CSA295656
Organización y Digitalización CSA Ltda

EC

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

# Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

# PATENTE DE INVENCIÓN PCT

21. **EXPEDIENTE No.** 09-32181

54. **TÍTULO** INHIBIDOR DE LA ACTIVACIÓN DE STAT3/5.

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL**

71. **SOLICITANTE** OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.

**DOMICILIO** TOKIO, JAPON

74. **APODERADO** GERMAN CUBILLOS MENDOZA

22. **BOGOTÁ, D. C.,**

05 2009

# PETITORIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-032181- -00000-0000
Fecha 2009-03-30 10:58:03 Dep: 2020 NUEVAS CREACIONES
Tra: 11 PATENTES II Eve: 378 FASE NACIONAL
Act: 411 PRESENTACION Folios: 315

Adición

## FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTES
## PCT
## ENTRADA EN FASE NACIONAL

**1 SOLICITUD DE:**

[X] Patente de Invención [ ] Patente de Modelo de Utilidad

[X] Capítulo I [ ] Capítulo II

**2 SOLICITANTE**

Nombre: OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.
Dirección: 9, Kanda-Tsukasamachi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokio, Japón
Nacionalidad o Domicilio: Tokio, Japón
Lugar de Constitución: JAPÓN
Teléfono: Fax:
E- mail:

IDENTIFICACION
[ ] C.C. [ ] NIT
[ ] C.E. [ ] Otro
Cúal
Número

**3 REPRESENTANTE O APODERADO**

Nombre: GERMAN CUBILLOS MENDOZA
Dirección: Calle 17 No. 8 - 49 Torre A, Oficina 408 Bogotá, Colombia
Teléfono: 2432835 Fax: 2848489
E- mail: nannetti@col.net.co

IDENTIFICACIÓN
[X] C.C. [ ] NIT
[ ] C.E. [ ] Otro
Cúal
Número 19.397.479 TP 38.422 C.S.J.

**4 INVENTOR (ES)**

(72)

Nombre: ANEXO A
Dirección: ANEXO B
Nacionalidad o Domicilio: ANEXO C

**5 PCT (86)**

Solicitud Internacional No. PCT /JP2007/069645 Fecha 2007-10-02
Publicación internacional No. WO2008/044667 Fecha 2008-04-17

**6 Titulo (54)** INHIBIDOR DE LA ACTIVACIÓN DE STAT3/5

**7 Clasificación internacional (51)** C07D 317/58

**8 Prioridad**

[X] SI [ ] NO

| (33)País de Origen | (32) Fecha | (31) Número de Solicitud |
|---|---|---|
| JAPÓN | 2006-10-02 | 2006-271172 |
| | | |
| | | |
| | | |

**9 Comprobante de pago No.** 09 - 16,932 Fecha 2009-03-03
09 - 16,933 2009-03-03

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

**10 Anexos**

[X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud. **[X] comprobante de pago por reivindicaciones adicionales (42)**

[X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.

[ ] Poderes, si fuere el caso.

[ ] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.

[X] Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)

[ ] Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)

[ ] Traducción de examen preliminar internacional efectuado por la IPEA

[ ] De ser el caso, copia del contrato de acceso.

[ ] De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.

[ ] De ser el caso, certificado de depósito del material biológico

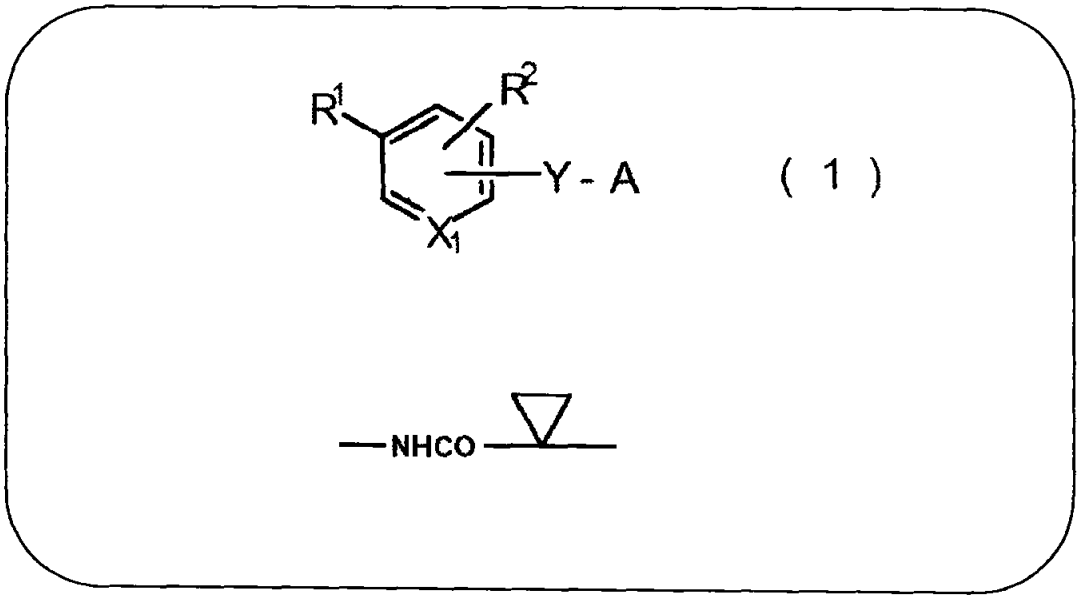
[X] Arte final 12x12.

[ ] De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.

[ ] De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.

[X] Otros **Reporte de Búsqueda Internacional y su traducción al castellano.**

**1 FIGURA CARACTERISTICA:**




**12** Solicito la concesión de la patente

**NOMBRE** GERMAN A. CUBILLOS MENDOZA

**FIRMA**

**C.C.** 19.397.479 **TP** 38.422 C.S.J.

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

# ANEXO A
# NOMBRE DE LOS INVENTORES

Inventor (es)

1. Kazuo SEKIGUCHI
2. Takashi SUZUKI
3. Yutaka OHBUCHI
4. Mitsuhiro OKUNO
5. Naoto OHI
6. Kenji OHNISHI
7. Masaaki MOTOYAMA
8. Kenji YOSHIDA
9. Takeshi KODAMA
10. Kazuhisa SUGIYAMA
11. Seiji AKAMATSU
12. Kunihiko KIYONO
13. Yasuo YANAGIHARA
14. Takashi WATANABE
15. Kazuhiko HAYASHI
16. Hideo TANAKA
17. Takumi SUMIDA

# ANEXO B
# DIRECCION DE LOS INVENTORES

1. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
2. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
3. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
4. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
5. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
6. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
7. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
8. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
9. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
10. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
11. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
12. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
13. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
14. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
15. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
16. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.
17. 11-1, Karasaki 1-chome, Otsu-shi, Shiga, Japón.

# ANEXO C
# DOMICILIO DE LOS INVENTORES

1. Otsu, Japón.
2. Otsu, Japón.
3. Otsu, Japón.
4. Otsu, Japón.
5. Otsu, Japón.
6. Otsu, Japón.
7. Otsu, Japón.
8. Otsu, Japón.
9. Otsu, Japón.
10. Otsu, Japón.
11. Otsu, Japón.
12. Otsu, Japón.
13. Otsu, Japón.
14. Otsu, Japón.
15. Otsu, Japón.
16. Otsu, Japón.
17. Otsu, Japón.

# INHIBIDOR DE LA ACTIVACIÓN DE STAT3/5.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-032181- -00000-0000
Fecha 2009-03-30 10:58:03 Dep 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 315

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 16,932
FECHA : MARZO 3 DE 2009

***** C O N S I G N A C I O N *****

| DEPOSITANTE | TIPO PAGO | BANCO | CUENTA | No. PAGO | FECHA PGO | Vr. PAGO |
|---|---|---|---|---|---|---|
| FERNANDO NANNETTI | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 98949900 | 03/03/2009 | 1,590,000.00 |

***** C O N C E P T O *****

| CANT. | RENTISTICO | CONCEPTO | | TOTAL CONCEPTO |
|---|---|---|---|---|
| 1 | 50005-01-01 SOLICITUDES | 110 | PTC SOLICITUD DE PATENTE DE INVEN | 540,000.00 |
| | | | TOTAL : $ | 540,000.00 |

SON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

# INHIBIDOR DE LA ACTIVACIÓN DE STAT3/5.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-032181- -00000-0000
Fecha 2009-03-30 10.58 03 Dep 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 315

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 16,933
FECHA : MARZO 3 DE 2009

***** C O N S I G N A C I O N *****

| DEPOSITANTE | TIPO PAGO | BANCO | CUENTA | No. PAGO | FECHA PGO | Vr. PAGO |
|---|---|---|---|---|---|---|
| FERNANDO NANNETTI | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 98949900 | 03/03/2009 | 1,590,000.00 |

***** C O N C E P T O *****

| CANT. | RENTISTICO | CONCEPTO | TOTAL CONCEPTO |
|---|---|---|---|
| 42 | 50005-01-01 SOLICITUDES | *** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL | 1,050,000.00 |
| | | TOTAL : $ | 1,050,000.00 |

SON: UN MILLON CINCUENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

En Español aparece la certificación de la EMBAJADA DE COLOMBIA en Tokio – Japón , de fecha 1 de mayo de 2003 , donde se certifica que la compañía OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD. está conformada de acuerdo a las leyes Japonesas y que se tuvo a la vista el documento original traducido al español , además que el objeto social de la mencionada compañía se encuentra descrito en el certificado que también se tuvo a la vista y hace la atestación de la conformación de la Junta Directiva .

Firma SERGIO SUAREZ ROA como Primer Secretario Encargado de Funciones Consulares .

El Jefe de la División de legalizaciones del Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia certifica que la firma del Primer Secretario Encargado de Las Funciones Consulares en Tokio , Sr. SERGIO SUAREZ ROA es la registrada y que este funcionario se encontraba desempeñando esas funciones para la época de la certificación.

12 MAR 2009
EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA, REPUBLICA DE COLOMBIA

CORRESPONDE A LA LEGALIZACION No. 216489

Luis Fernando Lopez Z.
Attorney at Law
Official Interpreter & Translator
Resolution 1029 Ministry of Justice
1997

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

u28081

CUYA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DE PROCEDENCIA

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAY 15 P 1:14

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

LAS FIRMAS CATORCE DEL CIRCULO DE BOGOTA COINCIDE CON QUE ESTA COPIA QUE HE TENIDO A LA VISTA

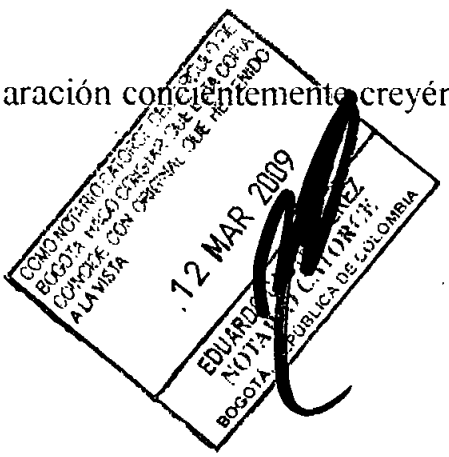
12 MAR 2009

EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA, REPUBLICA DE COLOMBIA

# DECLARACION

Yo , Katsuhisa MEREN , de No. 1359-5-1-511 , Yonamoto , Yachiyo-shi , Chiba-Ken , Japón , hago solemne y sinceramente esta declaración que yo entiendo perfectamente las lenguas Japonesa e Inglesa y que el documento anexo en versión española es una traducción parcial , verdadera y completamente fiel , hecha por mí al undécimo (11) dia de abril de 2003 , del documento anexo .

y que yo hago esta solemne declaración conciéntemente creyéndolo por ser la misma verdadera .




