



No. 08-129207-00006-0000

Fecha: 2012-08-16 16:16:58

Tra. 11 PATENTEIYII

Act. 523 RESPUESTA

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Eve: 378 FASENACIONALI

Folios: 49

Act. 523 RESPUESTA

Folios: 44

Clarke, Modet & Cº**COLOMBIA**

1

P-1805

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E.

S.

D.

Re: Expediente No. **08.129.207**Solicitud de patente a nombre de **GRÜNENTHALGMBH.**

Yo, DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, actuando como apoderada sustituta de acuerdo con la sustitución presentada el 24 de febrero de 2011, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **GRÜNENTHALGMBH.**, domiciliada en Aachen, Alemania, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 07825 notificado por fijación en lista el 18 de mayo de 2012, me manifiestar lo siguiente:

1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo juego de reivindicaciones, que ahora consta de 16 reivindicaciones en donde se realizaron limitaciones tendientes a cubrir una razonable generalización del tipo de compuestos que se encuentran debidamente sustentados en la descripción.

Adicionalmente, se cancelaron las antiguas reivindicaciones 2, 18 a 20 y 21 a 23.

Se cancelaron las expresiones relacionadas con solvatos dentro de todo el capítulo reivindicatorio.

Se cancelaron los términos “al menos” dentro de las antiguas reivindicaciones 15 y 16.

Se modifica el título de la invención en aras de eliminar la parte relacionada con el uso. El nuevo título queda del siguiente tenor:

**4-METIL-1H-PIRROL-2-CARBOXAMIDAS 1,3-DISUSTITUIDAS Y
MEDICAMENTOS QUE LAS CONTIENEN**

Sobre este particular nos permitimos manifestar que las anteriores modificaciones no involucran ampliación alguna de la materia originalmente

presentada en esta solicitud y se brindan como respuesta a las objeciones de claridad expuestas por el señor examinador en el Oficio No. 07825.

Teniendo en cuenta el concepto técnico emitido por el Señor Superintendente Delegado para la propiedad intelectual GianCarlo Marcenaro Jiménez a la doctora Ana Maria Castro Wey, que da alcance a las comunicaciones No. 09-001524 y 09-012566, no se presenta una tasa adicional, toda vez que la solicitud fue presentada con anterioridad al 1 de enero de 2009.

2. Claridad de la solicitud

En relación con las objeciones de claridad, atentamente nos permitimos decir que con las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio, donde se especificaron y limitaron los sustituyentes, quedan cabalmente atendidas las objeciones planteadas por el señor examinador.

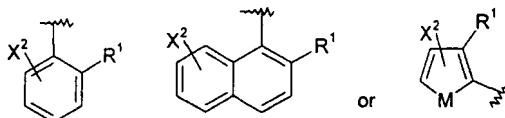
3. Reivindicaciones relativas al uso

Sobre este particular, atentamente manifestamos que con la cancelación de las antiguas reivindicaciones 18 a 20 y 21 a 23 quedan superadas esta objeciones.

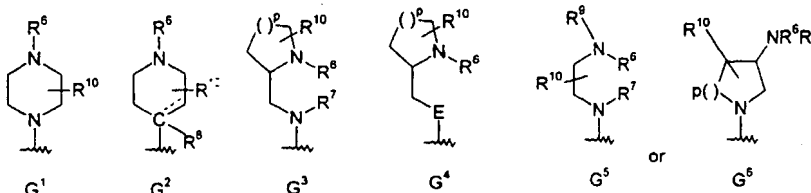
4. Nivel inventivo

El señor examinador indica que la presente invención carece de nivel inventivo en vista de las enseñanzas de D1 (EP0957099) y D2 (WO2004/018455).

En este sentido nos permitimos decir que el documento D1 hace referencia a compuestos con la siguiente fórmula

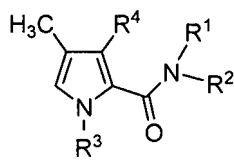


En donde "Y" representa uno de los siguientes grupos:



La conectividad del grupo de carboxamida CONR^2R^3 al pirazolilo no se encuentra definida en **D1**, es decir, dicho grupo se encuentra unido en la posición 2-, 3-, 4-, o -5 del grupo pirazolilo.

En claro contraste, la materia objeto de la nueva reivindicación 1 de la presente invención es un compuesto de la siguiente fórmula



En este sentido, es importante señalar que los compuestos inventivos de la presente invención difieren de aquellos reportados en D1 en que ellos no pueden llevar un grupo fenilo tal como “Y” de acuerdo con D1 como sustituyente de la parte de pirazol, la cual está sustituida por alguno de los residuos específicos G^1 a G^6 que, en su gran mayoría, contienen nitrógeno en su estructura N-heterocicloalifática de acuerdo con D1, dado que tal significado no se encuentra abarcado en las definiciones del correspondiente radical R^4 de los compuestos inventivos de la presente invención. Incluso cuando R^4 denota un anillo fenílico y dicho anillo fenílico pueda no llevar un sustituyente R^1 de acuerdo con D1.

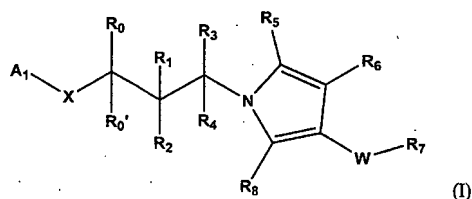
En ese orden de ideas, una persona medianamente versada en la material técnica que conociera las enseñanzas de **D1** habría llegado a la conclusión que el sustituyente específico “Y” de los compuestos de pirazol de **D1** que llevan uno de los residuos específicos que contienen nitrógeno G^1 a G^6 es un pre-requisito indispensable para la actividad farmacológica de los compuestos de D1. Por esta razón, la persona versada en la materia técnica no habría considerado las enseñanzas de **D1**.

Sumado a lo anterior, también es importante señalar que no existe ninguna sugerencia o atisbo en D1 en relación con reemplazar el sustituyente específico “Y” de los compuestos de pirazol de **D1** que llevan uno de los residuos específicos que contienen nitrógeno señalados en D1 como G^1 a G^6 por otro sustituyente. Esto solo se habría logrado de una manera retrospectiva, es decir, con el conocimiento previo de la materia objeto de la presente invención.

Este mismo razonamiento es aplicable en cuanto al documento D2, ya que la persona medianamente versada llegaría a los compuestos reclamados en la presente solicitud a partri de lo reportado en D2 únicamente con el conocimiento previo de la presente invención.

En efecto, la anterioridad **D2** se encuentra dirigida a un compuesto de fórmula (I), en donde el sustituyente W puede ser entre otros, $-\text{CONR}^3$, el cual puede llevar un grupo 3-carboxamida, es decir un grupo carboxaminda en la posición 3

del grupo pirazol:



No obstante, los compuestos reclamados en la presente invención difieren de aquellos reportados en la anterioridad **D2** en que ellos llevan un residuo de carboxamida $C(=O)-NR^1R^2$ en la posición 2- del grupo pirazolilo.

Sobre este particular, es importante señalar que una persona medianamente versada en la materia técnica correspondiente habría llegado a la conclusión de que la conectividad específica del grupo carboxamida de los compuestos de acuerdo con la fórmula (I) de **D2** en la posición 3, era de expresa relevancia y que dicha conectividad era un pre-requisito obligatorio de la actividad farmacológica de los compuestos reportados en dicha anterioridad.

Sumado a lo anterior, es necesario hacer hincapié sobre el hecho que no existe ninguna sugerencia o atisbo en **D2** para modificar los compuestos reportados en **D1** mediante el reemplazo del sustituyente específico “Y” de los compuestos de pirazol de **D1** que llevan uno de los residuos que contienen nitrógeno específicos G1 a G6 por cualquier otro sustituyente en aras de obtener compuestos que pudieran tener una influencia sobre la noradrenalina o la recaptación de serotonina, o que pudieran ser empleados para la regulación del receptor opioide o BTX. Más aún, no existe indicación alguna en estos documentos que sugiera que los compuestos obtenidos por tal clase de modificación pudieran ser útiles para el tratamiento y/o profilaxis de trastornos y/o enfermedades que están mediadas por al menos en parte debido a su influencia o a su afinidad.

Incluso, si una persona medianamente versada en la materia técnica que comenzara sus investigaciones a partir de lo mostrado en **D1** y hubiera considerado lo expuesto en **D2**, para lo cual dicha persona no tuvo incentivo por las razones anteriormente expuestas, y hubiera modificado los compuestos de **D1** mediante el reemplazo del sustituyente “Y” de los compuestos de pirazol de **D1** que llevan uno de los residuos específicos que contienen nitrógeno G1 a G6 por alguno de los sustituyentes adecuados reportados en **D2** en esta posición, dicha persona habría tenido que definir adicionalmente el grupo carboxamida $CONR^2NR^3$ de los compuestos de acuerdo con **D1** para ser enlazados en la posición 3- del pirazolil, dado que **D2** enseña que la presencia de tal grupo carboxamida en la posición 3- es un pre-requisito obligatorio para tales compuestos.

Así la cosas, la persona medianamente versada en la materia no habría llegado a la materia objeto del nuevo pliego reivindicatorio cuando considerara las enseñanzas de D1 y D2 bien sea tenidos en cuenta de manera independiente o en combinación.

