

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

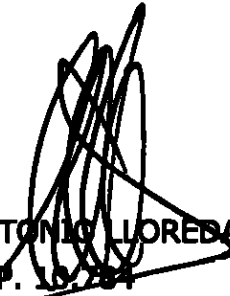
Re: **P1.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "NUEVOS DERIVADOS DE AMINOCICLOHEXANO".-Clase C07C 311/20.- Expediente número 03-012.084.-**

1. Me refiero a mi Solicitud de Patente de 13 de Febrero de 2003.
2. Por medio del presente me permito manifestar a usted que en ejercicio del derecho conferido por el Artículo 28 numeral 1 del Tratado de Cooperación en materia de Patentes PCT, el capítulo reivindicatorio tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional fue modificado al momento de su presentación en Fase Nacional, quedando con 37 reivindicaciones.

Las modificaciones realizadas se encuentran plenamente sustentadas en la descripción de la presente invención y en este sentido, no configuran una ampliación del invento o de la divulgación contenida en la solicitud presentada.

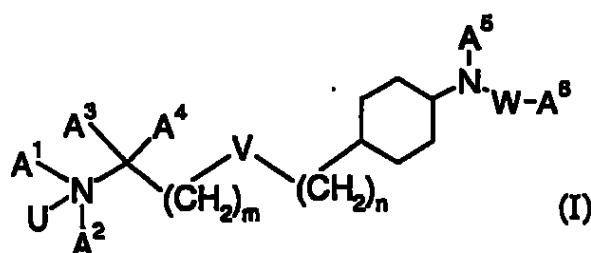
3. Por consiguiente anexo me permito presentar copia del capítulo reivindicatorio correspondiente a la solicitud de la referencia, que consta de 41 reivindicaciones, tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional, junto con su traducción.
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. 10.784
Código 231

Claims

1. Compounds of formula (I)



wherein

5 U is O or a lone pair,

V is O, S, -CH₂-, -CH=CH-, or -C≡C-,

W is CO, COO, CONR¹, CSO, CSNR¹, SO₂, or SO₂NR¹,

m and n independently from each other are 0 to 7 and m+n is 0 to 7, with the proviso that m is not 0 if V is O or S,

10 A¹ is H, lower-alkyl, hydroxy-lower-alkyl, or lower-alkenyl,

A² is lower-alkyl, cycloalkyl, cycloalkyl-lower-alkyl, or lower-alkenyl, optionally substituted by R²,

A³ and A⁴ are hydrogen or lower-alkyl, or

A¹ and A² or A¹ and A³ are bonded to each other to form a ring
 15 and -A¹-A²- or -A¹-A³- are lower-alkylene or lower-alkenylene, optionally substituted by R², in which one -CH₂- group of -A¹-A²- or -A¹-A³- can optionally be replaced by NR³, S, or O, or

A³ and A⁴ are bonded to each other to form a ring together with the carbon atom to which they are attached and -A³-A⁴- is -(CH₂)₂₋₅- which can optionally be mono- or
 20 multiply-substituted by lower-alkyl,

A⁵ is H, lower-alkyl, lower-alkenyl, or aryl-lower-alkyl,

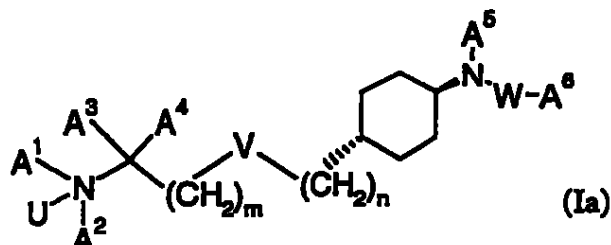
A⁶ is lower-alkyl, cycloalkyl, aryl, aryl-lower-alkyl, heteroaryl, heteroaryl-lower-alkyl, lower-alkoxy-carbonyl-lower-alkyl,

R² is hydroxy, hydroxy-lower-alkyl, lower-alkoxy, lower-alkoxycarbonyl,
 25 N(R⁴,R⁵), or thio-lower-alkoxy,

R^1 , R^3 , R^4 and R^5 independently from each other are hydrogen or lower-alkyl, and pharmaceutically acceptable salts and/or pharmaceutically acceptable esters thereof.