Aparece firma ilegible

Katsuhisa MEREN

## CERTIFICADO NOTARIAL

Registro No. 372 de 2003 suscrito y afirmado ante mí al undécimo (11) dia de abril de 2003

Luis Fernando López R.
Attorney at Law
Official Interpreter & Translator
Resolution 1029 Ministry of Justice
1992

MASAKAZU WATANABE

Notario , adjunto a la Oficina de Asuntos Legales de Tokio

No. 1 – 10 , Nihombashi , Kabuto – cho

Chuo – ku , Tokio . Japón .

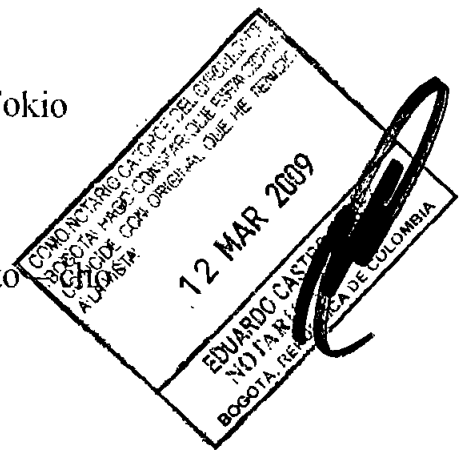
Aparece sello ovalado húmedo

Oficina de Asuntos Legales de Tokio

Oficina del Notario

No. 1 – 10 , Nihombashi , Kabuto

Chuo – ku , Tokio . Japón .




Luis Fernando López L.
Attorney at Law
Official Interpreter & Translator
Resolution 1029 Ministry of Justice
1995

EMBAJADA DE COLOMBIA
SECCION CONSULAR
TOKIO, JAPON

No. 19/2003

Tokio, 1 de mayo de 2003

El Suscrito Encargado de las Funciones Consulares en la Embajada de Colombia en Tokio,

CERTIFICA

- Que la compañía **OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.**, está constituida de acuerdo con las leyes japonesas, desde el 10 de agosto de 1964, y tiene su sede principal en la ciudad de Tokio – Japón, según consta en la certificación de inscripción y registro de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio, número de registro de personería jurídica 0199-01-012986, documento cuyo original y traducción al español tuvo a la vista.
- Que el objeto social de la compañía **OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.**, se encuentra descrito en el certificado de inscripción y registro anexo a la presente.
- Que la junta directiva de la compañía **OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.**, está constituida por las siguientes personas: YUJIRO OTSUKA, en calidad de Director; ICHIRO OTSUKA, en calidad de Director; TATSUO HIGUCHI, en calidad de director; YUKIO KOBAYASHI, en calidad de Director; AKIHIKO OTSUKA, en calidad de Director; TETSUO ARASHI, en calidad de Director; NAKAIMA OKABAYASHI, en calidad de Director; HIROMI YOSHIKAWA, en calidad de Director; TADASU TOBA, en calidad de Director, TATSUO HIGUCHI, en calidad de Director Representante; NAKAIMA OKABAYASHI, en calidad de Director Representativo; MASAHIKO KATO, en calidad de Auditor; ISAO OTSUKA, en calidad de Auditor, TETSUYA OTSUKA, en calidad de Auditor.

En constancia de lo anterior se firma en la ciudad de Tokio, Japón, a los un (1) día del mes de mayo de dos mil tres (2003)

**SERGIO SUAREZ ROA**
Primer Secretario
Encargado de Funciones Consulares

COMO NOTARIO 12 DE BOGOTÁ D.C. CERTIFICO QUE ESTA COPIA ES FIEL Y EXACTA DE SU ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
12 MAR 2009
EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA, REPUBLICA DE COLOMBIA

Fondo Rotatorio: US$ 100.oo
Impuesto de Timbre: US$ 8.oo
Total Derechos Cancelados: US$ 108.oo

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

216489

2009 MAY 19 P 12:47

SU FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

DIRECCIÓN DE LEGALIZACIONES
A.D.C.

NOTARIO CATORCE DEL
BOGOTA HAGO CONSTAR QUE
COINCIDE CON ORIGINAL QUE
A LA VISTA

12 MAR 2009

CONSULADO GENERAL

COLOMBIA
TOKIO

# D E C L A R A T I O N

I, Katsuhisa MEREN of No.1359-5-1-511, Yonamoto, Yachiyo-shi, Chiba-ken, Japan, do solemnly and sincerely declare that I well understand the Japanese language and Spanish language and that the attached Spanish version is partial, true and faithful translation made by me this 11th day of April, 2003 of the attached document.

And I made this solemn declaration conscientiously believing the same to be true.

Katsuhisa MEREN

COMO NOTARIO CATORCE DEL CIRCULO DE BOGOTA ... ESTA COPIA ... ORIGINAL QUE HE TENIDO A VISTA
12 MAR 2009
EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA REPUBLICA DE COLOMBIA

NOTARIAL CERTIFICATE

Registration No. 372 of 2003
Subscribed and affirmed before me,
on this 11th day of April, 2003.

Tokyo Legal Affairs Bureau
NOTARY OFFICE
No.1-10 Nihombashi Kabuto-cho
Chuo-ku Tokyo Japan

Masakazu Watanabe

Masakazu Watanabe
Notary
No.1-10, Nihombashi Kabuto-cho,
Chuo-ku, Tokyo, Japan

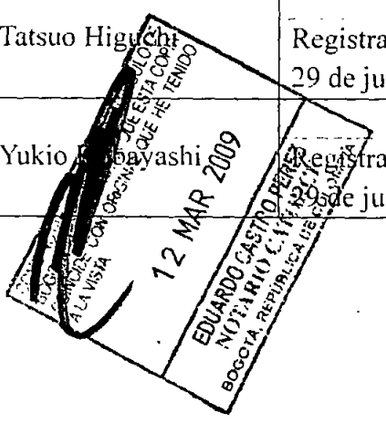
Certificado de todos asuntos actuales

Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.

2-9, Kanda-Tsukasacho, Chiyoda-ku, Tokio, Japón

Número de corporación, etc. 0199-01-012986

| | | |
|---|---|---|
| Razón social | Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd. | |
| Oficina principal | 2-9, Kanda-Tsukasacho, Chiyoda-ku, Tokio, Japón | |
| Método de anuncio oficial | publicar en el boletín official | |
| Fecha de fundación de la corporación | 10 de agosto de 1964 | |
| Objetos | 1. Producción, venta, exportación e importación de productos farmacéuticos, productos farmacéuticos para animales, cuasi-drogas, examen clínico, equipo médico, insecticida agrícola, cosméticos, bebida alcohólica, productos alimenticios, y artículos de uso diario y en general<br>2. Todos los negocios relacionados a los negoscios arriba mencionados | |
| Número total de las acciones que se emiten | 48,000,000 | |
| Número total, clases y respectivos números de de las acciones emitidas | Número total de las acciones emitidas: 12,000,000 | |
| Capital | 6,000,000,000 yenes | |
| Estipulación sobre la restricción de la transferencia de las acciones | La transferencia de las acciones requiere la aprovación de la junta directiva. | |
| Asuntos sobre directores | Director Yujiro Otsuka | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Ichiro Otsuka | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Tatsuo Higuchi | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Yukio [illegible]bayashi | Registrado 29 de junio de 2001 |



| | | |
|---|---|---|
| | Director Akihiko Otsuka | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Tetsuo Arashi | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Nakaima Okabayashi | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Hiromi Yoshikawa | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Tadasu Toba | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Representativo Tatsuo Higuchi | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Director Representativo Nakaima Okabayashi | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Auditor Masahiko Kato | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Auditor Isao Otsuka | Registrado 29 de junio de 2001 |
| | Auditor Tatsuya Otsuka | Registrado 29 de junio de 2001 |

Va omitido lo demás.

Este documento es el que certifica que los asuntos arriba mencionados son el total rigistrado en el rigistro y válido actualmente.

14 de enero de 2003

Sadatoshi Kataoka
Oficial encargado del registro
Oficina De Asuntos Legales De Tokio

# 現在事項全部証明書

015

東京都千代田区神田司町二丁目９番地
大塚製薬株式会社
会社法人等番号　０１９９－０１－０１２９８６

| | | |
|---|---|---|
| 商　号 | 大塚製薬株式会社 | |
| 本　店 | 東京都千代田区神田司町二丁目９番地 | |
| 公告をする方法 | 官報に掲載して之を為すものとする | |
| 会社成立の年月日 | 昭和３９年８月１０日 | |
| 目　的 | １　医薬品、動物用医薬品、医薬部外品、臨床検査、医療用具、農薬、化粧品、酒類、食料品、日用品雑貨の製造、販売、輸出並びに輸入<br>２　上記に附帯関連する一切の事業 | |
| 発行する株式の総数 | ４８００万株 | |
| 発行済株式の総数並びに種類及び数 | 発行済株式の総数<br>１２００万株 | |
| 資本の額 | 金６０億円 | |
| 株式の譲渡制限に関する規定 | 株式の譲渡には取締役会の承認を要する | |
| 役員に関する事項 | 取締役　大　塚　雄　二　郎 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　大　塚　一　郎 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　樋　口　達　夫 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　小　林　幸　雄 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　大　塚　明　彦 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |

整理番号　エ７５４８７６　　＊　下線のあるものは抹消事項があることを示す。　　1／3

Shinichi HACHIYARA
For the Minister for Foreign Affairs

千代田区神田司町二丁目９番地
製薬株式会社
法人等番号　０１９９－０１－０１２９８６

| | | |
|---|---|---|
| | 取締役　嵐　哲夫 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　岡林中今 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　吉川博巳 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 取締役　鳥羽董 | 平成１４年　６月２６日就任<br>平成１４年　７月　２日登記 |
| | 東京都世田谷区松原三丁目２５番１９号<br>代表取締役　樋口達夫 | 平成１３年　６月２７日重任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 東京都文京区根津一丁目１６番９号<br>代表取締役　岡林中今 | 平成１４年　６月２６日就任<br>平成１４年　７月　２日登記 |
| | 監査役　加藤昌彦 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 監査役　大塚公 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| | 監査役　大塚達也 | 平成１３年　６月２７日就任<br>平成１３年　６月２９日登記 |
| 支店 | 1<br>札幌市中央区南一条西七丁目１２番地 | |
| | 2<br>名古屋市中区丸ノ内三丁目１３番２１号 | |
| | 3<br>福岡市博多区奈良屋町１３番１３号 | |
| | 5<br>熊本市本山三丁目３番８９号 | |
| | 6<br>仙台市青葉区上杉五丁目３番３６号 | 平成１１年　７月　８日移転<br>平成１１年　７月　８日登記 |

