con hidroxilo o mono-, di- o trisustituidos con fluoro,

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

20 26. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que Y es 4-fluorofenilo, y

R³ es N-isobutilpiperazinilo;

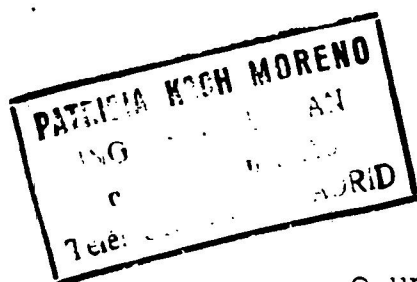
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

27. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que

25 Y es 4-fluorofenilo; y

-223-

- R^3 es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
28. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 3,4-diclorofenilo; y
- 5 R^3 es N-ciclopropilmetilpiperazinilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
29. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 3,4-diclorofenilo; y
- R^3 es N-isobutilpiperazinilo;
- 10 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
30. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 4-clorofenilo; y
- R^3 es N-etilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 15 31. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 4-clorofenilo; y
- R^3 es N-isobutilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
32. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
- 20 Y es 3-clorofenilo; y
- R^3 es N-etilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
33. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 2-clorofenilo; y
- 25 R^3 es N-etilpiperazinilo;



568
555
L

- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
34. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 4-fluorofenilo; y
R³ es N-2,2,2-trifluoroetilpiperazinilo;
- 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
35. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 3-clorofenilo; y
R³ es N-2,2,2-trifluoroetilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 10 36. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
Y es 4-clorofenilo; y
R³ es N-2,2,2-trifluoroetilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
37. Un compuesto según la reivindicación 25, en el que
15 Y es 3-cloro-4-fluoro-fenilo; y
R³ es N-etilpiperazinilo;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
38. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
dicho compuesto
- 20 1-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-
il}-4-isobutil-piperazina;
- 1-ciclopropilmetil-4-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-
2-il]-piridin-2-il}-piperazina;
- 1-ciclopropilmetil-4-{5-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-
25 imidazol-2-il]-piridin-2-il}-piperazina;

1-{5-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

1-{5-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

5 1-{5-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-isobutil-piperazina;

o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

39. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo
10 dicho compuesto

1-{5-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

1-{5-[4-(2-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

15 1-{4-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina;

1-{4-[4-(3-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina;

20 1-{4-[4-(4-cloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-(2,2,2-trifluoro-etil)-piperazina; o

1-{5-[4-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-4-etil-piperazina;

o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

25 40. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que

Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, estando dichos anillos aromáticos Y opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o

5 trifluorometoxi;

L es carbono;

M es nitrógeno;

R³ es un anillo monoaza saturado de cuatro a seis eslabones, opcionalmente monosustituido en un carbono;

10 R³ está opcionalmente mono- o disustituido independientemente con hidroxilo, oxo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi

15 C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈);

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆)amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi

20 C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene

25 uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de

571
558
96

-227-

nitrógeno o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C_1-C_6 o carbonilo

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido con un anillo X que contiene nitrógeno saturado de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R^3 a través de N y conteniendo dicho enlace opcionalmente un alquilo C_1-C_6 , o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

41. Un compuesto según la reivindicación 40, en el que R^3 está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8), estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-

- C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
- 5 R³ está opcionalmente monosustituido con X, siendo X fenilo, opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆ o carbonilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo
- 10 C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
- 15 R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X de piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo X unido opcionalmente a través de un carbonilo, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
42. Un compuesto según la reivindicación 41, en el que
- 20 Y es fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;
- R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;
- 25 R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxí, amino,

halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
(cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo
C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo
5 C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o
(cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o
disustituídos con hidroxí u opcionalmente tienen uno a nueve
átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituído con fenilo, estando
10 dicho fenilo opcionalmente monosustituído con hidroxí,
(cicloalquil C₃-C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi
C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-
C₆)(alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆)(alcoxi C₁-C₆), alquilo
15 C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆
opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor,
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

43. Un compuesto según la reivindicación 42, en el que
R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;

20 R³ está opcionalmente monosustituído con hidroxí, amino,
halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
(cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo
C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo
25 C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o

(cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5

44. Un compuesto según la reivindicación 43, en el que Y es 3,4-diclorofenilo; y R³ es 4-hidroxipiperidinilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10

45. Un compuesto según la reivindicación 43, en el que Y es 3,4-diclorofenilo; y R³ es 2-hidroxietilpirrolidinilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15

46. Un compuesto según la reivindicación 43, en el que Y es 3,4-diclorofenilo; y R³ es 3-hidroxipiperidinilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

47. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

20

4'-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ol;

2-{4'-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-il}-etanol; o

25

1-{4-[4-(3,4-diclorofenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-pirrolidin-3-ol o las sales farmacéuticamente aceptables

575
562
206

de dichos compuestos.

48. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos anillos aromáticos Y están opcionalmente mono- o
5 disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es nitrógeno;

M es carbono;

10 R³ es un anillo monoaza saturado de cuatro a seis eslabones opcionalmente sustituido en un carbono;

R³ está opcionalmente mono- o disustituido, independientemente, con hidroxilo, oxo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil
15 C₃-C₆) amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈);

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) opcionalmente mono-
20 o disustituidos con hidroxilo y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
25

R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente
5 unido a través de un alquilo C₁-C₆ o carbonilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
10 cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o
15 R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X que contiene nitrógeno saturado de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R³ a través de N y
20 conteniendo dicha unión opcionalmente un alquilo C₁-C₆, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

49. Un compuesto según la reivindicación 48, en el que R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, alcoxi C₁-C₈,
25 cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,

577
\$64
201

-233-

(cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con X, siendo X fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con un anillo X de piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo X unido opcionalmente a través de un carbonilo,
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

50. Un compuesto según la reivindicación 49, en el que Y es fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente mono- o disustituido independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxí, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

-234-

R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;

R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
5 (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo u opcionalmente sustituidos con uno
10 a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente monosustituido con hidroxilo, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
15 cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

20 51. Un compuesto según la reivindicación 50, en el que R³ es pirrolidinilo o piperidinilo;

R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
25 (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo

529
566
10-7-01

C_1-C_8), estando dichos alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

52. Un compuesto según la reivindicación 51, en el que Y es 3,4-diclorofenilo; y R^3 es 4-hidroxipiperidinilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

53. Un compuesto según la reivindicación 51, en el que Y es 3,4-diclorofenilo; y R^3 es 3-isobutilaminopirrolidinilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

54. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

5'-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ol; o

(1-{5-[4-(3,4-dicloro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-pirrolidin-3-il)-isobutil-amina o las sales farmacéuticamente aceptables de dichos compuestos.

55. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos anillos Y están opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C_1-C_4 , hidroxí,

alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi;

L es carbono;

M es nitrógeno;

R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones
5 mono- o disustituido; estando

R³ opcionalmente mono- o disustituido en un carbono,
independientemente, con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o
di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-
C₆) amino, N-(alquil C₁-C₆)-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo
10 C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈),
alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-
C₈);

estando dichos mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino,
mono-N- o di-N,N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, N-(alquil C₁-
15 C₆) amino-N-(cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo C₁-C₈,
cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), alcoxi
C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈)
opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí y
opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

20 o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un
anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que
opcionalmente tiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno
o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través
25 de un alquilo C₁-C₆,

581
568
706

-237-

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
5 cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

10 R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X a través de un carbonilo, siendo X fenilo, furanilo o tiofenilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno,
15 (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆
20 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X que contiene nitrógeno, saturado, de cuatro a siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos
25 heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de

oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R^3 a través de N y conteniendo dicha unión opcionalmente un alquilo C_1-C_6 , y

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8);

estando dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T unido a través de un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo opcionalmente mono-, di- o trisustituido de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene uno a dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido

opcionalmente dicho anillo T a través de un alquilo C_1-C_6 ,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno,

(cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi

5 C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 ;

estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6),

(cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo

C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente

10 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

56. Un compuesto según la reivindicación 55, en el que R^3 es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones monosustituido en un carbono; estando

15 R^3 opcionalmente monosustituido con hidroxí, amino, halógeno,

mono-N- o di-N,N-(alquil C_1-C_6) amino, alcoxi C_1-C_8 ,

cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 ,

(cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo

C_1-C_8), estando dichos alcoxi C_1-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilo

20 C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , (cicloalquil C_3-C_8) (alcoxi C_1-C_8) o

(cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o

disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno

a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido con fenilo, estando

25 dicho fenilo opcionalmente monosustituido con hidroxí,

(cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

57. Un compuesto según la reivindicación 55, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones, estando dicho anillo monosustituido en un carbono y monosustituido en un nitrógeno;

estando R³ opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈),

estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxilo, halógeno, cicloalquilo C₁-C₆; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con fenilo, estando dicho fenilo unido opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆ y estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

5 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo piridilo o pirimidilo, estando dicho anillo piridilo o pirimidilo opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆; o

R³ está monosustituido en un carbono con hidroxilo, amino, 10 halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o 15 (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

58. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que 20 Y es fenilo, benzofuranilo, pirrolilo o tiofenilo, dichos anillos aromáticos Y están opcionalmente mono- o disustituidos independientemente con cloro, fluoro, alcoxi C₁-C₄, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, ciano, trifluorometilo o trifluorometoxi; 25 L es nitrógeno;

586
573
≠

M es carbono;

R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones mono- o disustituido;

R³ opcionalmente mono- o disustituido, independientemente,

5 en carbono, con hidroxil, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈);

10 estando dichos mono-N- o di-N,N- (alquil C₁-C₆) amino, mono-N- o di-N,N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, N- (alquil C₁-C₆) -N- (cicloalquil C₃-C₆) amino, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) opcionalmente mono-
15 o disustituidos con hidroxil y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con un anillo X aromático de cinco a ocho eslabones que opcionalmente tiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno
20 o azufre, estando dicho anillo X opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxil, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
25 C₁-C₆,

587
574
172

cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆),
(cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo
C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
5 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con
un anillo X unido a través de un carbonilo, siendo X fenilo,
furanilo o tiofenilo,

estando dicho anillo X opcionalmente mono-, di- o
10 trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno,
(cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi
C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o
cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-
C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo
15 C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆
opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor;
o

R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con
un anillo X que contiene nitrógeno, saturado, de cuatro a
20 siete eslabones, que opcionalmente tiene uno a dos
heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de
oxígeno, nitrógeno y azufre, estando unido dicho anillo a R³
a través de N y conteniendo dicha unión opcionalmente un
alquilo C₁-C₆, y

25 R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con

alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8);

estando dichos alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 o (cicloalquil C_3-C_8) (alquilo C_1-C_8) opcionalmente mono- o
5 disustituidos independientemente con hidroxí y opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T unido por un carbonilo, siendo el anillo T fenilo, furanilo o tiofenilo, estando dicho anillo
10 opcionalmente mono-, di- o trisustituido de forma independiente con hidroxí, halógeno, (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 , estando dichos restos (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6),
15 (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi C_1-C_6), alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o cicloalcoxi C_3-C_6 opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R^3 está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo T aromático de cinco a ocho eslabones que
20 opcionalmente tiene uno o dos heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno o azufre, estando unido dicho anillo T opcionalmente a través de un alquilo C_1-C_6 ,

estando dicho anillo T opcionalmente mono-, di- o trisustituido y de forma independiente con hidroxí, halógeno,
25 (cicloalquil C_3-C_6) (alquilo C_1-C_6), (cicloalquil C_3-C_6) (alcoxi

C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;

estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

59. Un compuesto según la reivindicación 58, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones monosustituido en un carbono;

en el que

R³ está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆) amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈) (alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxilo u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

R³ está opcionalmente monosustituido con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente monosustituido con hidroxilo, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆, estando dichos restos (cicloalquil C₃-

C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5 60. Un compuesto según la reivindicación 59, en el que R³ es un anillo diaza saturado de cinco a siete eslabones, estando dicho anillo opcionalmente sustituido en un carbono y monosustituido en un nitrógeno;

 estando R³ opcionalmente monosustituido en un nitrógeno
10 con alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈);

 estando dichos alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ o (cicloalquil C₃-C₈) (alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono-, di- o trisustituidos independientemente con hidroxilo, halógeno o
15 cicloalquilo C₃-C₆; o

R³ está monosustituido en un nitrógeno con fenilo, estando dicho fenilo opcionalmente unido a través de un alquilo C₁-C₆, estando dicho fenilo opcionalmente mono-, di- o trisustituido independientemente con hidroxilo, halógeno, (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆;
20

 estando dichos restos (cicloalquil C₃-C₆) (alquilo C₁-C₆), (cicloalquil C₃-C₆) (alcoxi C₁-C₆), alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆ opcionalmente
25 sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o