2. Compounds according to claim 1, wherein A^3 and A^4 are not bonded to each other to form a ring together with the carbon atom to which they are attached.

5 3. Compounds according to any of claims 1 to 2, characterised by formula (Ia)



wherein U, V, W, m, n, A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 and A^6 have the significances given in any of claims 1 to 2.

4. Compounds according to any of claims 1 to 3, wherein U is a lone pair.
- 10 5. Compounds according to any of claims 1 to 4, wherein V is O.
6. Compounds according to any of claims 1 to 4, wherein V is $-CH_2-$.
7. Compounds according to any of claims 1 to 4, wherein V is $-C=C-$.
8. Compounds according to any of claims 1 to 4, wherein V is $-C\equiv C-$.
9. Compounds according to any of claims 1 to 8, wherein W is CO, COO,
- 15 $CONR^1$, $CSNR^1$, SO_2 or SO_2NR^1 and R^1 is hydrogen.
10. Compounds according to any of claims 1 to 9, wherein W is COO or SO_2 .
11. Compounds according to any of claims 1 to 10, wherein n is 0.
12. Compounds according to any of claims 1 to 10, wherein n is 1.
13. Compounds according to any of claims 1 to 12, wherein m is 1 to 6.
- 20 14. Compounds according to any of claims 1 to 12, wherein m is 0 and V is $-C=C-$ or $-C\equiv C-$.

15. Compounds according to any of claims 1 to 14, wherein A^1 is H, methyl, ethyl, isopropyl, 2-hydroxy-ethyl, or 2-propenyl.
16. Compounds according to any of claims 1 to 15, wherein A^2 is lower-alkyl, cycloalkyl-lower-alkyl, or lower-alkenyl, optionally substituted with R^2 , wherein R^2 is
5 hydroxy, methoxy, or ethoxycarbonyl.
17. Compounds according to any of claims 1 to 16, wherein A^2 is methyl, ethyl, 2-hydroxy-ethyl, 2-propenyl, propyl or isopropyl.
18. Compounds according to any of claims 1 to 14, wherein A^1 and A^2 are bonded to each other to form a ring and $-A^1-A^2-$ is lower-alkylene or lower-alkenylene, optionally
10 substituted by R^2 , in which one $-CH_2-$ group of $-A^1-A^2-$ can optionally be replaced by NR^3 , S, or O, wherein R^2 and R^3 are as defined in claim 1.
19. Compounds according to claim 18, wherein A^1 and A^2 are bonded to each other to form a ring and $-A^1-A^2-$ is lower-alkylene or lower-alkenylene, optionally substituted by R^2 , in which one $-CH_2-$ group of $-A^1-A^2-$ can optionally be replaced by O,
15 wherein R^2 is hydroxy or 2-hydroxyethyl.
20. Compounds according to claim 19, wherein A^1 and A^2 are bonded to each other to form a ring and $-A^1-A^2-$ is $-(CH_2)_5-$.
21. Compounds according to any of claims 1 to 20, wherein A^3 is hydrogen.
22. Compounds according to any of claims 1 to 21, wherein A^4 is hydrogen.
- 20 23. Compounds according to any of claims 1 to 19, wherein A^3 and A^4 are bonded to each other to form a cyclopropyl-ring together with the carbon atom to which they are attached and $-A^3-A^4-$ is $-(CH_2)_2-$.
24. Compounds according to any of claims 1 to 23, wherein A^5 is H, lower-alkyl, lower-alkenyl, or benzyl optionally substituted with halogen.
- 25 25. Compounds according to any of claims 1 to 24, wherein A^5 is methyl or ethyl.
26. Compounds according to any of claims 1 to 25, wherein A^6 is lower-alkyl, cycloalkyl, phenyl, naphthyl, phenyl-lower-alkyl, pyridyl, indolyl, indolinyl, thienyl, thienyl-methylene, furyl-methylene, benzodioxyl, chinolyl, isoxazolyl, or imidazolyl, optionally substituted by one or more substituents selected from the group consisting of
30 lower-alkyl, lower-alkoxy, lower-alkylcarbonyl, lower-alkoxycarbonyl, fluorine, chlorine,