は、

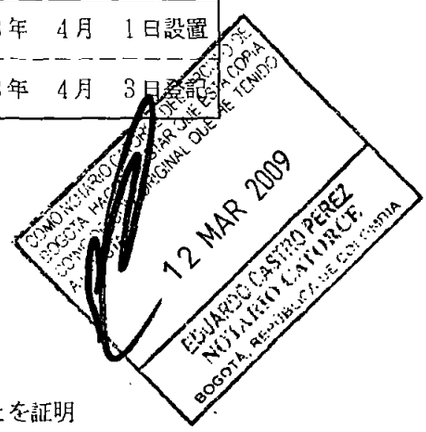
整理番号　エ７５４８７６　　＊　下線のあるものは抹消事項であることを示す。　　2／3

Shinichi HACHIWARA
For the Minister for Foreign Affairs

千代田区神田司町二丁目９番地
薬株式会社
法人等番号　０１９９－０１－０１２９８６

| | | |
|---|---|---|
| | ７<br>千葉市中央区祐光一丁目５番２号 | |
| | ８<br>静岡市西中原一丁目２番１１号 | |
| | ９<br>大阪市北区中之島六丁目２番４０号 | |
| | １０<br>京都市下京区烏丸通仏光寺下ル大政所町６８０番地の１ | |
| | １１<br>広島市西区楠木町一丁目１４番３１号 | |
| | １２<br>神戸市中央区磯辺通三丁目１番７号 | 平成１１年　６月１４日移転<br>平成１１年　６月１５日登記 |
| | １３<br>埼玉県上尾市大字瓦葺字梶ヶ谷戸９２９番地１ | |
| | １４<br>横浜市西区北幸二丁目１５番１号 | |
| | １５<br>東京都千代田区神田司町二丁目９番地 | |
| | １６<br>新潟県新潟市近江２６０番地１の２ | |
| | １７<br>石川県金沢市諸江町中丁１６０－１ | 平成１３年　４月　１日設置<br>平成１３年　４月　３日登記 |

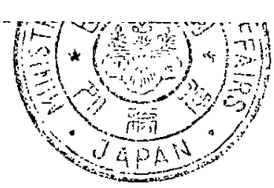
は、




これは登記簿に記録されている現に効力を有する事項の全部であることを証明した書面である。

平成１５年　１月１４日
東京法務局
登記官　片　岡　貞　敏

整理番号　エ７５４８７６　　＊　下線のあるものは抹消事項であることを示す。　3／3




Shinichi HAGIWARA
For the Minister for Foreign Affairs

平成１５年登簿第　372　号

# 認　　証

018

嘱託人　　目　　連　　勝　　久　　は、

本公証人の面前において別添文書に署名した。

よって、これを認証する。

平成１５年　4　月　11　日、本公証人役場において

東京都中央区日本橋兜町１番10号
東京法務局所属
公証人　渡部正和
Notary　Masakazu Watanabe
Masakazu Watanabe

## 証　　明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、真実のものであることを証明する。

平成１５年　4　月　11　日

東京法務局長　寶金敏明

12 MAR 2009
EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA REPUBLICA DE COLOMBIA

## APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: JAPAN
   This public document
2. has been signed by　Masakazu Watanabe
3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau
4. bears the seal/stamp of

Certified

5. at Tokyo　　6. APR. 11. 2003
7. by the Ministry of Foreign Affairs
8. 03- №012631
9. Seal/stamp:　　10. Signature

MINISTRY OF FOREIGN AFFAIRS · JAPAN ·

Shinichi HACHIYA
For the Minister for Foreign Affairs

# APOSTILLE

( Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961 )

1. País : **JAPÓN**

   Este documento público

2. ha sido firmado por

   **Masakazu Watanabe**

3. actuando en calidad de **Notario de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio**

4. lleva el sello / estampador de

## CERTIFICADO

5. en Tokio

6. abril 11 de 2003

7. Por **El Ministro de Relaciones Exteriores**

8. 03 – No. **012631**

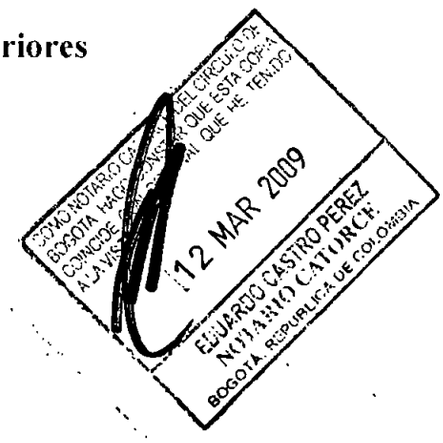
9. Sello / estampador

10. Firma

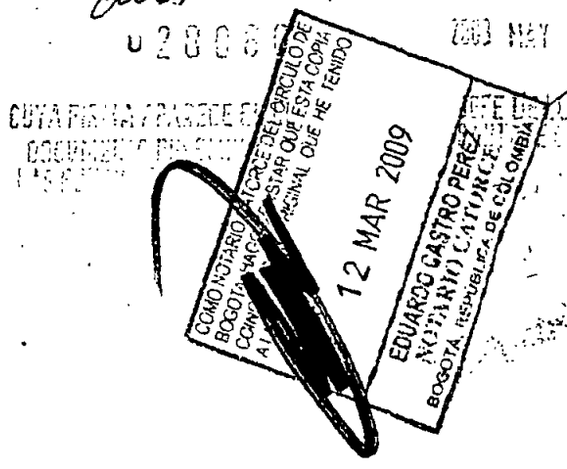
    Aparece firma ilegible

    Shinichi HAGIWARA

    Por el Ministerio de Relaciones Exteriores




Luis Fernando Pérez Z.
Attorney at Law
Official Interpreter & Translator
Resolution: 1029 Ministry of Justice


12 MAR 2009
EDUARDO CASTRO PEREZ
NOTARIO CATORCE
BOGOTA, REPUBLICA DE COLOMBIA

# INHIBIDOR DE LA ACTIVACION DE STAT3/5

## Descripción de la Invención

La presente invención se refiere a un inhibidor de la activación de STAT3/5.

Una familia de proteínas de transductores de señales y activadores de transcripción (STAT, por sus siglas en inglés) es una de una proteína de enlace al ADN y juega un papel en la transmisión de información y la activación de transcripción. En la actualidad, se sabe que la familia de STAT tiene 6 diferentes miembros (STAT 1, STAT 2, STAT 3, STAT 4, STAT 5 Y STAT 6) y diversas iso-formas (STAT 1α, STAT 1β, STAT 3α, STAT 3β, STAT 5a y STAT 5b). La actividad de STAT es regulada por medio de la estimulación de diversas citocinas y mitógeno. Cuando una citocina se enlaza a sus receptores, se activa la proteína tirosina cinasa Janus (JAK) que está asociada con los receptores.

El STAT 3 tiene un dominio de SH2 (homología al dominio 2 de la proteína src) que es capaz de reconocer la estructura de una tirosina fosforilada específicamente. Se considera que el STAT 3 reconoce específicamente la tirosina fosforilada dentro de una región de células gp130 y es transportado en gp 130 y la tirosina es fosforilada por JAK. El STAT 3 que tienen tirosina fosforilada forma un dímero de

STAT 3 (homodímero) por vía de su dominio de SH2 o un dímero (heterodímero) de STAT 3 y STAT1, el cual entra en un núcleo y reconoce una secuencia de ADN especifica y se enlaza a ésta. De este modo, se sabe que el STAT3 regula la transcripción de muchos genes.

Estos papeles *in-vivo* de STAT3/5 se reportan en varios documentos.

Por ejemplo, el Documento que no es Patente 1 describe las relaciones entre la activación de las vías de señalización de STAT 3 e IL-6 y entre IL-6 y enfermedades crónicas tales como la enfermedad de Alzheimer, reumatismo, enfermedad de Crohn y anemia y una enfermedad asociada con el cáncer tal como caquexia.

Además, el Documento que no es Patente 2 describe la relación entre la activación de STAT 3 y el Virus de Hepatitis C, el Documento que no es Patente 3 describe la relación entre la activación de STAT 3 y psoriasis, individualmente. Además, el Documento que no es Patente 2 establece las relaciones entre el STAT 3 y una enfermedad inflamatoria y una enfermedad autoinmunitaria y el Documento que no es Patente 4 establece las relaciones entre la activación de STAT 3 y la obesidad, diabetes, infertilidad y desregulación térmica, etcétera, individualmente. Los Documentos que no son Patente 5 y 6, etcétera describen que el STAT5 es un factor crítico en la activación de MC

(mástocitos) inducida por IgE y enfermedades inflamatorias y autoinmunes y describen los papeles de STAT5 en alergias, inflamaciones, hiperprolactinemia y tumores malignos.

Por otra parte, se sabe que un compuesto aromático que tiene una acción inhibitoria de la producción de colágeno está presente (Documento de Patente 1). Sin embargo, todavía no se ha sabido que el compuesto aromático descrito en el Documento de Patente 1 tiene una acción inhibitoria de la activación de STAT3/5.

[Documento de Patente 1] WO2006/014012

[Documento de Patente 2] US2001/0029250

[Documento que no es Patente 1] J. Gerontology; MEDICAL SCIENCES 2006, Vol.61A, No.6, 575-584

[Documento que no es Patente 2] J. Exp. Med. Vol.196, No.5, 2002, 641-653

[Documento que no es Patente 3] Nature Medicine Vol.11, No.1, 2005, 43-49

[Documento que no es Patente 4] PNAS 30 de Marzo de 2004, vol.101, no. 13, 4661-4666

[Documento que no es Patente 5] J. Immunology, 2006, 177: 3421-3426,

[Documento que no es Patente 6] Ann. Rheum. Dis. 2004; 63: 67-71.

Un objetivo de la presente invención es

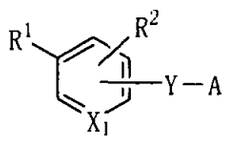
proporcionar un inhibidor de la activación de STAT3/5.

Los presentes inventores estudiaron repetidamente un compuesto aromático descrito en el Documento de Patente 1. Como resultado, descubrieron que el compuesto tiene una acción inhibitoria de la activación de STAT3/5. La presente invención se ha logrado con base en este descubrimiento.

Por lo tanto, la presente invención proporciona inhibidores de la activación de STAT3/5 representados por los siguientes artículos A a C.