591
518
176

R³ está opcionalmente monosustituido en un nitrógeno con un anillo piridilo o pirimidilo, estando unido dicho anillo piridilo o pirimidilo opcionalmente a través de un alquilo C₁-C₆; y

- 5 R³ está opcionalmente monosustituido en un carbono con hidroxí, amino, halógeno, mono-N- o di-N,N-(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈), estando dichos alcoxi C₁-C₈,
10 cicloalcoxi C₃-C₈, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, (cicloalquil C₃-C₈)(alcoxi C₁-C₈) o (cicloalquil C₃-C₈)(alquilo C₁-C₈) opcionalmente mono- o disustituidos con hidroxí u opcionalmente sustituidos con uno a nueve átomos de flúor; o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

- 15 61. Un compuesto según la reivindicación 60, en el que Y es 4-fluorofenilo; y

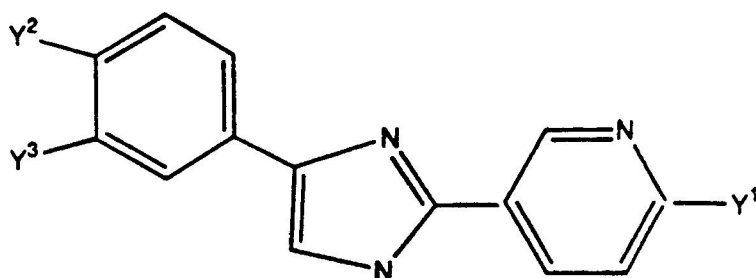
R³ es 4-isobutil-3-metilpiperazinilo;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

- 20 62. Un compuesto según la reivindicación 1, siendo dicho compuesto

4-{5-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-piridin-2-il}-1-isobutil-2-metil-piperazina o sus sales farmacéuticamente aceptables.

63. Un compuesto que tiene la Fórmula LXX



LXX

en la que

Y¹ es halógeno, mesilato, p-tosilato, nosilato, piperazinilo

10 o besilato; e

Y₂ e Y₃ son, independientemente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆,
cicloalquilo C₃-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆,
estando dichos sustituyentes Y₂ e Y₃ opcionalmente sustituidos
con uno a nueve átomos de flúor.

15 64. Un compuesto según la reivindicación 63, en el que
Y¹ es halógeno; e

Y² e Y³ son, independientemente, H, cloro, fluoro, alquilo C₁-
C₆, alcoxi C₁-C₆ o ciano, estando dichos sustituyentes Y² e Y³
opcionalmente sustituidos con uno a tres átomos de flúor.

20 65. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
Y¹ es cloro; e

Y² e Y³ son cloro.

66. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
Y¹ es cloro; e

25 Y² es cloro e Y³ es fluoro.

593
580
148

67. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
Y¹ es cloro; e
Y² es H e Y³ es ciano.

68. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
5 Y¹ es piperazinilo ; e
Y² e Y³ son cloro.

69. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
Y¹ es piperazinilo; e
Y² es cloro e Y³ es fluoro.

10 70. Un compuesto según la reivindicación 64, en el que
Y¹ es piperazinilo; e
Y² es H e Y³ es ciano.

71. Un procedimiento para tratar la obesidad, que
comprende administrar, a un mamífero que necesite dicho
15 tratamiento, una cantidad terapéuticamente eficaz de un
compuesto según la reivindicación 1, o uno de sus
profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho
compuesto o de dicho profármaco.

72. Un procedimiento según la reivindicación 71, en el
20 que la cantidad del compuesto de Fórmula I varía de
aproximadamente 0,01 mg/kg/día a aproximadamente 50
mg/kg/día.