bromine, CN, CF₃, NO₂, or N(R⁶,R⁷), wherein R⁶ and R⁷ independently from each other are hydrogen or lower-alkyl.

27. Compounds according to any of claims 1 to 26, wherein A⁶ is phenyl optionally substituted by one or more substituents selected from the group consisting of
5 fluorine, chlorine, bromine, and CF₃.

28. Compounds according to any of claims 1 to 27, wherein A⁶ is 4-chloro-phenyl, 4-bromo-phenyl, or 4-trifluoromethyl-phenyl.

29. A compound according to any of claims 1 to 28, selected from the group consisting of
10 trans-{4-[6-(Allyl-methyl-amino)-hexyloxy]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
trans-{4-[4-(Allyl-methyl-amino)-butoxy]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-trifluoromethyl-phenyl ester,
trans-N-[4-(6-Diethylamino-hexyloxy)-cyclohexyl]-N-methyl-4-trifluoromethyl-
15 benzenesulfonamide,
trans-{4-[4-(Allyl-methyl-amino)-butoxy]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
trans-{4-[2-(Allyl-methyl-amino)-ethylsulfanylmethyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
20 trans-{4-[5-(Allyl-methyl-amino)-pentyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
trans-{4-[4-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-butoxy]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-trifluoromethyl-phenyl ester,
trans-N-[4-(3-Allylamino-propoxy)-cyclohexyl]-N-methyl-4-trifluoromethyl-
25 benzenesulfonamide,
trans-{4-[5-(Allyl-methyl-amino)-pentyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-trifluoromethyl-phenyl ester,
trans-{4-[5-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-pentyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-trifluoromethyl-phenyl ester,
30 trans-{4-[5-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-pentyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-bromo-phenyl ester,
trans-N-[4-[5-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-pentyl]-cyclohexyl]-N-methyl-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
trans-[4-(4-Dimethylamino-butoxy)-cyclohexyl]-methyl-carbamic acid 4-trifluoromethyl-
35 phenyl ester,

- trans-{4-[5-(Allyl-methyl-amino)-pentyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-bromo-phenyl ester,
trans-{4-[3-(Allyl-methyl-amino)-prop-1-ynyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
5 trans-N-{4-[5-(Allyl-methyl-amino)-pentyl]-cyclohexyl}-N-methyl-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
trans-(4-{3-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-propyl}-cyclohexyl)-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester, and
trans-{4-[4-(Allyl-methyl-amino)-butyl]-cyclohexyl}-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
10 and pharmaceutically acceptable salts thereof.