Artículo A: Un inhibidor de la activación de STAT3/5 que contiene un compuesto aromático (más adelante referido algunas veces simplemente como un compuesto aromático (1)) representado por la fórmula general o una sal del mismo como un ingrediente activo:

[Fórmula 1]



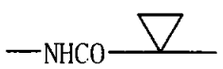

(1)

en donde $X_1$ representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CH=,

$R_1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

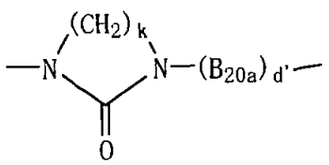
Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$, un grupo $-B-N(R^8)-$, un grupo $-B_0-O-$, un grupo

[Fórmula 2]



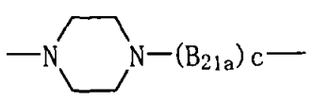
un grupo -CO-, un grupo-CH(OH)-, un grupo $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$, un grupo -N=CH-, un grupo $-N(R^{10a})-SO_2-(B_{22a})e-$, un grupo alquenileno inferior, un grupo $-NHCO-B_1-$, un grupo $-NHCO-B_2-(W)u-$, un grupo $-B_0-O-B_{19a}-$, un grupo

[Fórmula 3]



, un grupo

[Fórmula 4]



, un grupo $-SO_2-N(R^{10b})-$, un grupo -S-, un grupo alquinileno inferior, un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{8d})-$ o un grupo $-CO-NH-B_{18a}-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior o un grupo fenil-alquilo inferior,

B representa un grupo -CO- o un grupo alquileno inferior,

$B_0$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_1$ representa un grupo alquenileno inferior que puede tener un grupo fenilo como un sustituyente,

$B_2$ representa un grupo alquileno inferior que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste

de un grupo alcoxi inferior y un grupo fenilo,

$R^{9a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{9b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{10a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{22a}$ representa un grupo alquileno inferior o un grupo alquenileno inferior,

e representa 0 o 1,

$B_{18a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{20a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{21a}$ representa un grupo alquileno inferior,

k representa 2 o 3,

c representa 0 o 1,

d' representa 0 o 1,

$R^{10b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{8d}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

W representa un átomo de oxígeno, un grupo -NH- o un átomo de azufre,

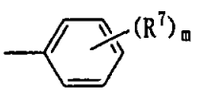
u representa 0 o 1,

$R^{6}$ representa un grupo heterocíclico, saturado o insaturado,

monocíclico, dicíclico o tricíclico de 5 a 15 miembros que tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo oxo; un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfonilo inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido por un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno en el anillo de fenilo; un grupo alquiltio inferior, un grupo pirrolilo, un grupo benzoilo; un grupo alcanoilo inferior; grupo alcoxicarbonilo inferior; y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo heterocíclico), un grupo adamantilo, un grupo naftilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo de naftaleno), un grupo alquilo que puede tener un grupo alcoxi inferior como un sustituyente, un grupo cicloalquilo que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo

inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, en el anillo de cicloalquilo, un grupo alquenilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno y átomo de halógeno, como un sustituyente, en el anillo de fenilo), un grupo alquilo inferior sustituido por un átomo de halógeno, grupo cicloalquil-alquilo inferior o un grupo

[Fórmula 5]



$R^7$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo fenilo, un grupo carboxi, un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenoxi, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquilendioxi inferior, un grupo amino que puede tener, como un sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo cicloalquilo, un grupo ciano, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un

grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo aminosulfonilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoiloxi inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior o un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado que tienen de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener un grupo oxo en el anillo heterocíclico),

m representa un número entero de 1 a 5 (cuando m representa 2 a 5, dos a cinco $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

$R^2$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior,

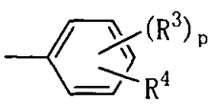
Y representa un grupo -O-, un grupo $-N(R^5)-$, un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)-, un grupo alquileno inferior, un grupo -S(O)n- o un grupo -C(=N-OH)-,

$R^5$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo,

n representa 0, 1 o 2,

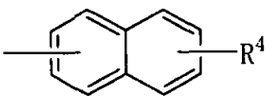
A representa un grupo

[Fórmula 6]



o un grupo

[Fórmula 7]



p representa 1 o 2,

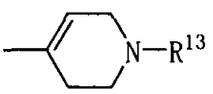
$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo $-CONR^{11}R^{12}$ o un grupo ciano,

en donde $R^{11}$ y $R^{12}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo o un grupo fenilo y $R^{11}$ y $R^{12}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros,

$R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,3-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior, un grupo pirazolil-alquilo inferior, un grupo pirimidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-iliden-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de 1,2,4-

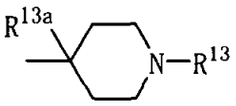
oxadiazol, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo

[Fórmula 8]



, un grupo

[Fórmula 9]



o un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$,

$R^{13}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, un grupo carboxi-alquilo inferior, un grupo benzoilo, un grupo alcanoilo inferior sustituido por morfolino, un grupo piperazinil-carbonil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo

alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo alquilo inferior sustituido por morfolinocarbonilo o un grupo imidazolil-alcanoilo inferior,

$R^{13a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo hidroxilo,

T representa un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$, un grupo $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$, un grupo $-B_4-CO-$, un grupo $-Q-B_5-CO-$, un grupo $-B_6-N(R^{19})-B_7-CO-$, un grupo $-CO-B_8-$, un grupo $-CH(OH)-B_9-$, un grupo $-CO-B_{10}-CO-$, un grupo $-CH(OH)-B_{11}-CO-$, un grupo $-CO-$, un grupo $-SO_2-$ o un grupo $-B_{23a}-CO-CO-$,

en donde $R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilcarbonilo, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquenilo inferior, un grupo alcanoilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente o un grupo alquilsulfonilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{18}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_4$ representa un grupo alquenileno inferior o un grupo

alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

Q representa un átomo de oxígeno o un grupo -S(O)n- (en donde n es igual al descrito anteriormente),

$B_5$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_6$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{19}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcanoilo inferior,

$B_7$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_8$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_9$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{10}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{11}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{23a}$ representa un grupo alquileno inferior,

l representa 0 o 1,

$R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

$R^{15}$ representa (2) un grupo alquilo sustituido por un grupo hidroxilo, (3) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (4) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (5) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo

de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo amino-alcoxi inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo hidroxilo; un grupo fenil-alquilo inferior; un grupo alquinilo inferior; un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un sustituyente; un grupo alquiltio inferior; un grupo cicloalquilo; un grupo feniltio; un grupo adamantilo; un grupo anilino que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo piperazinilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperazina; un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alcanoilamino inferior; un grupo ciano; y un grupo fenoxi, (6) un grupo fenoxi, (7) un grupo fenil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior, (8) un grupo fenil-alquilo inferior que tiene un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (10) un grupo alquilo inferior sustituido por alcoxicarbonilo inferior, (11) un grupo alquilo inferior sustituido por carboxi, (12) un grupo amino que puede tener

un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (13) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrahidroquinolina, (14) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (15) un grupo piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (16) un grupo piridil-alquilo inferior, (17) un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (18) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, (19) un grupo imidazolilo, (20) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (21) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonilo, (22) un grupo piperidinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior y un grupo furil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (23) un grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, (24) un grupo piperidinilo que puede ser

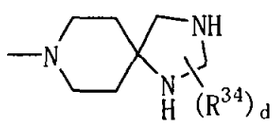
sustituido, en el anillo de piperidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo furil-alquilo inferior, (25) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 10]



, (26) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 11]



(27) un grupo $-CO-B_{20}-N(R^{36})R^{37}$, (26a) un grupo pirrolidinil-alquilo inferior, (27a) un grupo morfolino-alquilo inferior, (28a) un grupo fenil-alquenilo inferior, (29a) un grupo anilinocarbonil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (30a) un grupo indolilo, (31a) un grupo piperazinil-alquilo inferior que puede tener, como un sustituyente en el anillo de piperazina, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como

un sustituyente en el anillo de fenilo, (32a) un grupo amidino-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (33a) un grupo fluorenilo, (34a) un grupo carbazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de carbazol, (35a) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (36a) un grupo oxalilo sustituido por piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenil-alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo) y un grupo piridil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de piperazina o (37a) un grupo alquilo inferior sustituido por ciano,

$R^{34}$ representa un grupo oxo o un grupo fenilo,

d representa un número entero de 0 a 3,

$B_{20}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{36}$ y $R^{37}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior en el anillo de fenilo, pueden estar presentes como un

sustituyente(s),

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado; o un grupo

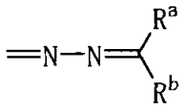
[Fórmula 12]



en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes los cuales se seleccionan del grupo que consiste de (28) un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo, el cual tiene de 1 a 2 grupos fenilo que pueden ser sustituidos por 1 a 3 grupos en el anillo de fenilo, seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior y que puede tener un grupo piridilo en el grupo alquilo inferior, (29) un grupo carbamoilo, (30) un grupo piridil-alquilo inferior que puede

tener, como un sustituyente(s) en el anillo de piridina, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (31) un grupo pirrolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de pirrol, (32) un grupo benzoxazolil-alquilo inferior, (33) un grupo benzotiazolil-alquilo inferior, (34) un grupo furil-alquilo inferior, (35) un grupo benzoilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un sustituyente, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo tiazolidiniliden-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina y un grupo alquilendioxi inferior, (36) un grupo pirimidinilo, (37) un grupo pirazinilo, (38) un grupo piridilo, (39) un grupo alcoxicarbonilo inferior, (40) un grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de tiazolidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo oxo y un grupo

[Fórmula 13]



(en donde $R^a$ y $R^b$ cada uno representa un grupo alquilo inferior), (41) un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un átomo de halógeno como un sustituyente, (42) un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (43) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior y un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo ciano, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo benzoilo que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo y un grupo hidroxilo, (44) un grupo fenilo que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (45) un grupo naftil-alquilo inferior, (46) un grupo fenoxi que puede

ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (47) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (48) un grupo fenil-alcoxi inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (49) un grupo $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$, (50) un grupo $-(CO)o-B_{13}-N(R^{22})R^{23}$, (51) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede ser sustituido, en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno, por 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (52) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (53) un grupo piperidinilo que puede ser sustituido, en el anillo de piperidina, por 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (54) un grupo quinolil-alquilo inferior, (55) un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de tetrazol, (56) un grupo tiazolil-alquilo inferior que puede

tener un grupo fenilo como un sustituyente en el anillo de tiazol, (57) un grupo benzoil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, (58) un grupo piperidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (59) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo como un sustituyente(s) en el anillo de imidazol, (60) un grupo bencimidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de bencimidazol, (61) un grupo piridil-alcoxi inferior, (62) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (63) un grupo 1,3,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de 1,3,4-oxadiazol, (64) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (65) un grupo tetrahidropiranilo, (66) un grupo tienil-alquilo inferior, (67) un grupo pirimidinilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, (68) un grupo hidroxilo, (69) un grupo carboxi, (70) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, (71) un grupo alcoxi inferior alcoxi inferior, (72) un grupo benzoiloxi, (73) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alcoxi inferior, (74) un grupo

carboxi-alcoxi inferior, (75) un grupo fenoxi-alcanoilo inferior, (76) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (77) un grupo fenilsulfonilo, (78) un grupo imidazolil-alcanoilo inferior, (79) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (80) un grupo piridilcarbonilo, (81) un grupo imidazolilcarbonilo, (82) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, (83) un grupo carboxi-alquilo inferior, (84) un grupo $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$, (85) un grupo $-N(R^{28})-CO-B_{16}-N(R^{29})R^{30}$, (86) un grupo $-N(R^{31})-B_{17}-CO-N(R^{32})R^{33}$, (87) un grupo benzoxazolilo, (88a) un grupo benzotienilo, (89a) un grupo oxo y (90a) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina,

$B_{12}$ representa un grupo alquileno inferior,

t representa 0 o 1,

$R^{20}$ y $R^{21}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo amino que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior como un sustituyente; un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo alquilo inferior; un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo

ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquiltio inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo cicloalquil-alquilo inferior; un grupo pirrolidinil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior que pueden tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo fenilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede tener de 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno; un grupo naftil-alquilo inferior; un grupo piridil-alquilo inferior; un grupo quinolil-alquilo inferior; un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo

inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrazol; un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior; un grupo tetrahidrofuril-alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el grupo alquilo inferior; un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo nitro como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo fenil-alcanoilo inferior; un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo imidazolil-alcanoilo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior; un grupo piridilo; o un grupo carboxi-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo; y $R^{20}$ y $R^{21}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi

inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

o representa 0 o 1,

$B_{13}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{22}$ y $R^{23}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo fenilo o $R^{22}$ y $R^{23}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

$B_{15}$ representa un grupo alquileno inferior,

s representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{27}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo imidazolil-alquilo inferior y $R^{26}$ y $R^{27}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual

se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente, pueden estar presentes en el anillo de fenilo, como un sustituyente(s)),

$R^{28}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{16}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{29}$ y $R^{30}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo,

$R^{31}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{17}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{32}$ y $R^{33}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo

de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo).