Habiendo atendido cabalmente las objeciones presentadas por ese despacho, atentamente solicitamos se conceda el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio o si el examinador considera que subsisten razones para objetar la presente invención rogamus nos informen y/o expidan otro examen de fondo con los debidos motivos y razones que sustenten su objeción con el fin de que mi mandante tenga la posibilidad de exponer sus argumentos con base en la interpretación de los artículos 45 de la Decisión 486 -el cual otorga la facultad al examinador para emitir los exámenes de fondo-, 35 y 59 del Código Contencioso Administrativo que señala que: *“habiéndose dado oportunidad a los interesados para expresar sus opiniones, y con base en las pruebas e informes disponibles, se tomará la decisión que será motivada al menos en forma sumaria si afecta a particulares”* y *“(.) deberá proferirse la decisión definitiva. Esta se motivará en sus aspectos de hecho y de derecho, y en los de conveniencia si es el caso”,* respectivamente (El subrayado es nuestro).

En consecuencia, solicitamos a ese despacho pronunciarse en relación con todos los argumentos presentados en este memorial dando estricta aplicación al principio del debido proceso consagrado en el artículo 29 de la Constitución Nacional

Señor Superintendente,



DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

C.C. 41.654.882 de Bogotá

T.P. 20824 del C.S.J.

mc

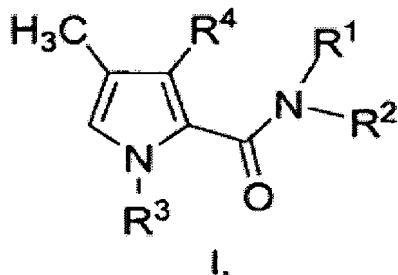
propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃.

5 **3.** Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, caracterizados porque R² denota H; alquilo C₁₋₆, que puede estar insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de
10 F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-O-CH₂-fenilo, -C(=O)-NH-naftilo, -N(CH₃)-fenilo, -N(C₂H₅)-fenilo, -N(C₂H₅)-(m-toluilo), -N(C₂H₅)-(p-toluilo), -N(CH₃)-(p-toluilo) y -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y
15 naftilo que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de alquilenos C₁₋₃, o está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, NO₂, -OH, -O-
20 fenilo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -S(=O)-NH₂, [1.2.3]-tiadiazolilo, pirrolidinilo, fenilo, furilo (furanilo), tiadiazolilo,
25 tiofenilo y (tienilo).

4. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizados porque R¹ y R² forman juntos con el átomo de nitrógeno que los une un radical
30 seleccionado del grupo que consiste de imidazolidinilo, [1,3,4,9]-tetrahydro-b-carbolinilo, piperidinilo, 13

REIVINDICACIONES

1. 4-metil-1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-
disustituidas de la fórmula general I,



en que R¹ denota alquilo insustituido o al menos una vez
sustituido; heteroalquilo, insustituido o al menos una vez
sustituido; cicloalquilo o una vez sustituido; -(alquilen)-
cicloalquilo insustituido o al menos una vez sustituido,
15 (heteroalquilen)-cicloalquilo insustituido o al menos una vez
sustituido;

heterocicloalquilo insustituido o al menos una vez
sustituido, -(alquilen)-heterocicloalquilo insustituido o al
menos una vez sustituido, -(heteroalquilen)-
20 heterocicloalquilo insustituido o al menos una vez
sustituido;

fenilo que puede estar insustituido o sustituido con 1, 2, ó
3 sustituyentes, independientes el uno del otro,
seleccionados del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -
25 CH₂-CN, alquilo C₁₋₅ -(CH₂)-O-alquilo C₁₋₅, -O-Fenilo, -O-CH₂-
Fenilo y -CF₃,

-(alquilen)-arilo insustituido o al menos una vez sustituido,
-(heteroalquilen)-arilo insustituido o al menos una vez
sustituido o -(alquilen)-heteroarilo insustituido o al menos
30 una vez sustituido, -(heteroalquilen)-heteroarilo
insustituido o al menos una vez sustituido o -

(heteroalquilen)-heteroarilo insustituido o al menos una vez sustituido, o -NH-C(=O)-R^5 ;

en donde R^5 denota arilo insustituido o al menos una vez sustituido;

5 R^2 denota H; alquilo insustituido o alquilo al menos una vez sustituido; arilo insustituido o al menos una vez sustituido ó -(alquilen)-arilo insustituido o al menos una vez sustituido,

o

10 R^1 y R^2 denotan, juntos con el átomo de nitrógeno que los une, heterocicloalquilo o heterocicloalqueno que está insustituido o sustituido con al menos un radical R^6 ;

en donde R^6 denota

-OH ; -NH-C(=O)-O-R^7 ; -C(=O)-O-R^8 ; -C(=O)-R^9 ;

15 R^7 , R^8 y R^9 independientemente el uno del otro, denotan en cada caso alquilo insustituido; heteroalquilo insustituido, cicloalquilo insustituido o al menos una vez sustituido; heterocicloalquilo insustituido; arilo insustituido o al menos una vez sustituido; heteroarilo insustituido o al menos una vez sustituido; -(alquilen)-arilo insustituido o al menos una vez sustituido; o $\text{(alquilen)-heteroarilo}$ insustituido o al menos una vez sustituido;

20 ó R^6 denota alquilo insustituido o al menos una vez sustituido, heteroalquilo insustituido o al menos una vez sustituido, cicloalquilo insustituido o al menos una vez sustituido, heterocicloalquilo insustituido o al menos una vez sustituido, $\text{-(alquilen)-cicloalquilo}$ insustituido o al menos una vez sustituido, $\text{-(alquilen)-heterocicloalquil}$ insustituido o al menos una vez sustituido, heteroarilo insustituido o al menos una vez sustituido, (alquilen)-aril insustituido o al menos una vez sustituido ó $\text{-(alquilen)-heteroaril}$ insustituido o al menos una vez sustituido;

2

R³ denota alquilo insustituido o al menos una vez sustituido,
-(alquilen)-aril insustituido o al menos una vez sustituido,

R⁴ denota fenil, el cual está en cada caso insustituido o
5 sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes mutuamente e
independientemente seleccionados del grupo que consiste de F,
Cl, Br, I, alquilo C₁₋₅ y -O-alquilo C₁₋₅ o denota tienilo o
furilo, el cual está en cada caso insustituido;

10 en donde los grupos alquilo anteriormente mencionados son en
cada caso cadena recta o ramificada y comprende 1, 2, 3, 4,
5, 6, 7 ú 8 átomos de carbono como cadenas de unión;

los grupos alquilenos anteriormente mencionados son en cada
caso cadena recta o ramificada y comprende 1, 2, 3, 4, 5, 6,
7, ú 8 átomos de carbono como cadenas de unión;

15 los grupos heteroarilo anteriormente mencionados son en cada
caso de 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- ú 8- miembros y en cada caso
comprende 1, 2 ó 3 heteroátomos mutuamente e
independientemente seleccionados del grupo que consiste de
oxígeno, azufre y nitrógeno como cadenas de unión;

20 los grupos cicloalquilo anteriormente mencionados en cada
caso comprenden 3, 4, 5, 6, ó 7 átomos de carbón como
miembros del anillo,

los grupos heterocicloalquilo anteriormente mencionados son
en cada caso de 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- ó 9- miembros y en
25 cada caso comprende 1, 2 ó 3 heteroátomos mutuamente e
independientemente seleccionados del grupo que consiste de
oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembro ó miembros del
anillo;

Los grupos heterocicloalquilenos anteriormente mencionados son
30 en cada caso de 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, ó 9 miembros y en cada
caso comprenden 1, 2, ó 3 heteroátomos mutuamente e
independientemente seleccionados del grupo que consiste de
oxígeno, azufre y nitrógeno (NH) como miembro o miembros del
anillo;

35 En donde los grupos cicloalquilo, heterocicloalquilo o
heterocicloalquilenos anteriormente mencionados pueden junto

con un grupo adicional cicloalquilo ó heterocicloalquilo formas un residuo espirocíclico por medio de un átomo de carbno común en el anillo;

Los grupos arilo anteriormente mencionados son mono ó
5 bicíclicos y comprenden 6, 10, ó 14 átomos de carbono;

Los grupos hteroarilo anteriormente mencionados son mono-, di- ó tricíclicos y son de 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 10-, 11-, 12-, 13-, ó 14- miembros;

Los grupos arilo, heteroarilo, cicloalquilo,
10 hetrocicloalquilo o hetrocicloalquenilo anteriormente mencionados pueden ser fusionados (anillados) con un sistema de anillo mono ó bicíclico insustituido o al menos una vez sustituido;