30. A compound according to any of claims 1 to 29, selected from the group consisting of
Trans-N-[4-(4-Dimethylamino-but-1-ynyl)-cyclohexyl]-N-methyl-4-trifluoromethyl-
15 benzenesulfonamide,
trans-Methyl-[4-(5-piperidin-1-yl-pentyl)-cyclohexyl]-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester.
Trans-Methyl-[4-(5-methylamino-pentyl)-cyclohexyl]-carbamic acid 4-trifluoromethyl-phenyl ester,
20 Trans-(4-{5-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-pent-1-ynyl}-cyclohexyl)-methyl-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,
trans-N-Ethyl-N-(4-{4-[(2-hydroxy-ethyl)-methyl-amino]-butoxy}-cyclohexyl)-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
trans-(1E)-N-(4-{3-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-propenyl}-cyclohexyl)-N-methyl-4-
25 trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
Trans-4-Bromo-N-[4-(2-diisopropylamino-ethoxy)-cyclohexyl]-N-methyl-benzenesulfonamide,
trans-Methyl-[4-(4-piperidin-1-yl-butyl)-cyclohexyl]-carbamic acid 4-bromo-phenyl ester,
30 trans-N-Methyl-N-[4-(4-piperidin-1-yl-butyl)-cyclohexyl]-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
trans-N-(4-{4-[Bis-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-butoxy}-cyclohexyl)-N-ethyl-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,
Trans-4-Bromo-N-methyl-N-[4-(2-piperidin-1-yl-ethoxy)-cyclohexyl]-
35 benzenesulfonamide,
trans-N-[4-(4-Dimethylamino-butoxy)-cyclohexyl]-N-ethyl-4-trifluoromethyl-

benzenesulfonamide,

Trans-Methyl- {4- [3-(methyl-propyl-amino)-prop-1-ynyl]-cyclohexyl}-carbamic acid 4-chloro-phenyl ester,

trans-(1E)-N-Methyl-N-{4-[3-(methyl-propyl-amino)-propenyl]-cyclohexyl}-4-

5 trifluoromethyl-benzenesulfonamide,

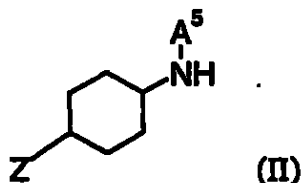
Trans-N-(4-{4-[Ethyl-(2-hydroxy-ethyl)-amino]-but-1-ynyl}-cyclohexyl)-N-methyl-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,

Trans-N-Methyl-N-{4-[4-(methyl-propyl-amino)-but-1-ynyl]-cyclohexyl}-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide, and

10 Trans-N-{4-[2-(1-Dimethylamino-cyclopropyl)-ethoxy]-cyclohexyl}-N-methyl-4-trifluoromethyl-benzenesulfonamide,

and pharmaceutically acceptable salts thereof.

31. A process for the manufacture of compounds according to any of claims 1 to 30, which process comprises reacting a compound of formula (II)



15

wherein

A^5 has the significance given in claim 1,

Z is a group $(A^1, A^2,)N-C(A^3, A^4)-(CH_2)_m-V-(CH_2)_n$ or $HO-(CH_2)_m$ wherein A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , V, m and n have the significances given in claim 1,

20 with $ClSO_2-A^6$, $ClCOO-A^6$, $ClCSO-A^6$, $OCN-A^6$, $SCN-A^6$, $HOOC-A^6$, or $ClSO_2NR^1-A^6$, wherein A^6 has the significance given in claim 1.

32. Compounds according to any of claims 1 to 30 when manufactured by a process according to claim 31.

33. Pharmaceutical compositions comprising a compound according to any of
25 claims 1 to 30 and a pharmaceutically acceptable carrier and/or adjuvant.

34. Compounds according to any of claims 1 to 30 for use as therapeutic active substances.

35. Compounds according to any of claims 1 to 30 for use as therapeutic active substances for the treatment and/or prophylaxis of diseases which are associated with OSC.

36. A method for the treatment and/or prophylaxis of diseases which are associated with OSC such as hypercholesterolemia, hyperlipemia, arteriosclerosis, vascular diseases, mycoses, parasite infections, gallstones, tumors and/or hyperproliferative disorders, and/or treatment and/or prophylaxis of impaired glucose tolerance and diabetes, which method comprises administering a compound according to any of claims 1 to 30 to a human being or animal.

37. The use of compounds according to any of claims 1 to 30 for the treatment and/or prophylaxis of diseases which are associated with OSC.