Sin embargo, el compuesto mencionado anteriormente o una sal del mismo satisface los siguientes requerimientos (i) a (v):

(i) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, entonces $R_3$ representa un átomo de hidrógeno;

(ii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1, T representa -CO- y $R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, $R^{15}$ representa el grupo (24);

(iii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1 y T representa $-N(R^{17})-B_3-CO-$, $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado, en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos de (28) están presentes como un sustituyente(s);

(iv) cuando $X_1$ representa un átomo de nitrógeno y l representa 0 o cuando $X_1$ representa un átomo de nitrógeno, l representa 1 y T representa -CO- o $-SO_2$, $R^{15}$ no es un grupo (5), (7), (19) o (20); y

(v) cuando $R^6$ representa un grupo cicloalquilo que puede tener en el anillo de cicloalquilo, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, $R^4$ representa un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$ (en donde T y l son iguales a los descritos anteriormente y $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 10 miembros; o $R^{14}$ y $R^{15}$ forman un grupo

[Fórmula 14]



.

Artículo B: El inhibidor de la activación de STAT3 de acuerdo con el artículo A para prevenir o tratar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT3.

Artículo C: El inhibidor de la activación de STAT3 de acuerdo con el artículo B, en el cual el síntoma o

enfermedad asociado con la activación de STAT3 es una enfermedad autoinmunitaria, diabetes, infección, enfermedad central, enfermedad asociada con el cáncer o psoriasis.

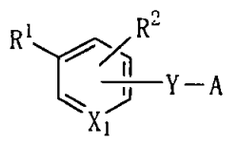
La presente invención proporciona además un método para prevenir o tratar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT3 al administrar, a un paciente, una dosis efectiva de un compuesto aromático (1) o una sal del mismo de acuerdo con el artículo A.

La presente invención proporciona además el uso de un compuesto (1) o una sal del mismo de acuerdo con el artículo A para producir el inhibidor de la activación de STAT3/5.

El compuesto aromático (1) o una sal del mismo que sirve como un ingrediente activo del inhibidor de la activación de STAT3/5 de la presente invención es un compuesto aromático (1) o una sal del mismo representado por el artículo 1 posterior y preferiblemente los compuestos aromáticos o sales de los mismos representados por los artículos 2 a 48.

Artículo 1: Un compuesto aromático o una sal del mismo representado por la fórmula general:

[Fórmula 15]



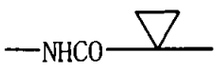
(1)

en donde $X_1$ representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CH=,

$R^1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

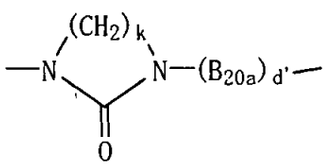
Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$, un grupo $-B-N(R^8)-$, un grupo $-B_0-O-$, un grupo

[Fórmula 16]



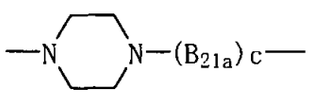
un grupo -CO-, un grupo-CH(OH)-, un grupo $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$, un grupo -N=CH-, un grupo $-N(R^{10a})-SO_2-(B^{22a})e-$, un grupo alquenileno inferior, un grupo $-NHCO-B_1-$, un grupo $-NHCO-B_2-(W)u-$, un grupo $-BO-O-B_{19a}-$, un grupo

[Fórmula 17]



, un grupo

[Fórmula 18]



, un grupo $-SO_2-N(R^{10b})-$, un grupo -S-, un grupo alquinileno inferior, un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{8d})-$ o un grupo $-CO-NH-B_{18a}-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como un

sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior o un grupo fenil-alquilo inferior,

B representa un grupo -CO- o un grupo alquileno inferior,

$B_0$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_1$ representa un grupo alquenileno inferior que puede tener un grupo fenilo como un sustituyente,

$B_2$ representa un grupo alquileno inferior que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un grupo fenilo,

$R^{9a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{9b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{10a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{22a}$ representa un grupo alquileno inferior o un grupo alquenileno inferior,

e representa 0 o 1,

$B_{18a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{20a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{21a}$ representa un grupo alquileno inferior,

k representa 2 o 3,

c representa 0 o 1,

d' representa 0 o 1,

$R^{10b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{8d}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

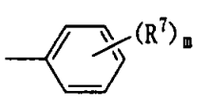
W representa un átomo de oxígeno, un grupo -NH- o un átomo de azufre,

u representa 0 o 1,

$R^6$ representa un grupo heterocíclico de 5 a 15 miembros, monocíclico, dicíclico o tricíclico, saturado o insaturado que tienen de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste en un grupo oxo; un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfonilo inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido por un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno en el anillo de fenilo; un grupo alquiltio inferior, un grupo pirrolilo, un grupo benzoilo; un grupo alcanoilo inferior; grupo alcoxicarbonilo inferior; y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo heterocíclico), un grupo adamantilo, un grupo naftilo (que puede tener de 1 a 3

grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo naftaleno), un grupo alquilo que puede tener un grupo alcoxi inferior como un sustituyente, un grupo cicloalquilo que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, en el anillo de cicloalquilo, un grupo alquenilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno y un átomo de halógeno, como un sustituyente, en el anillo de fenilo), un grupo alquilo inferior sustituido por un átomo de halógeno, grupo cicloalquil-alquilo inferior o un grupo

[Fórmula 19]



$R^7$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo fenilo, un grupo carboxi, un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno, un

grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenoxi, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquilendioxi inferior, un grupo amino que puede tener, como un sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo cicloalquilo, un grupo ciano, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo aminosulfonilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoiloxi inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior o un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o insaturado que tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener un grupo oxo en el anillo heterocíclico),

m representa un número entero de 1 a 5 (cuando m representa 2 a 5, dos a cinco $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

$R^2$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior,

Y representa un grupo -O-, un grupo $-N(R^5)-$, un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)-, un grupo alquileno inferior, un grupo -S(O)n- o un grupo -C(=N-OH)-,

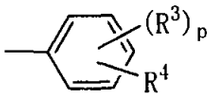
$R^5$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo, un

grupo fenil-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo,

n representa 0, 1 o 2,

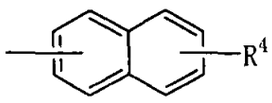
A representa un grupo

[Fórmula 20]



o un grupo

[Fórmula 21]



p representa 1 o 2,

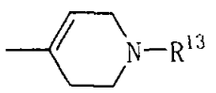
$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo $-CONR^{11}R^{12}$ o un grupo ciano,

en donde $R^{11}$ y $R^{12}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo o un grupo fenilo y $R^{11}$ y $R^{12}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros,

$R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,3-triazolil-

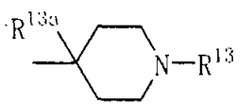
alquilo inferior, un grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior, un grupo pirazolil-alquilo inferior, un grupo pirimidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilideno alquilo inferior, un grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de 1,2,4-oxadiazol, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo

[Fórmula 22]



, un grupo

[Fórmula 23]



o un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$,

$R^{13}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un

sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, un grupo carboxi-alquilo inferior, un grupo benzoilo, un grupo alcanoilo inferior sustituido por morfolino, un grupo piperazinil-carbonil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo alquilo inferior sustituido por morfolinocarbonilo o un grupo imidazolil-alcanoilo inferior,

$R^{13a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo hidroxilo,

T representa un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$, un grupo $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$, un grupo $-B_4-CO-$, un grupo $-Q-B_5-CO-$, un grupo $-B_6-N(R^{19})-B_7-CO-$, un grupo $-CO-B_8-$, un grupo $-CH(OH)-B_9-$, un grupo $-CO-B_{10}-CO-$, un grupo $-CH(OH)-B_{11}-CO-$, un grupo $-CO-$, un grupo $-SO_2-$ o un grupo $-B_{23a}-CO-CO-$,

en donde $R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilcarbonilo, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halogeno como un sustituyente, un grupo alquenilo inferior, un grupo alcanoilo inferior sustituido

por amino que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente o un grupo alquilsulfonilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{18}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_4$ representa un grupo alquenileno inferior o un grupo alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

Q representa un átomo de oxígeno o un grupo -S(O)n- (en donde n es igual al descrito anteriormente),

$B_5$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_6$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{19}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcanoilo inferior,

$B_7$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_8$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_9$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{10}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{11}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{13a}$ representa un grupo alquileno inferior,

l representa 0 o 1,

$R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

$R^{15}$ representa (2) un grupo alquilo sustituido por un grupo

hidroxilo, (3) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (4) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (5) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo amino-alcoxi inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo hidroxilo; un grupo fenil-alquilo inferior; un grupo alquinilo inferior; un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un sustituyente; un grupo alquiltio inferior; un grupo cicloalquilo; un grupo feniltio; un grupo adamantilo; un grupo anilino que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo piperazinilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperazina; un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alcanoilamino inferior; un grupo ciano; y un grupo fenoxi, (6) un grupo fenoxi, (7) un grupo fenil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno,

un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior, (8) un grupo fenil-alquilo inferior que tiene un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (10) un grupo alquilo inferior sustituido por alcoxicarbonilo inferior, (11) un grupo alquilo inferior sustituido por carboxi, (12) un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (13) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrahidroquinolina, (14) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (15) un grupo piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (16) un grupo piridil-alquilo inferior, (17) un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (18) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, (19) un grupo imidazolilo, (20) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (21) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonilo, (22) un grupo piperidinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del

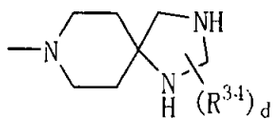
grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior y un grupo furil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (23) un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, (24) un grupo piperidinilo que puede ser sustituido, en el anillo de piperidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo furil-alquilo inferior, (25) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 24]



, (26) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 25]



(27) un grupo $-CO-B_{20}-N(R^{36})R^{37}$, (26a) un grupo pirrolidinil-alquilo inferior, (27a) un grupo morfolino-alquilo inferior, (28a) un grupo fenil-alquenilo inferior, (29a) un grupo anilinocarbonil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo,

(30a) un grupo indolilo, (31a) un grupo piperazinil-alquilo inferior que puede tener, como un sustituyente en el anillo de piperazina, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (32a) un grupo amidino-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (33a) un grupo fluorenilo, (34a) un grupo carbazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de carbazol, (35a) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (36a) un grupo oxalilo sustituido por piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenil-alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo) y un grupo piridil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de piperazina o (37a) un grupo alquilo inferior sustituido por ciano,

$R^{34}$, representa un grupo oxo o un grupo fenilo,

d representa un número entero de 0 a 3,

$B_{20}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{36}$ y $R^{37}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo

de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterocíclico de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior en el anillo de fenilo, puede estar presente como un sustituyente(s),