15 en donde un sistema de anillo mono- o bicyclico se toma para entendense como residuos hidrocarbonados mono- o bicíclicos, el cual puede ser saturado, insaturado o aromático, en donde los anillos de los sistemas de anillos mono- o bicíclicos anteriormente mencionados son, en cada caso, de 4-, 5- ó 6-
20 miembros y pueden en cada caso opcionalmente comprender 0, 1, 2, ó 3 heteroátomos como miembros del anillo, que son mutuamente e independientemente seleccionados del grupo que consiste de oxígeno, nitrógeno y azufre y en donde los sistemas de anillo mono ó bicíclicos anteriormente
25 mencionados puede ser en cada caso susittuidcon con opcionalmente 1, 2 ó 3 sustituyentes idependientemente seleccionados del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -NH₂, oxo (=O), -alquilo C₁₋₅, -O-alquilo C₁₋₅-, en donde los residuos de alquilo C₁₋₅ pueden, en cada caso, ser
30 lineales o ramificados;

y en donde los residues de alquilo anteriormente mencionados y los residues de hetroalquilo pueden ser sustituidos en cada caso opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes mutuamente e
35 indepenedientemente seleccionados el grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -C(=O)-alquilo C₁₋₅, -C(=O)-fenil, -

C(=O)-O-alquil C₁₋₅, -C(=O)-O-fenil -C(=O)-O-CH₂-fenil, -
N(alquil C₁₋₅)₂, -N(alquil C₁₋₅)(fenil), -N(alquil C₁₋₅)(CH₂-
fenil), -N(alquilC₁₋₅)(CH₂-CH₂-fenil), -C(=O)-NH-alquil C₁₋₅, -
C(=O)-N(alquil C₁₋₅)₂, -C(=O)-NH-fenil, -C(=O)-N(alquil C₁₋₅)-
5 fenil, -C(=O)-NH-naftil, -C(=O)-pirrolidinil, -C(=O)-
piperidinil, en donde los residuos de alquilo C₁₋₅
anteriormente mencionados pueden en cada caso ser lineales o
ramificados y los residuos de fenilo o naftilo pueden ser en
cada caso insustituídos o sustituidos con 1, 2 ó 3
10 sustituyentes mutuamente e independientemente seleccionados
del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -CF₃, -OH,
-O-CF₃, -O-CH₃, -O-C₂H₅, metil, etil, isopropil, n-butil, y
tert.-butil;

15 y en donde los grupos alquilenos y heteroalquilenos
anteriormente mencionados pueden ser en cada caso
insustituídos o sustituidos con opcionalmente 1, 2 ó 3
sustituyentes mutuamente e independientemente seleccionados
del grupo que consiste de fenilo, F, Cl, Br, I, -OH, -O-
20 fenilo, -O-CH₂-fenilo, -N(alquil C₁₋₅)₂, -NH-fenilo, -N(alquil
C₁₋₅)(fenilo), -N(alquiloC₁₋₅)(CH₂-fenilo), -N(alquilC₁₋₅)(CH₂-
CH₂-fenil), -C(=O)-alquilC₁₋₅, -C(=O)-fenil, -C(=O)-O-alquil
C₁₋₅, -C(=O)-O-fenil, -C(=O)-NH-alquilC₁₋₅, y -C(=O)-N(alquil
C₁₋₅)₂, en donde los residuos de alquilo C₁₋₅ anteriormente
25 mencionados pueden ser en cada caso lineales o ramificados y
los residuos de fenil anteriormente mencionados pueden ser
sustituidos con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes mutuamente e
independientemente seleccionados del grupo que consiste de F,
Cl, Br, I, -CN, -OH, -alquil C₁₋₅, -O-alquil C₁₋₅, -O-fenil -O-
30 CH₂-fenil y -CF₃;

y en donde los residuos de cicloalquil y residuos de
heterocicloalquil anteriormente mencionados pueden ser
sustituidos en cada caso con opcionalmente 1, 2, o 3
35 sustituyentes mutuamente e independientemente seleccionados
del grupo que consiste de -OH, -O-alquil C₁₋₅, -O-fenil, -O-

CH₂-fenil, -(CH₂)-O-alquil C₁₋₅, -alquil C₁₋₅, =C(=O)-O-alquil C₁₋₅, oxo (=O), y -C(=O)-alquil C₁₋₅, en donde los residuos de alquilo C₁₋₅ anteriormente mencionados pueden ser en cada caso lineales o ramificados;

5

y en donde a menos de que se indique de otra forma, los residuos de arilo y heteroarilo anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente en cada caso sustituidos con 1, 2, o 3 sustituyentes mutuamente e independientemente seleccionados del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -SH, -NH₂, -alquil C₁₋₅, -O-alquil C₁₋₅, -O-fenil, -O-CH₂-fenil, -CF₃, -O-CF₃, -NH-alquil C₁₋₅, -N(alquil C₁₋₅)₂, -S(=O)₂-NH₂, -C(=O)-alquil C₁₋₅, fenilo, furilo (furanilo), tiazolilo tiadiazolilo, y tiofenilo (tienilo), en donde los residuos alquilo C₁₋₅ anteriormente mencionados pueden ser en cada caso, lineales o ramificados.

en cada caso opcionalmente en forma de sus estereoisómeros puros, en particular enantiómeros o diastereómeros, sus racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o diastereómeros en una proporción de mezcla arbitraria, o en cada caso en forma de las sales correspondientes.

2. Compuestos según la reivindicación 1 caracterizados porque R¹ denota alquilo C₁₋₆, en cada caso insustituido o sustituido con opcionalmente 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-O-CH₂-fenilo, -C(=O)-NH-naftilo, -N(CH₃)-fenilo, -N(C₂H₅)-fenilo, -N(C₂H₅)-(m-toluido), -N(C₂H₅)-(p-toluido), -N(CH₃)-(p-toluido) y -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃; heteroalquilo de 2 a 6 miembros como se define en la reivindicación 1 que está en cada caso insustituido o sustituido con opcionalmente 1, 2, ó 3, sustituyentes, 11

seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, y que posee como miembro(s) de cadena en cada caso 1 o 2 heteroátomo(s) seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de oxígeno, azufre y nitrógeno (NH);

5 cicloalquilo C₃₋₇-, heterocicloalquilo con 5- a 7-miembros, (1,2,3,4)-tetrahydroquinolinilo, (1,2,3,4)-tetrahydroisoquinolinilo, (2,3)-dihidro-1H-isoindolilo, indolinilo, indanilo, (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo, (2,3)-

10 dihidro-benzo[1.4]dioxinilo o benzo[1.3]dioxolilo, que puede estar en cada caso insustituido o sustituido con opcionalmente 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, independientemente seleccionados el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo,

15 isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-fenilo, -O-CH₂-fenilo, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -NO₂, -CF₃, -O-CF₃, CF₃, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-C(CH₃)₃, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH-C₂H₅, -CH₂-naftilo, bencilo y fenilo y puede estar

20 ligado en cada caso mediante un grupo de alquilenos C₁₋₃, o poseer como miembro(s) de anillo en cada caso 1 o 2 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente el uno del otro del grupo que consiste de oxígeno, azufre y nitrógeno (NH); Fenilo que puede estar ligado a través de un grupo

25 alquilenos C₁₋₃, que está insustituido o sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de F, Cl, Br, -C(=O)-O-CH₃ y -C(=O)-O-C₂H₅, o mediante un grupo -CH₂-CH₂-O-, -CH₂-O- o -CH₂-CH₂-CH₂-O o en cada caso insustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados

30 independientemente el uno del otro del grupo que consiste de de F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, -O-fenilo, metilo, etilo, n-

morfolinilo, tiomorfolinilo, pirrolidinilo, piperacinilo, azepanilo, diazepanilo y (1,4)-dioxo-8-aza-spiro[4.5]decilo, que en cada caso está insustituido o sustituido con 1 o 2 radicales R⁶.

- 5 5. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizados porque R³ denota alquilo C₁₋₆, que puede estar insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, ó 3, sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de
- 10 F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, - N(CH₃)(C₂H₅), -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-O-CH₂-fenilo, -C(=O)-NH-naftilo, -N(CH₃)-fenilo, -N(C₂H₅)-fenilo, - N(C₂H₅)-(m-toluilo), -N(C₂H₅)-(p-toluilo), -N(CH₃)-(p-toluilo) y -NH-C(=O)-O-C(CH₃)₃; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo,
- 15 isoxazolilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, piracinilo, piranilo, triazolilo, piridinilo, imidazolilo, indolilo, isoindolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, piridacinilo, e isoquinolinilo que está ligado en cada caso mediante un grupo de alquilo C₁₋₃, que esta
- 20 insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, ó 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, -NO₂, -OH, -SH, -O-fenilo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-
- 25 pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, -CH₂-O-CH₃, -CH₂-O-C₂H₅, -NH₂, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, - S(=O)-CH₃, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)-C₂H₅, -S(=O)₂-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -
- 30 C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃ y -C(=O)-N(CH₃)₂.

6. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizados porque R^4 denota fenilo que está insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -SH, -NH₂, , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, , -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -O-fenilo, -O-CH₂-fenilo, -CF₃, --O-CF₃ , -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -S(=O)₂-NH₂, -, [1,2,3]-tiadiazolilo,.

7. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizados porque R^5 denota un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo, , que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, , -NH₂, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -C(=O)-H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃ y -C(=O)-N(CH₃)₂.

8. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizados porque R^6 denota -OH; F; -NH-C(=O)-O-R⁷; -C(=O)-O-R⁸; -C(=O)-R⁹; y R⁹ como se definió en la reivindicación 1.

9. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizados porque R^7 , R^8 y R^9 denotan, independientemente el uno del otro, alquilo C_{1-6} , que puede estar insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 5 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(CH₃)(C₂H₅), -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃; un radical seleccionado del grupo que consiste de indolinilo, indanilo, (1,2,3,4)- 10 tetrahidronaftilo, (2,3)-dihidro-benzo[1.4]dioxinilo y benzo[1.3]dioxolilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, 15 isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -OH, oxo, tioxo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-fenilo, -O-CH₂-fenilo, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -NH-C₂H₅, -NO₂, -CF₃, -O-CF₃, -S-CF₃, -SH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -C(=O)-C(CH₃)₃, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-NH-C₂H₅, -CH₂-naftilo, 20 bencilo y fenilo; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, piracinilo, piranilo, triazolilo, piridinilo, imidazolilo, indolilo, isoindolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo y piridacinilo que puede estar 25 ligado en cada caso mediante un grupo de alquilenos C_{1-3} , alquenileno C_{2-3} , o alquinileno C_{2-3} que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -CH₂-CN, - 30 NO₂, -OH, -SH, -O-fenilo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-

pentilo, neo-pentilo, etenilo, alilo, etinilo, propinilo, -
NH₂, -C(=O)-OH, -S-CH₃, -S-C₂H₅, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-
C(CH₃)₃, -CF₃, -CHF₂, -CH₂F, -O-CF₃, -O-CHF₂, -O-CH₂F, -C(=O)-
CF₃, -S-CF₃, -S-CHF₂, -S-CH₂F, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃, -
5 NH-C₂H₅, -C(O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-
H, -C(=O)-CH₃, -C(=O)-C₂H₅, -NH-C(=O)-CH₃, -NH-C(=O)-C₂H₅, -
C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH-CH₃, -C(=O)-N(CH₃)₂, -C(=O)-O-CH(CH₃)₂, -
C(=O)-O-(CH₂)₃-CH₃, -C(=O)-NH-C₂H₅, -C(=O)-NH-C(CH₃)₃, -C(=O)-
N(C₂H₅)₂, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo,
10 ciclohexilo, fenilo, furilo (furanilo) y bencilo.

10. Compuestos según una o varias de las
reivindicaciones 1 a 9, caracterizados porque R¹ denota
alquilo C₁₋₆, que puede estar insustituido o sustituido
opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados
15 independientemente el uno del otro del grupo que consiste de
F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(CH₃)(C₂H₅), -
C(O)-O-CH₃, -C(O)-O-C₂H₅, -C(O)-O-C(CH₃)₃, -C(O)-O-CH₂-fenilo,
-C(O)-NH-Naftilo, -N(CH₃)-fenilo, -N(C₂H₅)-fenilo, -N(C₂H₅)-(m-
toluilo), -N(C₂H₅)-(p-toluilo), -N(CH₃)-(p-toluilo) y -NH-
20 C(O)-O-C(CH₃)₃; heteroalquilo de 2 a 6 miembros que está en
cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2,
3, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno
del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH,
y posee como miembro(s) de la cadena en cada caso 1 o 2
25 heteroátomo(s) seleccionado(s) independientemente el uno del
otro del grupo que consiste de oxígeno, azufre y nitrógeno
(NH); Cicloalquilo C₃₋₇, heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros,
heterocicloalquenilo de 5 a 7 miembros, o R¹ y R² denotan
junto con el átomo de nitrógeno que los une un radical
30 seleccionado del grupo que consiste de



30

18

sustituido opcionalmente con 1, 2, 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, etenilo, fenilo, o un radical seleccionado del grupo que consiste de furilo, que está en cada caso insustituido;

R⁷, R⁸ y R⁹ denotan independientemente el uno del otro alquilo C₁₋₆, que puede estar insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(CH₃)(C₂H₅), -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅ y -C(=O)-O-C(CH₃)₃; un radical seleccionado del grupo que consiste de indolinilo, indanilo, (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo, (2,3)-dihidro-benzo[1.4]dioxinilo y benzo[1.3]dioxolilo en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de sus enantiómeros o diastereómeros, de sus racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o diastereómeros, en una proporción arbitraria de mezcla, o en cada caso en forma de las sales correspondientes.

11. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizados porque R¹ denota un radical de alquilo, seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -OH, -

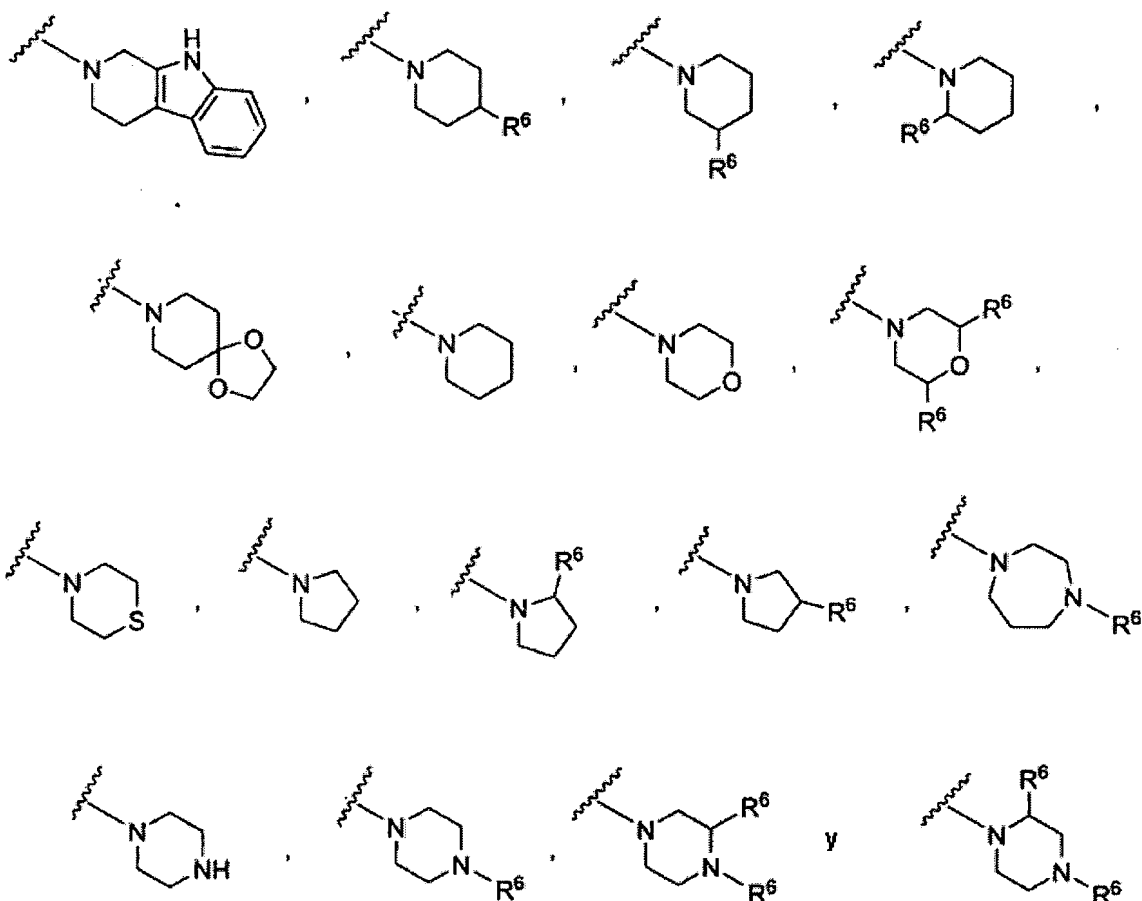
$N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(CH_3)(C_2H_5)$, $-C(=O)-O-CH_3$, $-C(=O)-O-C_2H_5$, $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$, $-C(=O)-O-CH_2$ -fenilo, $-C(=O)-NH$ -Naftilo, $-N(CH_3)$ -fenilo, $-N(C_2H_5)$ -fenilo, $-N(C_2H_5)$ -(m-toluilo), $-N(C_2H_5)$ -(P-toluilo), $-N(CH_3)$ -(p-toluilo); un radical de heteroalquilo
5 seleccionado del grupo que consiste de $-CH_2-O-CH_3$, $-CH_2-O-C_2H_5$, $-CH_2-CH_2-O-CH_3$, $-CH_2-CH_2-O-C_2H_5$, $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_3$ y $-CH_2-CH_2-CH_2-O-C_2H_5$, que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de
10 F, y Cl; un radical seleccionado del grupo que consiste de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclohexenilo, ciclopentenilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes
15 seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, $-O-C_2H_5$, $-O-C_3H_7$, $-O$ -fenilo, $-O-CH_2$ -fenilo, $-CH_2$ -naftilo, bencilo y fenilo y puede estar ligado en cada caso a través de un grupo $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $-CH_2-CH_2-$, $-CH(CH_3)-CH_2-$, $-CH_2-CH(CH_3)-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-$; fenilo que puede estar ligado en cada caso a través de un grupo $-CH_2-CH_2-O-$, $-CH_2-O-$, $-CH_2-CH_2-CH_2-O-$, $-CH[C(=O)-O-CH_3]-CH_2-$, $-CH[C(=O)-O-C_2H_5]-CH_2-$, $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $-CH_2-CH_2-$, $-CH(CH_3)-CH_2-$, $-CH_2-CH(CH_3)-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-$ y que está en
25 cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, $-CN$, $-NO_2$, $-OH$, $-SH$, $-O$ -fenilo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, $-NH_2$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-C_3H_7$, $-O-C(CH_3)_3$, $-CF_3$, $-C(=O)-CH_3$, $-C(=O)-C_2H_5$, $-S(=O)-NH_2$, [1.2.3]-tiadiazolilo;;
30