38. The use of compounds according to any of claims 1 to 30 for the treatment and/or prophylaxis of hypercholesterolemia, hyperlipemia, arteriosclerosis, vascular diseases, mycoses, parasite infections, gallstones, tumors and/or hyperproliferative disorders, and/or treatment and/or prophylaxis of impaired glucose tolerance, and diabetes.

39. The use of compounds according to any of claims 1 to 30 for the preparation of medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases which are associated with OSC.

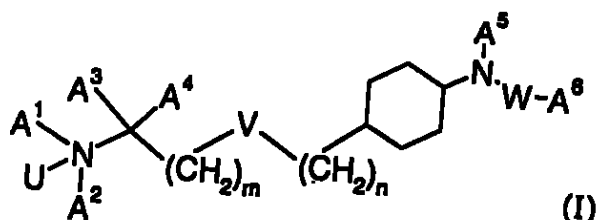
40. The use of compounds according to any of claims 1 to 30 for the preparation of medicaments for the treatment and/or prophylaxis of hypercholesterolemia, hyperlipemia, arteriosclerosis, vascular diseases, mycoses, parasite infections, gallstones, tumors and/or hyperproliferative disorders, and/or treatment and/or prophylaxis of impaired glucose tolerance and diabetes.

41. The novel compounds, processes and methods as well as the use of such compounds substantially as described hereinbefore.

Reivindicaciones

1. Compuestos de fórmula (I)

5



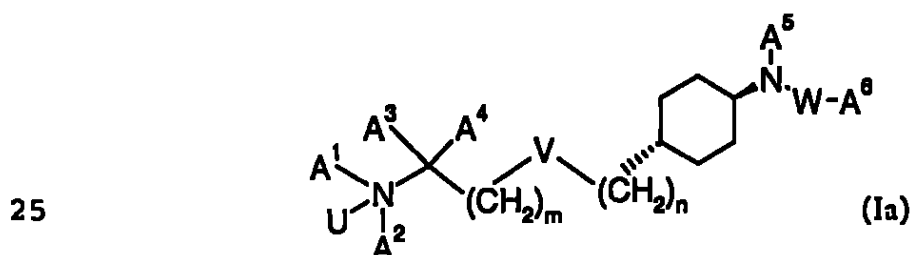
en donde

- 10 U es O o un par libre,
V es O, S, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, o $-\text{C}\equiv\text{C}-$,
W es CO, COO, CONR^1 , CSO, CSNR^1 , SO_2 , o SO_2NR^1 ,
m y n son independientemente entre sí 0 a 7 y m+n es 0 a 7, con la condición de que m no es 0 si V es O ó
15 S,
A¹ es H, alquilo inferior, hidroxi-alquilo inferior, o alquenilo inferior,
A² es alquilo inferior, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo inferior, o alquenilo inferior, opcionalmente sustituido por R²,
20 A³ y A⁴ son hidrógeno o alquilo inferior, o
A¹ y A² o A¹ y A³ están unidos entre sí para formar un anillo y $-\text{A}^1-\text{A}^2-$ ó $-\text{A}^1-\text{A}^3-$ son alquileno inferior o alquenileno inferior, opcionalmente sustituidos por
25 R², en que uno de los grupos $-\text{CH}_2-$ de $-\text{A}^1-\text{A}^2-$ ó $-\text{A}^1-\text{A}^3-$ puede estar opcionalmente sustituido por NR³, S, ó O, o
A³ y A⁴ están unidos entre sí para formar un anillo junto