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado; o un grupo

[Fórmula 26]

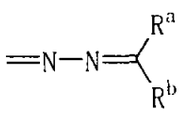


en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes los cuales se seleccionan del grupo que consiste de (28) un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo, el cual tiene de 1 a 2 grupos fenilo que pueden ser sustituidos por 1 a 3 grupos en el anillo de fenilo, seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi

inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior y que puede tener un grupo piridilo en el grupo alquilo inferior, (29) un grupo carbamoilo, (30) un grupo piridil-alquilo inferior que puede tener, como un sustituyente(s) en el anillo de piridina, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (31) un grupo pirrolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de pirrol, (32) un grupo benzoxazolil-alquilo inferior, (33) un grupo benzotiazolil-alquilo inferior, (34) un grupo furil-alquilo inferior, (35) un grupo benzoilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un sustituyente, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo tiazolidiniliden-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina y un grupo alquilendioxi inferior, (36) un grupo pirimidinilo, (37) un grupo pirazinilo, (38) un grupo

piridilo, (39) un grupo alcoxicarbonilo inferior, (40) un grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de tiazolidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo oxo y un grupo

[Fórmula 27]



(en donde $R^a$ y $R^b$ cada uno representa un grupo alquilo inferior), (41) un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un átomo de halógeno como un sustituyente, (42) un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (43) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior y un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo ciano, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo benzoilo que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo

inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo y un grupo hidroxilo, (44) un grupo fenilo que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (45) un grupo naftil-alquilo inferior, (46) un grupo fenoxi que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (47) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (48) un grupo fenil-alcoxi inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (49) un grupo $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$, (50) un grupo $-(CO)o-B_{13}-N(R^{22})R^{23}$, (51) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede ser sustituido, en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno, por 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (52) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (53) un grupo piperidinilo que puede ser sustituido, en el anillo de piperidina, por 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (54) un grupo

quinolil-alquilo inferior, (55) un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de tetrazol, (56) un grupo tiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo fenilo como un sustituyente en el anillo de tiazol, (57) un grupo benzoil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, (58) un grupo piperidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (59) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo como un sustituyente(s) en el anillo de imidazol, (60) un grupo bencimidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de bencimidazol, (61) un grupo piridil-alcoxi inferior, (62) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (63) un grupo 1,3,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de 1,3,4-oxadiazol, (64) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (65) un grupo tetrahidropiranilo, (66) un grupo tienil-alquilo inferior, (67) un grupo pirimidinilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un

sustituyente en el anillo de pirimidina, (68) un grupo hidroxilo, (69) un grupo carboxi, (70) un grupo alcoxi inferior alquilo inferior, (71) un grupo alcoxi inferior alcoxi-inferior, (72) un grupo benzoiloxi, (73) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alcoxi inferior, (74) un grupo carboxi-alcoxi inferior, (75) un grupo fenoxi-alcanoilo inferior, (76) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (77) un grupo fenilsulfonilo, (78) un grupo imidazolil-alcanoilo inferior, (79) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (80) un grupo piridilcarbonilo, (81) un grupo imidazolilcarbonilo, (82) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, (83) un grupo carboxi-alquilo inferior, (84) un grupo $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$, (85) un grupo $-N(R^{28})-CO-B_{16}-N(R^{29})R^{30}$, (86) un grupo $-N(R^{31})-B_{17}-CO-N(R^{32})R^{33}$, (87) un grupo benzoxazolilo, (88a) un grupo benzotienilo, (89a) un grupo oxo y (90a) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina,

$B_{12}$ representa un grupo alquileno inferior,

t representa 0 o 1,

$R^{20}$ y $R^{21}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo amino que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior como un sustituyente; un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi

inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo alquilo inferior; un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos fenilo que pueden ser sustituidos, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquiltio inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo cicloalquil-alquilo inferior; un grupo pirrolidinil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior que pueden tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo fenilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede tener de 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de

1,2,3,4-tetrahidronaftaleno; un grupo naftil-alquilo inferior; un grupo piridil-alquilo inferior; un grupo quinolil-alquilo inferior; un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrazol; un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior; un grupo tetrahidrofuril-alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el grupo alquilo inferior; un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo nitro como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo fenil-alcanoilo inferior; un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo imidazolil-alcanoilo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior; un grupo piridilo; o un grupo carboxi-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo; y $R^{20}$ y $R^{21}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo

fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

o representa 0 o 1,

$B_{13}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{22}$ y $R^{23}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo fenilo o $R^{22}$ y $R^{23}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

$B_{15}$ representa un grupo alquileno inferior,

s representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{27}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo imidazolil-alquilo inferior y $R^{26}$ y $R^{27}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente, pueden estar presentes en el anillo de fenilo, como un sustituyente(s)),

$R^{28}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{16}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{29}$ y $R^{30}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterociclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo,

$R^{31}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{17}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{32}$ y $R^{33}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo).

Sin embargo, el compuesto mencionado anteriormente o una sal del mismo satisface los siguientes requerimientos (i) a (v):

(i) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, entonces $R_3$ representa un átomo de hidrógeno;

(ii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1, T representa -CO- y $R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, $R^{15}$ representa el grupo (24);

(iii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1 y T representa $-N(R^{17})-B_3-CO-$, $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno

al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado, en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos de (28) están presentes como un sustituyente(s);

(iv) cuando $X_1$ representa un átomo de nitrógeno y l representa 0 o cuando $X_1$ representa un átomo de nitrógeno, l representa 1 y T representa -CO- o $-SO_2$, $R^{15}$ no es un grupo (5), (7), (19) o (20); y

(v) cuando $R^6$ representa un grupo cicloalquilo que puede tener en el anillo cicloalquilo, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, $R^4$ representa un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$ (en donde T y l son iguales a los descritos anteriormente y $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el atomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 10 miembros; o $R^{14}$ y $R^{15}$ forman un grupo

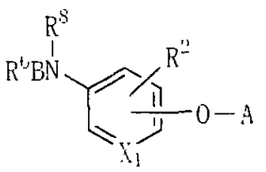
[Fórmula 28]



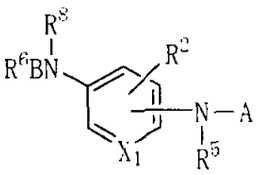
Artículo 2: El compuesto aromático o una sal del

mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-1) a (1-7) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

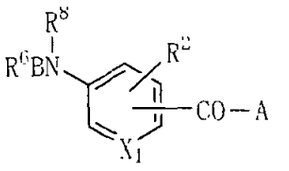
[Fórmula 29]



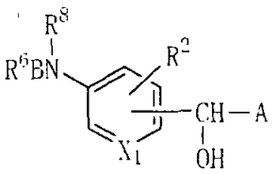
(1-1)



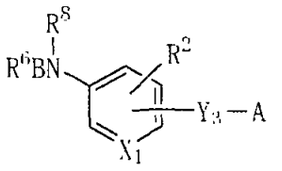
(1-2)



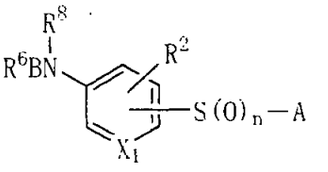
(1-3)



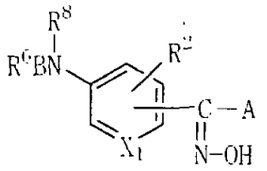
(1-4)



(1-5)



(1-6)

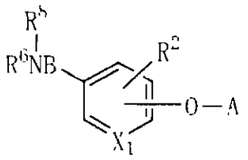


(1-7)

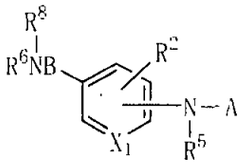
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 3: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-8) a (1-14) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

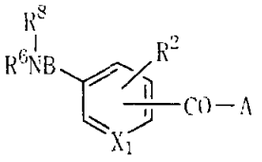
[Fórmula 30]



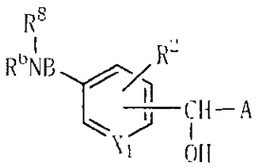
(1-8)



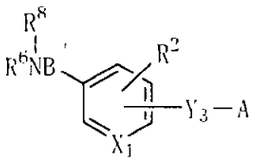
(1-9)



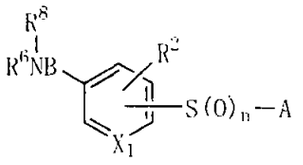
(1-10)



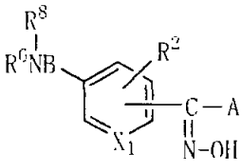
(1-11)



(1-12)



(1-13)

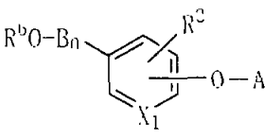


(1-14)

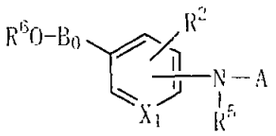
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 4: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-15) a (1-21) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

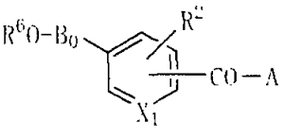
[Fórmula 31]



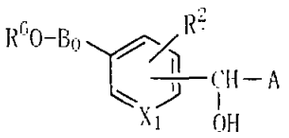
(1-15)



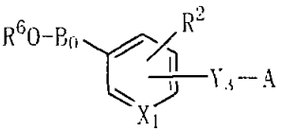
(1-16)



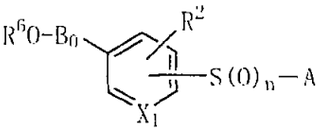
(1-17)



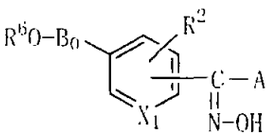
(1-18)



(1-19)



(1-20)

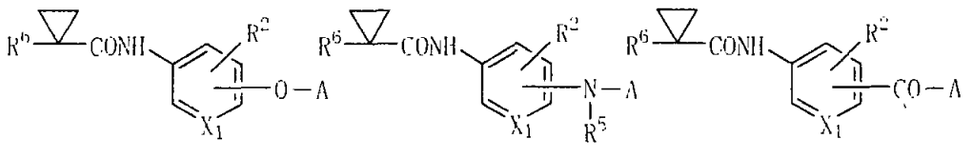


(1-21)

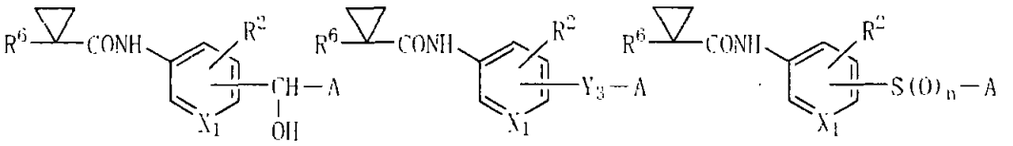
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 5: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-22) a (1-28) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

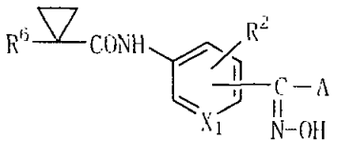
[Fórmula 32]



(1-22) (1-23) (1-24)



(1-25) (1-26) (1-27)