20

un radical seleccionado del grupo que consiste de naftilo, tienilo, furilo, pirrolilo, piridinilo, imidazolilo que puede estar ligado en cada caso a través de un grupo de CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅;

R² denota H; un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que está insustituido en cada caso; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo que puede estar ligado en cada caso a través de un grupo CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -CHF₂ y -CH₂F; o

R¹ y R² forman junto con el átomo de nitrógeno que los liga un radical del grupo que consiste de



10

R^3 denota un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que en cada caso está insustituido; o un radical de fenilo que está ligado mediante un grupo de $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $-CH_2-CH_2-$, $-CH(CH_3)-CH_2-$, $-CH_2-CH(CH_3)-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-$ y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, $-CN$, $-NO_2$, $-OH$, $-SH$, $-O$ -fenilo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, $-NH_2$, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-C_3H_7$, $-O-C(CH_3)_3$, $-CF_3$, $-O-CF_3$, -;

R^4 denota fenilo, que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, $-CN$, $-OH$, $-SH$, $-NH_2$, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-C_3H_7$, $-O-C(CH_3)_3$,

-CF₃, -O-CF₃, y -NH-CH₃; o un radical seleccionado del grupo que consiste de tienilo, furilo, que está en cada caso insustituido; y

R⁷, R⁸ y R⁹ denotan independientemente el uno del otro en cada caso un radical de alquilo, seleccionado del grupo que
5 consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que está en cada caso insustituido; un radical
10 seleccionado del grupo que consiste de indolinilo, indanilo, (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo, (2,3)-dihidrobenzo[1.4]dioxinilo y benzo[1.3]dioxolilo; en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de sus enantiómeros o diastereómeros, de sus
15 racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o diastereómeros, en una proporción arbitraria de mezcla, o en cada caso en forma de las sales correspondientes.

12. Compuestos según una o varias de las
20 reivindicaciones 1 a 10, caracterizados porque R¹ denota un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que está
25 en cada caso insustituido o sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de -CN, -OH, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -C(=O)-O-CH₃, -C(=O)-O-C₂H₅, -C(=O)-O-C(CH₃)₃, -C(=O)-O-CH₂-fenilo, -C(=O)-NH-Naftilo, -N(CH₃)-fenilo, -N(C₂H₅)-(m-toluilo) y -N(C₂H₅)-(p-toluilo); un radical de heteroalquilo
30 seleccionado del grupo que consiste de -CH₂-O-CH₃, -CH₂-O-C₂H₅,

23

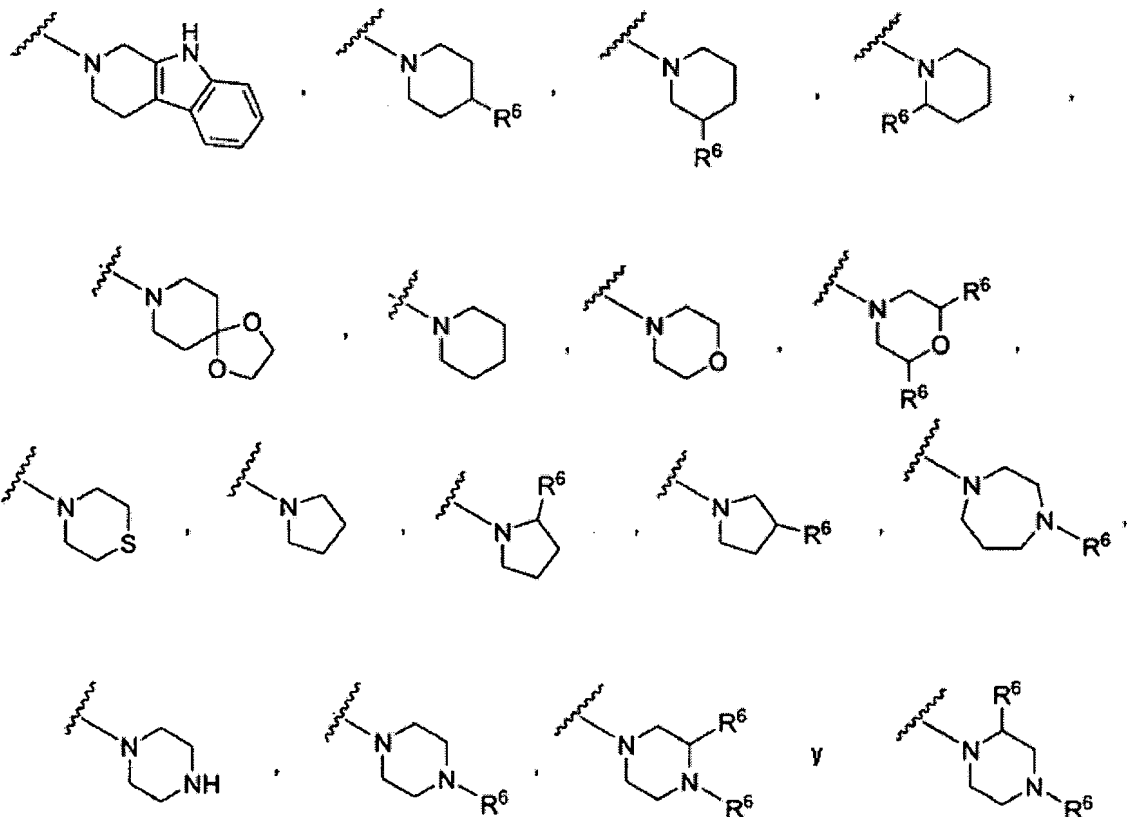
-CH₂-CH₂-O-CH₃, -CH₂-CH₂-O-C₂H₅, -CH₂-CH₂-CH₂-O-CH₃ y -CH₂-CH₂-CH₂-O-C₂H₅; un radical seleccionado del grupo que consiste de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo, piperacínilo, azepanilo, dihidrofuran-2(3H)-onilo, indanilo y (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, -CH₂-naftilo, -O-fenilo, -O-CH₂-fenilo, bencilo y fenilo y puede estar ligado mediante un grupo de -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂-; fenilo que puede estar ligado mediante un grupo de -CH₂-CH₂-O-, -CH₂-O-, -CH₂-CH₂-CH₂-O-, -CH[C(=O)-O-CH₃]-CH₂-, -CH[C(=O)-O-C₂H₅]-CH₂-, -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CH₂-CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, -O-fenilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃; un radical seleccionado del grupo que consiste de tienilo, furilo, pirrolilo, piridinilo, imidazolilo, indolilo y isoindolilo que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-

zu

pentilo y neo-pentilo;

R^2 denota H; un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo, neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que en cada caso está insustituido; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de CH_2- , $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ o $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de $-\text{O}-\text{CH}_3$, $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{O}-\text{C}_3\text{H}_7$ y $-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$; o

R^1 y R^2 juntos con el átomo de nitrógeno que los une un radical seleccionado del grupo que consiste de



R^3 denota un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, n-pentilo, sec-pentilo,

neo-pentilo, (3,3)-dimetil-butilo, 4-metil-2-pentilo y n-hexilo que en cada caso está insustituido; o un radical de fenilo que está ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -CF₃, -O-CF₃,;

R⁴ denota fenilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -O-; o un radical seleccionado del grupo que consiste de tienilo, furilo que está en cada caso insustituido;

R⁵ denota un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, -NH₂, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -O-C₃H₇, -O-C(CH₃)₃, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃ y -NH-C₂H₅;

R⁶ denota -OH; -NH-C(=O)-O-R⁷; -C(=O)-O-R⁸; -C(=O)-R⁹; y R⁷, R⁸ y R⁹ denotan, independientemente el uno del otro, en cada caso; un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo,

2-butilo, isobutilo, terc-butilo y n-pentilo que en cada caso está insustituido; un radical seleccionado del grupo que consiste de (2,3)-dihidro- benzo[1.4]dioxinilo y benzo[1.3]dioxolilo que en cada caso está insustituido; o un
5 radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo, tienilo, furilo y piracinilo que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ o $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ y/o que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2,
10 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neo-pentilo, $-\text{O}-\text{CH}_3$, $-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{O}-\text{C}_3\text{H}_7$ y $-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$; en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus
15 estereoisómeros puros, en particular de sus enantiómeros o diastereómeros, de sus racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o diastereómeros, en una proporción arbitraria de mezcla, o en cada caso en forma de las sales correspondientes.