- con el átomo de carbono al que están unidos y $-A^3-$
 A^4- es $-(CH_2)_{1-5}-$ que puede estar opcionalmente mo-
no- o multi-sustituido por alquilo inferior,
5 A^5 es H, alquilo inferior, alqueno inferior, o
aril-alquilo inferior,
 A^6 es alquilo inferior, cicloalquilo, arilo, aril-
alquilo inferior, heteroarilo, heteroaril-alquilo
inferior, alcoxilo inferior-carbonil-alquilo infe-
rior,
10 R^4 es hidroxilo, hidroxil-alquilo inferior, alcoxilo
inferior, alcoxilo inferior-carbonilo, $N(R^4, R^5)$, o
tio-alcoxilo inferior,
 R^1 , R^3 , R^4 y R^5 son, independientemente entre sí, hidrógeno o
alquilo inferior,
15 y sales farmacéuticamente aceptables y/o ésteres farmacéu-
ticamente aceptables de los mismos.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en
donde A^3 y A^4 no están unidos entre sí formando un anillo
junto con el átomo de carbono al que están unidos.

- 20 3. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las rei-
vindicações 1 a 2, caracterizados por la fórmula (Ia)



en donde U, V, W, m, n, A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y A^6 tienen los
significados dados en cualquiera de las reivindicaciones 1

a 2.

4. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde U es un par libre.

5. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde V es O.

6. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde V es $-\text{CH}_2-$.

7. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde V es $-\text{C}=\text{C}-$.

10 8. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde V es $-\text{C}\equiv\text{C}-$.

9. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde W es CO, COO, CONR^1 , CSNR^1 , SO_2 o SO_2NR^1 y R^1 es hidrógeno.

15 10. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en donde W es COO o SO_2 .

11. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en donde n es 0.

20 12. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en donde n es 1,

13. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en donde m es 1 a 6,

14. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en donde m es 0 y V es $-\text{C}=\text{C}-$ o $-\text{C}\equiv\text{C}-$.

25 15. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, en donde A^1 es H, metilo, etilo, isopropilo, 2-hidroxietilo, o 2-propenilo.

16. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las rei-

vindicaciones 1 a 15, en donde A^2 es alquilo inferior, cicloalquil-alquilo inferior, o alqueno inferior, opcionalmente sustituido con R^2 , en donde R^2 es hidroxilo, metoxilo, o etoxicarbonilo.

- 5 17. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, en donde A^2 es metilo, etilo, 2-hidroxietilo, 2-propenilo, propilo o isopropilo.

- 10 18. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, en donde A^1 y A^2 están unidos entre sí formando un anillo y $-A^1-A^2-$ es alqueno inferior o alqueno inferior, opcionalmente sustituido por R^2 , en donde un grupo $-CH_2-$ de $-A^1-A^2-$ puede estar opcionalmente reemplazado por NR^3 , S, ó O, en donde R^2 y R^3 son como se ha definido en la reivindicación 1.

- 15 19. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 18, en donde A^1 y A^2 están unidos entre sí formando un anillo y $-A^1-A^2-$ es alqueno inferior o alqueno inferior, opcionalmente sustituido por R^2 , en donde un grupo $-CH_2-$ de $-A^1-A^2-$ puede estar opcionalmente reemplazado por O, en donde R^2 es hidroxilo o 2-hidroxietilo.

- 20 20. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 19, en donde A^1 y A^2 están unidos entre sí formando un anillo y $-A^1-A^2-$ es $-(CH_2)_5-$.

- 25 21. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, en donde A^3 es hidrógeno.

22. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, en donde A^4 es hidrógeno.

23. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las rei-

vindicaciones 1 a 19, en donde A^3 y A^4 están unidos entre sí formando un anillo de ciclopropilo junto con el átomo de carbono al que están unidos y $-A^3-A^4-$ es $-(CH_2)_2-$.

24. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 23, en donde A^5 es H, alquilo inferior, alquenilo inferior, o bencilo opcionalmente sustituido con halógeno.

25. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 24, en donde A^5 es metilo o etilo.