73. Un procedimiento según la reivindicación 72, en el
que el mamífero es un ser humano varón o hembra.

25 74. Una composición farmacéutica que comprende una

cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto según la reivindicación 1, o uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, y un portador, vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

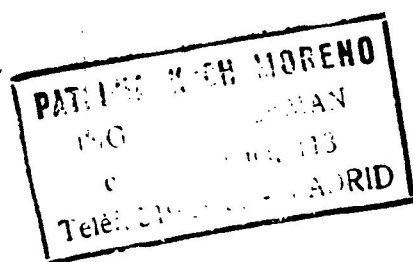
75. Una composición farmacéutica para el tratamiento de la obesidad que comprende una cantidad para tratar la obesidad de un compuesto según la reivindicación 1, o uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco, y un portador, vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

76. Una composición farmacéutica de combinación que comprende: una cantidad terapéuticamente eficaz de una composición que comprende
un primer compuesto, siendo dicho primer compuesto un compuesto según la reivindicación 1, uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco;

un segundo compuesto, siendo dicho segundo compuesto un agonista β_3 , un agente tiromimético, un agente que modifica el comportamiento de la alimentación, o un antagonista de NPY; y

un portador, vehículo o diluyente farmacéutico.

77. Un procedimiento para tratar la obesidad, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho



595
582
72

tratamiento

una cantidad de un primer compuesto, siendo dicho primer compuesto un compuesto según la reivindicación 1, uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco;

una cantidad de un segundo compuesto, siendo dicho segundo compuesto un agonista β_3 , un agente tiromimético, un agente que modifica el comportamiento de la alimentación, o un antagonista de NPY;

teniendo las cantidades de los compuestos primero y segundo como resultado un efecto terapéutico.

78. Un estuche que comprende:

a. en una primera forma de dosis unitaria un primer compuesto, siendo dicho primer compuesto un compuesto según la reivindicación 1, uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco y un portador, vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable;

b. en una segunda forma de dosis unitaria un segundo compuesto, siendo dicho segundo compuesto un agonista β_3 , un agente tiromimético, un agente que modifica el comportamiento de la alimentación, o un antagonista de NPY y un portador, vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable; y

c. medios para contener dichas primera y segunda formas de dosificación,

teniendo las cantidades de los compuestos primero y segundo como resultado un efecto terapéutico.

79. Una composición farmacéutica de combinación que comprende: una cantidad terapéuticamente eficaz de una
5 composición que comprende:

un primer compuesto, siendo dicho primer compuesto un compuesto según la reivindicación 1, uno de sus profármacos, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto o de dicho profármaco;

10 un segundo compuesto, siendo dicho segundo compuesto un inhibidor de la aldosa reductasa, un inhibidor de la glucógeno fosforilasa, un inhibidor de la sorbitol deshidrogenasa, insulina, metformina, acarbosa, una tiazolidindiona, una glitazona, rezulina, troglitazona, una
15 sulfonilurea, glipazida, gliburida o clorpropamida; y

un portador, vehículo o diluyente farmacéutico.

80. Una composición farmacéutica según la reivindicación 79, en la que el inhibidor de la aldosa reductasa es 3,4-dihidro-4-oxo-3-[[5-trifluorometil)-2-
20 benzotiazol]metil]- del ácido 1-ftalazinacético o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

2020
Bogotá, D.C.

Doctor(a)
CARLOS R. OLARTE
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación No.	00-24431
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	581
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la comunidad andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase

Dado en Bogotá, D.C., a los 02 de FEB. 2002


ALIX CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, D.C., 24-01-05 El extracto de esta solicitud fue publicado en el número 517 de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha 27-06-02. El término hábil señalado por la ley expiró el 24-09-02 y SI ☒ NO ☐ se presentaron oposiciones por parte de terceros.

202041

555

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 587

Radicación no 00-24431

Concepto Técnico no 405

Clasificación Internacional de Patentes A61K 31/416A, 31/435

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- SI ☒ NO ☐ Contiene un resumen de la invención (Art.26-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción de la invención (Art.26-b).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☐ Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-i).
- SI ☐ NO ☒ La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-J).
- SI ☒ NO ☐ La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI ☒ NO ☐ **CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☐ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

1. Se modifica el título inicialmente presentado por el consignado en folio 477
2. Anexa nuevo capítulo reivindicatorio en reemplazo del originalmente presentado folios 493 a 540.
3. Anexa nuevo extracto para publicación (folios 488 a 492), folios de propietarios (folio EXAMINADOR TÉCNICO 482) y temática (folios 483 a 487).
4. Se sugiere nueva IPC: A61K 31/416A, 31/435

Bogotá D. C., 13 marzo /02