20 13. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizados porque R^1 denota un radical seleccionado del grupo que consiste de $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)-$ (m-toluilo), $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)-$ (p-toluilo), $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-$ fenilo, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$,
25 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CN}$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH}$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, n-pentilo, n-butilo, metilo, etilo, n-propilo, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-$ fenilo, $-\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-$ fenilo, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$ $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}$ -naftilo
30 y $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$; un radical seleccionado del grupo que consiste de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo,

27

ciclohexilo, cicloheptilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo, piperacinilo, azepanilo, dihidrofuran-2(3H)-onilo, indanilo y (1,2,3,4)-tetrahidronaftilo que está en cada caso insustituido o

5 sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de metilo, etilo, -CH₂-naftilo, -O-fenilo, -O-CH₂-fenilo y bencilo y/o que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-, -CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-; fenilo

10 que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-CH₂-O-, -CH[C(=O)-O-CH₃]-CH₂-, -CH[C(=O)-O-C₂H₅]-CH₂-, -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂-CH(CH₃)- o -CH₂-CH₂-CH₂- y/o que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados

15 independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CH₂-CN, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, 2-butilo, terc-butilo, -O-fenilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -CF₃, -O-CF₃, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -S(=O)-NH₂ y [1.2.3]-tiadiazolilo; un radical seleccionado del grupo que

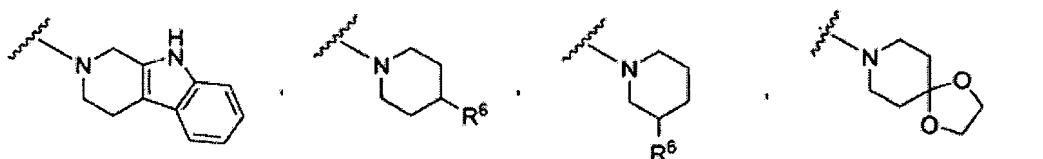
20 consiste de tienilo, furilo, piridinilo, imidazolilo, indolilo e isoindolilo que puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-, -CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂- y/o que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el

25 uno del otro del grupo que consiste de -NO₂, -OH, metilo, etilo y n-propilo o -NH-C(O)-R⁵; R² denota H; un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo y n-propilo que en cada caso está insustituido; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo que

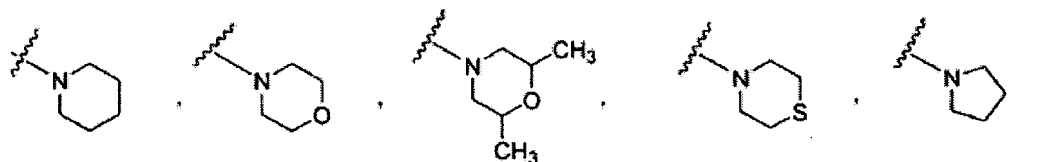
30 puede estar ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂ y/o que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente

con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, $-O-C_3H_7$ y $-O-C(CH_3)_3$; o R^1 y R^2 junto con el átomo de nitrógeno que los une un radical seleccionado del grupo que consiste de

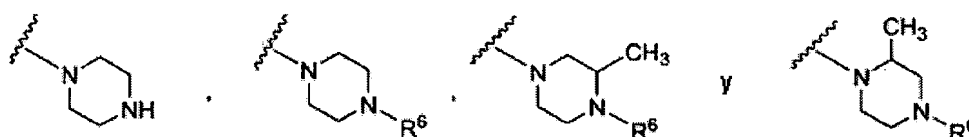
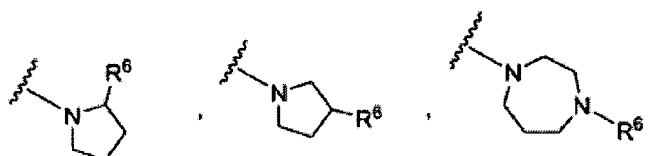
5



10



15



R^3 denota un radical de alquilo seleccionado del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, isobutilo y terc-butilo que en cada caso está insustituido; o un radical de fenilo que está ligado en cada caso mediante un grupo de $-CH_2-$ y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F , Cl , Br , metilo, etilo, n-propilo, $-O-CH_3$, $-O-C_2H_5$, y $-CF_3$;

R^4 denota fenilo que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo

que consiste de F, Cl, Br, metilo, etilo, n-propilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅; o un radical seleccionado del grupo que consiste de tienilo, furilo que en cada caso está insustituido;

R⁵ denota un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo y naftilo que está en cada caso insustituido o sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, metilo, etilo, -O-CH₃, -O-C₂H₅, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -NH-CH₃ y -NH-C₂H₅;

10 R⁶ denota -OH; -NH-C(=O)-O-R⁷; -C(=O)-O-R⁸; -C(=O)-R⁹; y R⁹ denota un radical seleccionado del grupo que consiste de (2,3)-dihidro-benzo[1.4]dioxinilo y Benzo[1.3]dioxolilo que en cada caso está insustituido; o un radical seleccionado del grupo que consiste de fenilo, tienilo, furilo que puede estar
15 ligado en cada caso mediante un grupo de -CH₂-, -CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂- y que está en cada caso insustituido o sustituido opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados independientemente el uno del otro del grupo que consiste de F, Cl, Br, metilo, etilo, -O-CH₃ y -O-C₂H₅; en cada caso
20 opcionalmente en forma de uno de sus estereoisómeros puros, en particular de sus enantiómeros o diastereómeros, de sus racematos o en forma de una mezcla de estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o diastereómeros, en una proporción arbitraria de mezcla, o en cada caso en forma de
25 las sales correspondientes.

14. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizados porque

[1] 1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido

carboxílico 4-[1,2,3]tiadiazol-4-il-bencilamida,

30 [2] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 30

4-sulfamoil-bencilamida,

- [3] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 2,4-dimetoxi-bencilamida,
- [4] 1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-piridin-2-il-etil)-amida,
- 5 [5] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(5-hidroxi-1H-indol-3-il)-etil]-amida,
- [6] (1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-(4-pirrolidin-1-il-piperidin-1-il)-metanona,
- 10 [7] 1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 4-brom-2-fluor-bencilamida,
- [8] [1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2-clor-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [9] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-15 dimetilamino-propil)-amida,
- [10] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-pirrolidin-1-il-etil)-amida,
- [11] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 4-dimetilamino-bencilamida,
- 20 [12] 1-[4-(1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-carbonil)-piperacin-1-il]-2-fenil-etanona,
- [13] 1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 2,5-difluor-bencilamida,
- [14] 1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-25 ácido carboxílico 3,5-difluor-bencilamida,
- [15] 1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-metil-ciclohexil)-amida,
- [16] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-morfolin-4-il-propil)-amida,
- 30 [17] 1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3¹ (1,3-dimetil-butil)-amida,

- [18] [4-(2,4-dimetil-fenil)-piperacin-1-il]-[4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [19] 1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico metil-(2-piridin-2-il-etil)-amida,
- 5 [20] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-ciano-etil)-metil-amida,
- [21] 1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-imidazol-1-il-propil)-amida,
- [22] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-
10 pirrol-2-ácido carboxílico (1,3-dimetil-butil)-amida,
- [23] 3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 2-etoxi-bencilamida,
- [24] (4-cicloheptil-piperacin-1-il)-(1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- 15 [25] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-dimetilamino-etil)-amida,
- [26] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (piridin-2-ilmetil)-amida,
- [27] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
20 carboxílico [2-(4-clor-fenil)-propil]-amida,
- [28] 3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3,5-difluor-bencilamida,
- [29] 2-{{[1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-amino}-ácido propiónico éster de
25 bencilo,
- [30] (1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-[4-(2-dimetilamino-etil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [31] 3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3,3-dimetil-butil)-amida,
- 30 [32] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 4-dimetilamino-bencilamida,

- [33] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (2-piridin-2-il-etil)-amida,
- [34] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico 2,3-dimetoxi-bencilamida,
- 5 [35] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-
pirrol-2-ácido carboxílico (2-tiofen-2-il-etil)-amida,
- [36] 2-([3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-amino)-3-metil-ácido butírico éster de terc-
butilo,
- 10 [37] 3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico (1,2,3,4-tetrahidro-naftalin-1-il)-
amida,
- [38] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-
pirrol-2-ácido carboxílico (2-pirrolidin-1-il-etil)-
15 amida,
- [39] {[1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-
carbonil]-metil-amino}-ácido acético éster de bencilo,
- [40] 3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico [2-(1-metil-pirrolidin-2-il)-etil]-
20 amida,
- [41] [4-(5-brom-2-etoxi-bencil)-piperacin-1-il]-(1,4-
dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- [42] (1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-il)-[4-(3-
fluor-4-metoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- 25 [43] 3-([3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-amino)-ácido propiónico éster de terc-butilo,
- [44] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
3-metoxi-bencilamida,
- [45] (1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-il)-[4-(5-
30 brom-2-etoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [46] [3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-(4-o-

- tolil-piperacin-1-il)-metanona,
- [47] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(4-etoxi-fenil)-etil]-amida,
- 5 [48] [1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-(4-hidroxi-piperidin-1-il)-metanona,
- [49] (1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-[4-(2,4,6-trimetoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [50] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-morfolin-4-il-etil)-amida,
- 10 [51] 1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(4-fluor-fenil)-etil]-amida,
- [52] [4-(2,5-dimetil-fenil)-piperacin-1-il]-[3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- 15 [53] 3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-imidazol-1-il-propil)-amida,
- [54] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(3-trifluormetil-fenil)-etil]-amida,
- 20 [55] [3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(5-metil-piracin-2-carbonil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [56] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3-fluor-5-trifluormetil-bencilamida,
- 25 [57] [3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-(4-piridin-4-il-piperacin-1-il)-metanona,
- [58] 3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-imidazol-1-il-propil)-amida,
- [59] (1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-il)-[4-(3-fluor-4-metoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- 30 [60] 1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
- 34