10 26. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25, en donde A^6 es alquilo inferior, cicloalquilo, fenilo, naftilo, fenil-alquilo inferior, piridilo, indolilo, indolinilo, tienilo, tienil-metileno, furil-metileno, benzodioxilo, quinolilo, isoxazolilo, o imidazolilo, opcionalmente sustituidos por uno o más sustituyentes seleccionados del grupo formado por alquilo inferior, alcoxilo inferior, alquilo inferior-carbonilo, alcoxilo inferior-carbonilo, flúor, cloro, bromo, CN, CF_3 , NO_2 , ó $N(R^6, R^7)$, en donde R^6 y R^7 son independientemente entre sí
15
20 hidrógeno o alquilo inferior.

27. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 26, en donde A^6 es fenilo opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados del grupo formado por flúor, cloro, bromo, y CF_3 .

25 28. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, en donde A^6 es 4-cloro-fenilo, 4-bromo-fenilo, o 4-trifluorometil-fenilo.

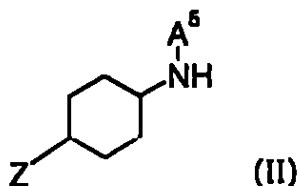
29. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las rei-

- vindicaciones 1 a 28, seleccionado del grupo formado por
- Ácido trans-{4-[6-(alil-metil-amino)-hexiloxi]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
- Ácido trans-{4-[4-(alil-metil-amino)-butoxi]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
- 5 trans-N-[4-(6-Dietilamino-hexiloxi)-ciclohexil]-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- Ácido trans-{4-[4-(alil-metil-amino)-butoxi]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
- 10 Ácido trans-{4-[2-(alil-metil-amino)-etilsulfanilmetil]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
- Ácido trans-{4-[5-(alil-metil-amino)-pentil]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
- Ácido trans-{4-[4-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-butoxi]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
- 15 trans-N-[4-(3-Alilamino-propoxi)-ciclohexil]-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- Ácido trans-{4-[5-(alil-metil-amino)-pentil]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
- 20 Ácido trans-{4-[5-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-pentil]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
- Ácido trans-{4-[5-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-pentil]-ciclohexil}-metil-carbámico 4-bromo-fenil éster,
- trans-N-{4-[5-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-pentil]-ciclohexil}-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- 25 Ácido trans-[4-(4-dimetilamino-butoxi)-ciclohexil]-metil-carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
- Ácido trans-{4-[5-(alil-metil-amino)-pentil]-ciclohexil}-

- metil-carbámico 4-bromofenil éster,
Ácido trans-{4-[3-(alil-metil-amino)-prop-1-inil]-
ciclohexil)-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
trans-N-{4-[5-(alil-metil-amino)-pentil]-ciclohexil)-N-
5 metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
Ácido trans-(4-{3-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-propil}-
ciclohexil)-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster, y
Ácido trans-{4-[4-(alil-metil-amino)-butil]-ciclohexil)-
metil-carbámico 4-clorofenil éster,
10 y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos
30. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las rei-
vindicações 1 a 29, seleccionado del grupo formado por
trans-N-{4-(4-Dimetilamino-but-1-inil)-ciclohexil}-N-metil-
4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
15 Ácido trans-metil-[4-(5-piperidin-1-il-pentil)-ciclohexil]-
carbámico 4-cloro-fenil éster.
Ácido trans-metil-[4-(5-metilamino-pentil)-ciclohexil]-
carbámico 4-trifluorometil-fenil éster,
Ácido trans-(4-{5-[etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-pent-1-
20 inil)-ciclohexil)-metil-carbámico 4-cloro-fenil éster,
trans-N-Etil-N-(4-{4-[(2-hidroxi-etil)-metil-amino]-
butoxi}-ciclohexil)-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
trans-(1E)-N-(4-{3-[Etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-propenil}-
ciclohexil)-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
25 Trans-4-Bromo-N-[4-(2-diisopropilamino-etoxi)-ciclohexil]-
N-metil-bencenosulfonamida,
Ácido trans-metil-[4-(4-piperidin-1-il-butyl)-ciclohexil]-
carbámico 4-bromo-fenil éster,