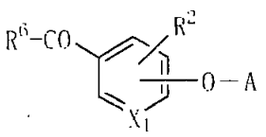


(1-28)

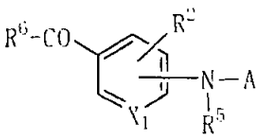
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 6: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-29) a (1-35) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

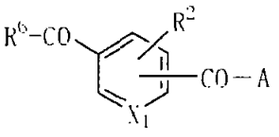
[Fórmula 33]



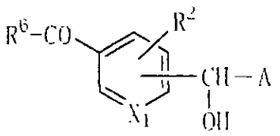
(1-29)



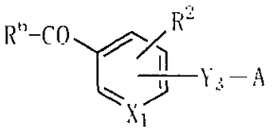
(1-30)



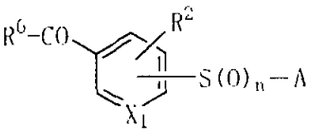
(1-31)



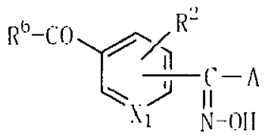
(1-32)



(1-33)



(1-34)

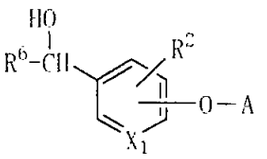


(1-35)

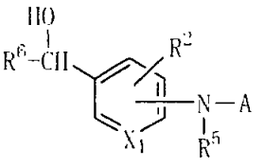
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 7: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-36) a (1-42) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

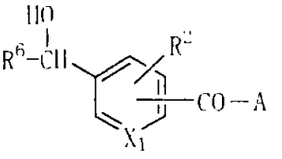
[Fórmula 34]



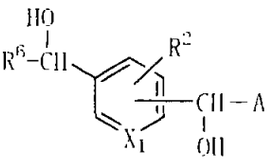
(1-36)



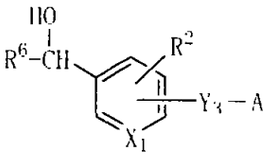
(1-37)



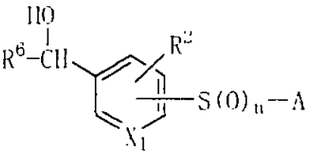
(1-38)



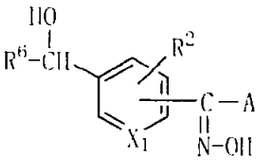
(1-39)



(1-40)



(1-41)

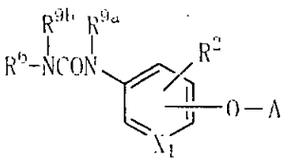


(1-42)

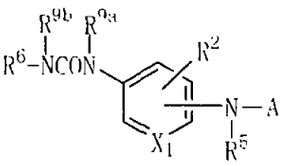
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 8: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-43) a (1-49) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

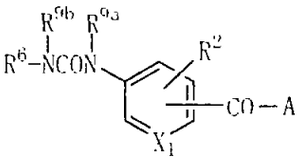
[Fórmula 35]



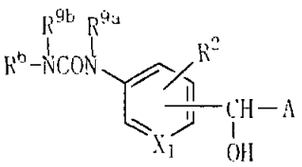
(1-43)



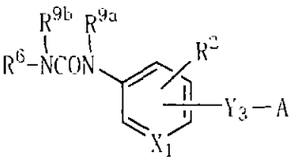
(1-44)



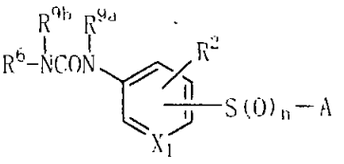
(1-45)



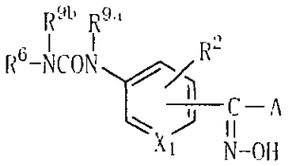
(1-46)



(1-47)



(1-48)

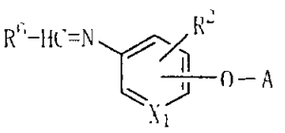


(1-49)

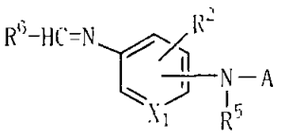
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 9: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-50) a (1-56) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

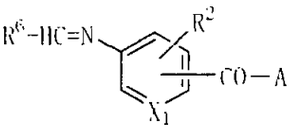
[Fórmula 36]



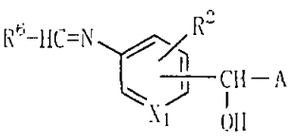
(1-50)



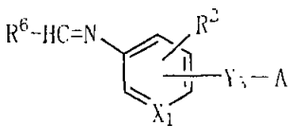
(1-51)



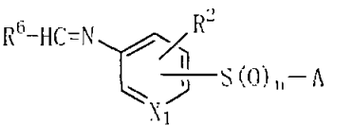
(1-52)



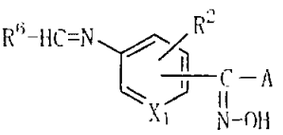
(1-53)



(1-54)



(1-55)

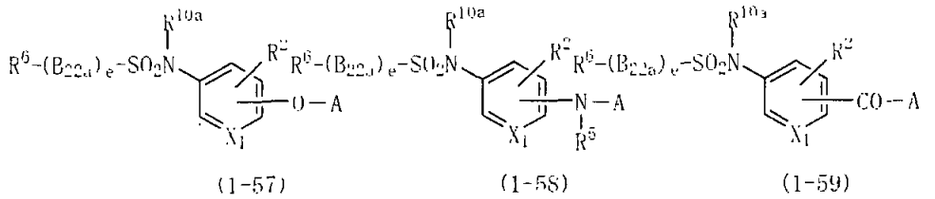


(1-56)

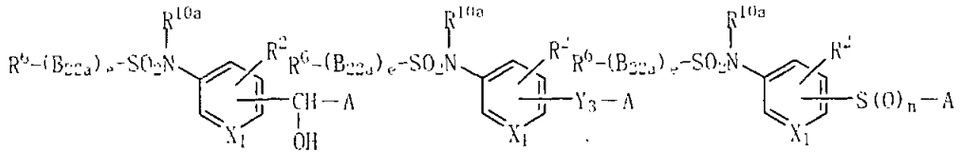
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 10: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-57) a (1-63) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

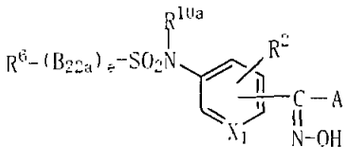
[Fórmula 37]



(1-57) (1-58) (1-59)



(1-60) (1-61) (1-62)

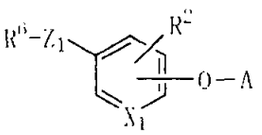


(1-63)

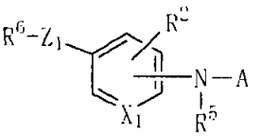
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 11: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-64) a (1-70) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

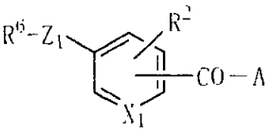
[Fórmula 38]



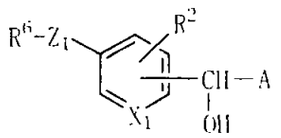
(1-64)



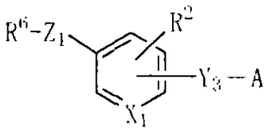
(1-65)



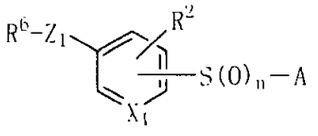
(1-66)



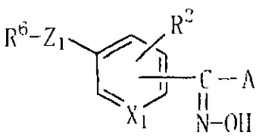
(1-67)



(1-68)



(1-69)

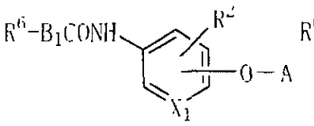


(1-70)

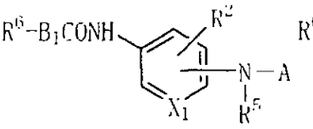
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_1$ representa un grupo alquenileno inferior.

Articulo 12: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-71) a (1-77) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

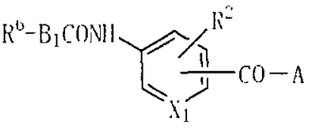
[Fórmula 39]



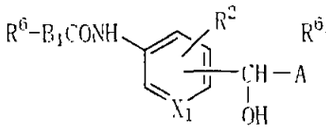
(1-71)



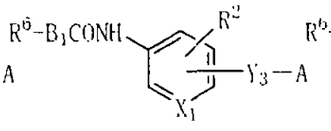
(1-72)



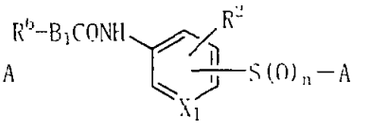
(1-73)



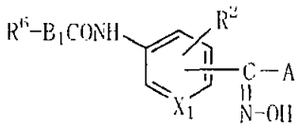
(1-74)



(1-75)



(1-76)

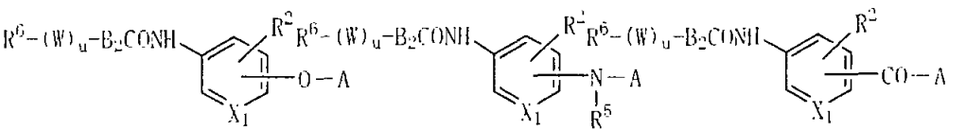


(1-77)

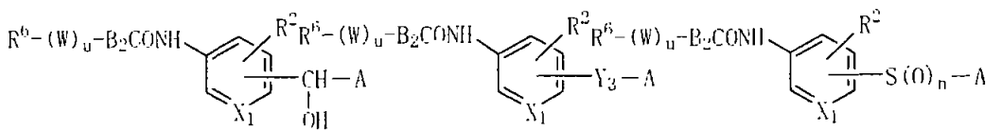
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 13: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-78) a (1-84) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

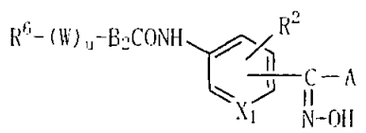
[Fórmula 40]



(1-78) (1-79) (1-80)



(1-81) (1-82) (1-83)

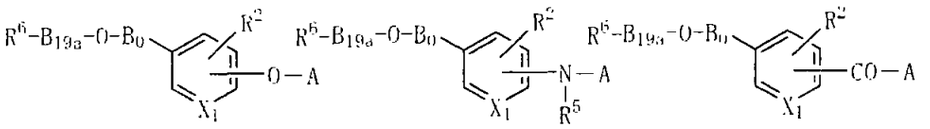


(1-84)

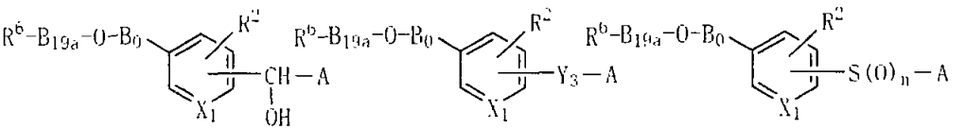
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 14: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-85) a (1-91) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

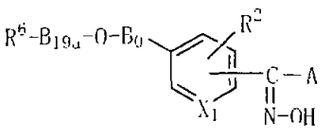
[Fórmula 41]



(1-85) (1-86) (1-87)