- carboxílico [2-(4-brom-fenil)-etil]-amida,
- [61] (4-cicloheptil-piperacin-1-il)-(3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- [62] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
- 5 [2-(4-metoxi-fenoxi)-etil]-amida,
- [63] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-dimetilamino-propil)-amida,
- [64] [1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(2-pirrolidin-1-ilmetil-pirrolidin-1-il)-
- 10 metanona,
- [65] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-dietilamino-propil)-amida,
- [66] [3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2-fluor-5-metoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- 15 [67] 3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico pentilamida,
- [68] (1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-[4-(2,5-dimetoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [69] [4-(2-dietilamino-etil)-piperacin-1-il]-[4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- 20 [70] [4-(3-clor-fenil)-piperacin-1-il]-[3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [71] [1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(4-isopropil-piperacin-1-il)-metanona,
- 25 [72] [4-(2-dimetilamino-etil)-piperacin-1-il]-[1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [73] 3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 2,4-dimetoxi-bencilamida,
- 30 [74] 1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-pirrolidin-1-il-etil)-amida,

- [75] [1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(3-fluor-4-metoxi-bencil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [76] 3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido
5 carboxílico 2,4-dimetoxi-bencilamida,
- [77] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(2-pirrolidin-1-il-etil)-amida,
- [78] 3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico [3-(2-metil-piperidin-1-il)-propil]-amida,
- 10 [79] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico ciclohexilamida,
- [80] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
4-fluor-2-trifluormetil-bencilamida,
- [81] 1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
15 carboxílico (1-naftalin-2-il-etil)-amida,
- [82] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (furan-2-ilmetil)-amida,
- [83] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(3-dimetilamino-propil)-metil-amida,
- 20 [84] [3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-(4-p-tolil-piperacin-1-il)-metanona,
- [85] 1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (tiofen-2-ilmetil)-amida,
- [86] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
25 carboxílico fenetil-amida,
- [87] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
3,5-difluor-bencilamida,
- [88] 3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico indan-1-ilamida,
- 30 [89] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
4-dimetilamino-bencilamida,

- [90] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (1-naftalin-2-ilmetil-pirrolidin-3-il)-amida,
- [91] [3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-il]-(4-metil-[1,4]diazepan-1-il)-metanona,
- [92] [1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(3-trifluormetil-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [93] [3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(4-tiofen-3-ilmetil-piperacin-1-il)-metanona,
- [94] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-benciloxi-ciclohexil)-amida,
- [95] 2-{4-[1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-n-isopropil-acetamida,
- [96] (2,6-dimetil-morfolin-4-il)-[3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [97] 3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (tiofen-2-ilmetil)-amida,
- [98] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (furan-2-ilmetil)-amida,
- [99] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-dimetilamino-propil)-amida,
- [100] 1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-oxo-tetrahidro-furan-3-il)-amida,
- [101] 3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-fenoxi-etil)-amida,
- [102] 3-(4-(1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-carbonil)piperacin-1-il)piracin-2-carbonitrilo
- [103] 2-{[3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-carbonil]-amino}-3-fenil-ácido propiónico éster

37

metílico,

- [104] 3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (2-morfolin-4-il-etil)-amida,
- [105] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
5 indan-2-ilamida,
- [106] (1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-[4-(2-fluor-
fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [107] 4-(3-clor-fenil)-piperacin-1-il]-(1,4-dimetil-3-p-
tolil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- 10 [108] [1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
il]-(4-naftalin-2-ilmetil-piperacin-1-il)-metanona,
- [109] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico p-tolilamida,
- [110] (1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-[4-(2-
15 hidroxil-etil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [111] 1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
[2-(2,5-dimetoxi-fenil)-etil]-amida,
- [112] 1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(3-imidazol-1-il-propil)-amida,
- 20 [113] 1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico [2-(3,4-dimetoxi-fenil)-etil]-metil-amida,
- [114] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (3-morfolin-4-il-propil)-amida,
- [115] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
25 carboxílico 4-fluor-2-trifluormetil-bencilamida,
- [116] 2-{[1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-amino}-3-(4-clor-fenil)-ácido propiónico
éster de etilo,
- [117] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
30 3-fluor-4-trifluormetil-bencilamida,
- [118] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido

- carboxílico (2-piridin-2-il-etil)-amida,
- [119] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico bencil-(2-hidroxi-etil)-amida,
- [120] 2-[4-(1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-carbonil)-
5 piperacin-1-il]-n-metil-n-fenil-acetamida,
- [121] [4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-
(4-fenil-piperacin-1-il)-metanona,
- [122] 1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (1-bencil-pirrolidin-3-il)-amida,
- 10 [123] [1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
il]-[4-(3-trifluormetil-fenil)-piperacin-1-il]-
metanona,
- [124] 1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico butilamida,
- 15 [125] 1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico [2-(2-fluor-fenil)-etil]-amida,
- [126] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico 3,4-dimetoxi-bencilamida,
- [127] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido
20 carboxílico (2-dietilamino-etil)-amida,
- [128] 1-{4-[3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-piperacin-1-il}-2-fenil-etanona,
- [129] 1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico 3-trifluormetoxi-bencilamida,
- 25 [130] [1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(3-
metil-piperidin-1-il)-metanona,
- [131] 1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (2-p-tolil-etil)-amida,
- [132] 1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
30 carboxílico [2-(2-metil-5-nitro-imidazol-1-il)-etil]- 39
amida,

- [133] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
2,3-dimetoxi-bencilamida,
- [134] 1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico [2-(etil-m-tolil-amino)-etil]-amida,
- 5 [135] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico (4-isopropil-fenil)-amida,
- [136] 5-clor-2-metoxi-ácido benzóico N'-[1-(4-fluor-bencil)-
3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-
hidrazida,
- 10 [137] (1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-
[1,4']bipiperidinil-1 '-il-metanona,
- [138] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(4-butil-fenil)-amida,
- [139] 1-bencil-4-metil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
15 [2-(1H-indol-3-il)-etil]-amida,
- [140] [4-(4-terc-butil-bencil)-piperacin-1-il]-[1-(4-fluor-
bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [141] [1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-
morfolin-4-il-metanona,
- 20 [142] 3-[(1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil)-amino]-ácido propiónico éster de etilo,
- [143] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(naftalín-2-ilcarbamoilmetil)-amida,
- [144] [3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2-
25 etoxi-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [145] 1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-
ácido carboxílico (4-cianometil-fenil)-amida,
- [146] 4-[1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-piperacin-1-ácido carboxílico éster de terc-
30 butilo,
- [147] (1,4-dioxa-8-aza-spiro[4.5]dec-8-il)-[1-(4-fluor-

- bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [148] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-ácido carboxílico pentilamida,
- [149] 3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [3-(metil-fenil-amino)-propil]-amida,
- 5 [150] 1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-azepan-1-il-etil)-amida,
- [151] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico ciclopentilamida,
- 10 [152] [1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [153] 3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(2-clor-fenoxi)-etil]-amida,
- [154] 1-(2,6-diclor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3,3-dimetil-butyl)-amida,
- 15 [155] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-benciloxi-ciclohexil)-amida,
- [156] [4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-tiomorfolin-4-il-metanona,
- 20 [157] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-dimetilamino-propil)-metil-amida,
- [158] [4-(2,5-dimetil-fenil)-piperacin-1-il]-[3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [159] 5-clor-2-metoxi-ácido benzóico N'-[3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-carbonil]-hidrazida,
- 25 [160] 2-(3,4-difluor-fenil)-1-{4-[1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-etanona,
- [161] 2-{4-[1-(4-fluor-bencil)-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-n-isopropil-acetamida,
- 30
- u

- [162] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [1-(3-metoxi-fenil)-etil]-amida,
- [163] 2-[(1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil)-amino]-3-(4-clor-fenil)-ácido propiónico éster metílico,
- [164] [3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(4-metil-piperacin-1-il)-metanona,
- [165] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (1-bencil-pirrolidin-3-il)-amida,
- [166] (1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il)-(4-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il-piperacin-1-il)-metanona,
- [167] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-metoxi-propil)-amida,
- [168] [3-(4-metoxi-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il]-[4-(5-trifluormetil-piridin-2-il)-piperacin-1-il]-metanona,
- [169] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-morfolin-4-il-propil)-amida,
- [170] 1,4-dimetil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(2,3-dimetoxi-fenil)-etil]-amida,
- [171] [1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-(3-metil-4-p-tolil-piperacin-1-il)-metanona,
- [172] [3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [173] 2-{4-[1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-benzonitrilo,
- [174] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (1-etil-pirrolidin-2-il metil)-amida,
- [175] 3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(2-clor-fenoxi)-etil]-amida,
- [176] 3-(4-clor-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido

u2

- carboxílico [2-(1H-indol-3-il)-etil]-amida,
- [177] 1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (naftalin-2-ilcarbamoilmetil)-amida,
- [178] 4-(1-bencil-3-furan-2-il-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil)-
5 piperacin-1-ácido carboxílico éster de bencilo,
- [179] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (1-
bencil-pirrolidin-3-il)-amida,
- [180] [3-(4-clor-fenil)-1-(2-fluor-bencil)-4-metil-1H-pirrol-
2-il]-[4-(4-trifluormetil-fenil)-piperacin-1-il]-
10 metanona,
- [181] [3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-il]-
(4-fenil-piperacin-1-il)-metanona,
- [182] 2-{4-[1-butil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-
carbonil]-piperacin-1-il}-1-pirrolidin-1-il-etanona,
- 15 [183] [1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-
(2-clor-4-fluor-benzoil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [184] (4-benzoil-piperidin-1-il)-[1-(4-metoxi-bencil)-4-
metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [185] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
20 etil-piridin-4-ilmetil-amida,
- [186] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico (2-pirrolidin-1-il-etil)-amida,
- [187] [3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-il]-
[4-(4-metil-benzoil)-piperacin-1-il]-metanona,
- 25 [188] [1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-il]-(4-
tieno[2,3-d]pirimidin-4-il-piperacin-1-il)-metanona,
- [189] 1-(1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-carbonil)-piperidin-
3-ácido carboxílico éster de etilo,
- [190] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (1-
30 fenil-etil)-amida, u3
- [191] [3-furan-2-il-1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-1H-pirrol-2-