- trans-N-Metil-N-[4-(4-piperidin-1-il-butil)-ciclohexil]-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- trans-N-(4-{4-[Bis-(2-hidroxi-etil)-amino]-butoxi}-ciclohexil)-N-etil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- 5 Trans-4-Bromo-N-metil-N-[4-(2-piperidin-1-il-etoxi)-ciclohexil]-bencenosulfonamida,
- trans-N-[4-(4-Dimetilamino-butoxi)-ciclohexil]-N-etil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- Ácido trans-metil-(4-[3-(metil-propil-amino)-prop-1-inil]-ciclohexil)-carbámico 4-cloro-fenil éster,
- 10 trans-(1E)-N-Metil-N-{4-[3-(metil-propil-amino)-propenil]-ciclohexil}-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- trans-N-(4-{4-[Etil-(2-hidroxi-etil)-amino]-but-1-inil}-ciclohexil)-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- 15 trans-N-Metil-N-{4-[4-(metil-propil-amino)-but-1-inil]-ciclohexil}-4-trifluorometil-bencenosulfonamida, y
- trans-N-{4-[2-(1-Dimetilamino-ciclopropil)-etoxi]-ciclohexil}-N-metil-4-trifluorometil-bencenosulfonamida,
- y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.
- 20 31. Un proceso para la fabricación de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)

25



en donde

A⁵ tiene el significado dado en la reivindicación 1,
Z es un grupo (A¹, A²,)N-C(A³, A⁴)-(CH₂)_m-V-(CH₂)_n ó HO-(CH₂)_n, en donde A¹, A², A³, A⁴, V, m y n tienen el significado dado en la reivindicación 1,

- 5 con ClSO₂-A⁶, ClCOO-A⁶, ClCSO-A⁶, OCN-A⁶, SCN-A⁶, HOOC-A⁶, ó ClSO₂NR¹-A⁶, en donde A⁶ tiene el significado dado en la reivindicación 1.

32. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 cuando se fabrican mediante un proceso
10 de acuerdo con la reivindicación 31.

33. Composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 y un vehículo y/o adyuvante farmacéuticamente aceptable.

15 34. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para uso como sustancias terapéuticamente activas.

35. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para uso como sustancias terapéuticamente activas para el tratamiento y/o prevención de enfermedades asociadas con la OSC.
20

36. Un método para el tratamiento y/o prevención de enfermedades que están asociadas con la OSC tales como hipercolesterolemia, hiperlipemia, arteriosclerosis, enfermedades vasculares, micosis, infecciones por parásitos, cálculos biliares, tumores y/o trastornos hiperproliferativos, y/o el tratamiento y/o la prevención de la tolerancia a glucosa deficiente y la diabetes, método que comprende la
25

administración de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 a un ser humano o un animal.

37. El uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para el tratamiento y/o prevención de enfermedades asociadas con la OSC.

38. El uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para el tratamiento y/o prevención de la hipercolesterolemia, hiperlipemia, arteriosclerosis, enfermedades vasculares, micosis, infecciones por parásitos, cálculos biliares, tumores y/o trastornos hiperproliferativos, y/o el tratamiento y/o la prevención de la tolerancia a glucosa deficiente y la diabetes.

39. El uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para la preparación de medicamentos para el tratamiento y/o prevención de enfermedades que están asociadas con la OSC.

40. El uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30 para la preparación de medicamentos para el tratamiento y/o prevención de la hipercolesterolemia, hiperlipemia, arteriosclerosis, enfermedades vasculares, micosis, infecciones por parásitos, cálculos biliares, tumores y/o trastornos hiperproliferativos, y/o el tratamiento y/o la prevención de la tolerancia a glucosa deficiente y la diabetes.

41. Los nuevos compuestos, procesos y métodos así como el uso de tales compuestos de forma sustancialmente igual a la aquí descrita.