- il]-(1,3,4,9-tetrahidro-b-carbolin-2-il)-metanona,
- [192] 1-{4-[1-bencil-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-2-(3,4-difluor-fenil)-etanona,
- 5 [193] [1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-[4-(3-fenil-propil)-piperacin-1-il]-metanona,
- [194] 1-(2-brom-bencil)-3-(4-clor-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(1H-indol-3-il)-etil]-metil-amida,
- [195] 1-(4-{4-[1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-fenil)-etanona,
- 10 [196] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 4-fluor-2-trifluormetil-bencilamida,
- [197] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (4-fenoxi-fenil)-amida,
- 15 [198] (4-hidroxi-piperidin-1-il)-[1-(4-metoxi-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [199] 4-dietilamino-ácido benzoico N'-(1-bencil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-carbonil)-hidrazida,
- [200] [3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-il]-[4-(3-clor-fenil)-piperacin-1-il]-metanona,
- 20 [201] 1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(3,4-diclor-fenil)-etil]-amida,
- [202] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(1H-indol-3-il)-etil]-amida,
- 25 [203] [1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-[4-(5-trifluormetil-piridin-2-il)-piperacin-1-il]-metanona,
- [204] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3-trifluormetoxi-bencilamida,
- 30 [205] [1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-[4-(4-metil-benzoil)-piperacin-1-il]-metanona,

- [206] [4-(3,4-diclor-fenil)-piperacin-1-il]-[1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-metanona,
- [207] 3-(4-clor-fenil)-1-etil-4-metil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 2,6-dimetoxi-bencilamida,
- 5 [208] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(3,4-dimetoxi-fenil)-etil]-amida,
- [209] 1-{4-[3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-2-(3,4-difluor-fenil)-etanona,
- 10 [210] [1-(4-fluor-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-[4-(2-metoxi-fenil)-piperidin-1-il]-metanona,
- [211] [3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-il]-tiomorfolin-4-il-metanona,
- [212] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-tiofen-2-il-etil)-amida,
- 15 [213] 4-dietilamino-ácido benzóico N'-(1-butil-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-carbonil)-hidrazida,
- [214] {1-[1-(4-fluor-bencil)-3-(4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-pirrolidin-3-il}-ácido carbámico
- 20 éster de terc-butilo,
- [215] 2-{4-[3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-1-pirrolidin-1-il-etanona,
- [216] [4-(2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxin-2-carbonil)-piperacin-1-il]-(1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- 25 [217] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3,4-dimetoxi-bencilamida,
- [218] [3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-il]-(4-piridin-2-il-piperacin-1-il)-metanona,
- [219] [4-(furan-2-carbonil)-piperacin-1-il]-[3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-il]-
- 30 metanona,

45

- [220] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (4-terc-butil-fenil)-amida,
- [221] 2-{4-[3-(4-clor-fenil)-1-isobutil-4-metil-1H-pirrol-2-carbonil]-piperacin-1-il}-benzonitrilo,
- 5 [222] (3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il)-[4-(4-trifluormetil-piridin-2-il)-piperacin-1-il]-metanona,
- [223] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico 3,5-difluor-bencilamida,
- [224] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
10 (piridin-4-ilmetil)-amida,
- [225] 2-[4-(3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-carbonil)-piperacin-1-il]-benzonitrilo,
- [226] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico metil-(2-piridin-2-il-etil)-amida,
- 15 [227] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (3-metoxi-bencil)-(tetrahidro-furan-2-ilmetil)-amida,
- [228] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (4-fenoxi-fenil)-amida,
- [229] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
20 pentilamida,
- [230] 2-(3,4-difluor-fenil)-1-[4-(3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-carbonil)-piperacin-1-il]-etanona,
- [231] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico fenilamida,
- 25 [232] [4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperacin-1-il]-(3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-il)-metanona,
- [233] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico [2-(3,4-diclor-fenil)-etil]-amida,
- [234] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
30 [2-(2-clor-fenoxi)-etil]-amida,
- [235] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico

3-metoxi-bencilamida,

[236] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-
pirrol-2-ácido carboxílico fenetil-amida,

[237] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
ciclopentilamida,

[238] 3-furan-2-il-1,4-dimetil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico
(piridin-2-ilmetil)-amida,

[239] 3-furan-2-il-4-metil-1-(4-trifluormetil-bencil)-1H-
pirrol-2-ácido carboxílico [2-(3,4-dimetoxi-fenil)-
etil]-amida,

[240] [1-(4-brom-bencil)-4-metil-3-p-tolil-1H-pirrol-2-il]-
(2,6-dimetil-morfolin-4-il)-metanona,

[241] 1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-ácido carboxílico (2-p-
tolil-etil)-amida,

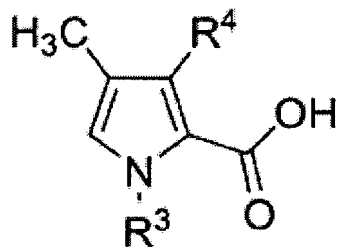
[242] (1,4-dimetil-3-fenil-1H-pirrol-2-il)-[4-(4-fluor-
fenil)-piperacin-1-il]-metanona y

[243] 4-metil-1-(4-metil-bencil)-3-p-tolil-1H-pirrol-2-ácido
carboxílico [2-(1H-indol-3-il)-etil]-metil-amida,

en cada caso opcionalmente en forma de uno de sus
estereoisómeros puros, en particular de sus enantiómeros o
diastereómeros, de sus racematos o en forma de una mezcla de
estereoisómeros, en particular de los enantiómeros y/o
diastereómeros, en una proporción arbitraria de mezcla, o en
cada caso en forma de las sales correspondientes.

15. Método para la producción de 4-metil-1H-pirrol-
2-carboxamidas 1,3-disustituidas de la fórmula general I
según una o varias de las reivindicaciones 1 a 14,
caracterizado porque al menos un compuesto de la fórmula
general II,

u7



5

II,

en que R^3 y R^4 tienen el significado según una o varias de las reivindicaciones 1 a 14 precedentes, es transformado opcionalmente en al menos un medio de reacción, preferentemente en al menos un medio de reacción seleccionado del grupo que consiste de dietileter, tetrahidrofurano, acetnitrilo, metanol, etanol, (1,2)-dicloreto, dimetilformamida, diclorometano y mezclas correspondientes, opcionalmente en presencia de al menos un agente de acoplamiento apropiado, preferentemente en presencia de al menos un agente de acoplamiento seleccionado del grupo que consiste de 1-benzotriazoliloxi-tris-(dimetilamino)-fosfonio hexafluorofosfato (BOP), diciclohexilcarbodiimida (DCC), N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida (EDCI), diisopropilcarbodiimida, 1,1'-carbonil-diimidazol (CDI), N-

20 [(dimetilamino)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridino-1-ilmetilen]-N-metilmetanaminio hexafluorofosfato N-óxido (HATU), O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio hexafluorofosfato (HBTU), O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio-tetrafluoroborato (TBTU) y 1-hidrox-7-

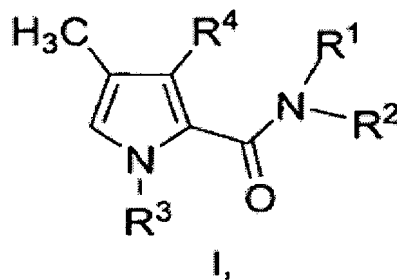
25 azabenzotriazol (HOAt), opcionalmente en presencia de al menos una base, preferentemente en presencia de al menos una base seleccionada del grupo que consiste de trietilamina, piridina, dimetilaminopiridina, N-metilmorfolina y diisopropiletilamina, preferentemente a una temperatura de -

30 70°C a 100°C, mediante transformación con al menos un compuesto de la fórmula general HNR^1R^2 , en que R^1 y R^2 tienen

48

el significado precedentemente referido, en un compuesto correspondiente de la fórmula general I, opcionalmente en forma de una sal correspondiente,

5



10

en que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado precedentemente referido, y éste es opcionalmente purificada y/o aislada.

16. Medicamento conteniendo uno o más compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 14 y opcionalmente uno o varios coadyuvantes farmacéuticos.