(1-88) (1-89) (1-90)

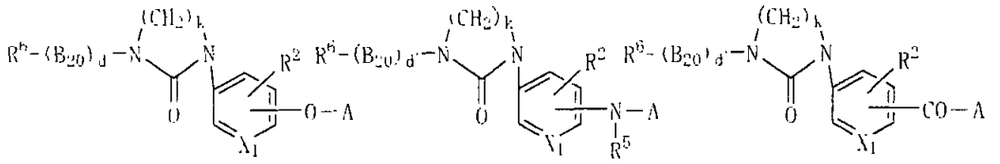


(1-91)

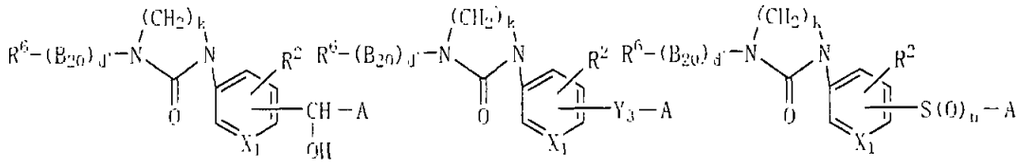
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 15: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-92) a (1-98) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

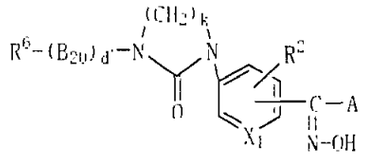
[Fórmula 42]



(1-92) (1-93) (1-94)



(1-95) (1-96) (1-97)

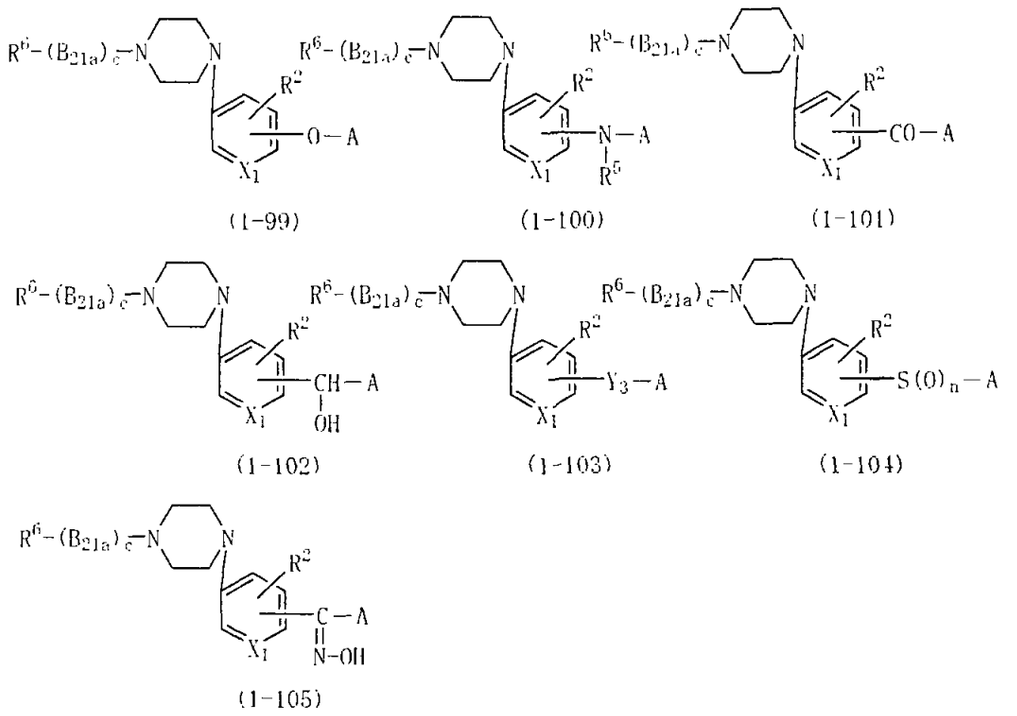


(1-98)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 16: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-99) a (1-105) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

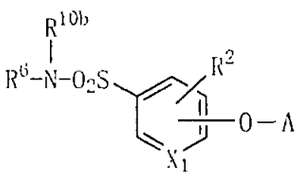
[Fórmula 43]



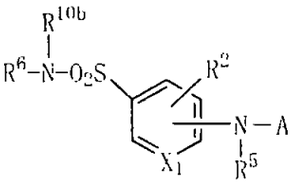
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 17: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-106) a (1-112) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

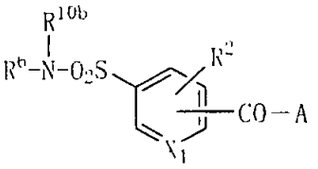
[Fórmula 44]



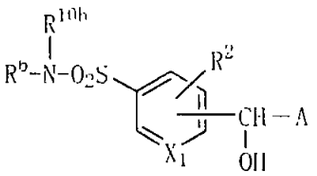
(1-106)



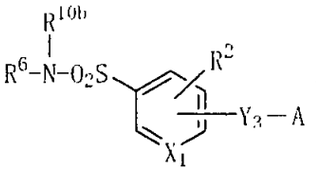
(1-107)



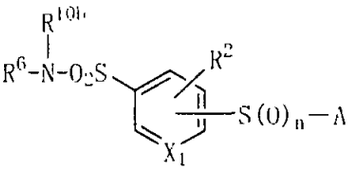
(1-108)



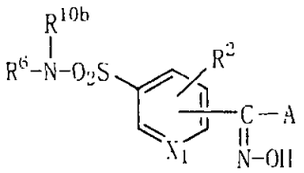
(1-109)



(1-110)



(1-111)

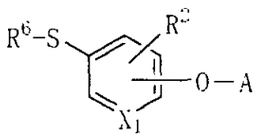


(1-112)

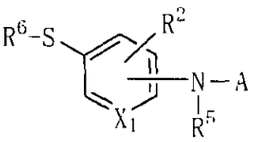
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 18: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-113) a (1-119) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

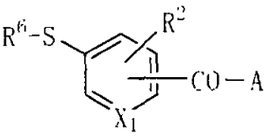
[Fórmula 45]



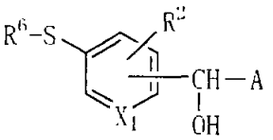
(1-113)



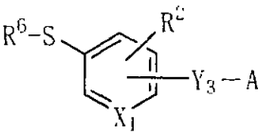
(1-114)



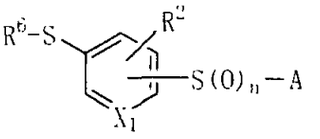
(1-115)



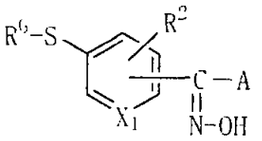
(1-116)



(1-117)



(1-118)

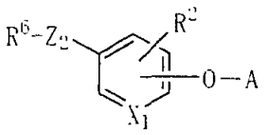


(1-119)

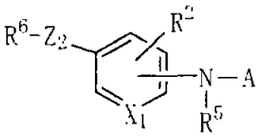
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Artículo 19: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-120) a (1-126) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

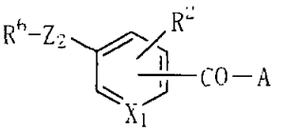
[Fórmula 46]



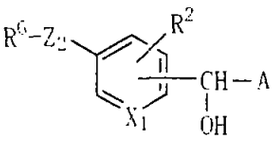
(1-120)



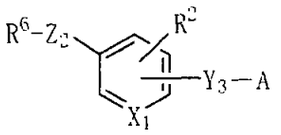
(1-121)



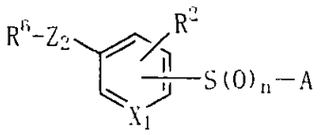
(1-122)



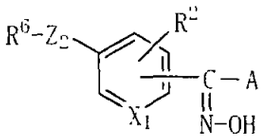
(1-123)



(1-124)



(1-125)

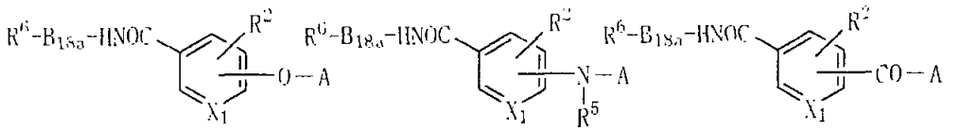


(1-126)

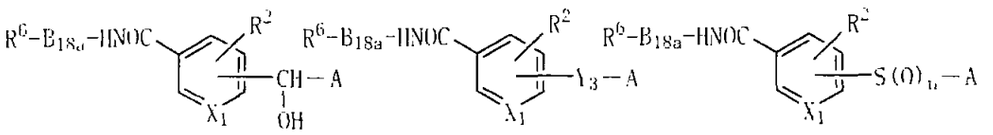
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_2$ representa un grupo alquinileno inferior.

Artículo 20: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-127) a (1-133) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

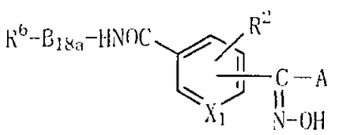
[Fórmula 47]



(1-127) (1-128) (1-129)



(1-130) (1-131) (1-132)

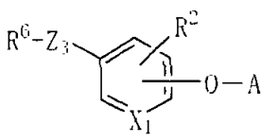


(1-133)

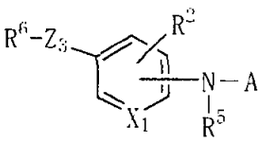
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

Articulo 21: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-134) a (1-140) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

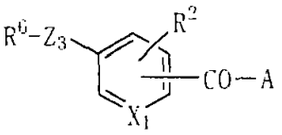
[Fórmula 48]



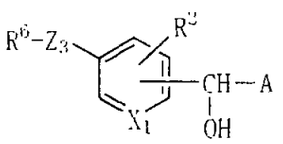
(1-134)



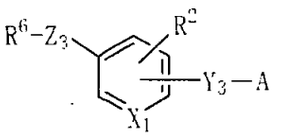
(1-135)



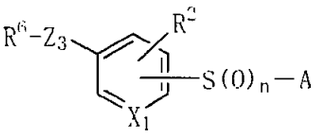
(1-136)



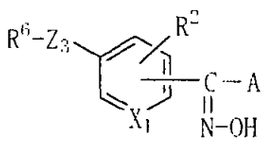
(1-137)



(1-138)



(1-139)



(1-140)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_3$ representa un grupo alquileno inferior o un grupo $-N(R^{6a})-$.

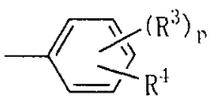
Artículo 22: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde Y es un grupo -O-.

Artículo 23: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde Y es un grupo $-N(R^5)-$.

Artículo 24: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde Y es un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)-, un grupo alquileno inferior, un grupo -S(O)n- o un grupo -C(=N-OH)-.

Artículo 25: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde A es un grupo

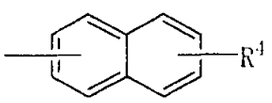
[Fórmula 49]



.

Artículo 26: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde A es un grupo

[Fórmula 50]

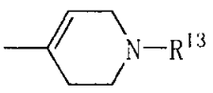


.

Artículo 27: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,3-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior, un grupo pirazolil-alquilo inferior, un grupo pirimidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-iliden-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de 1,2,4-

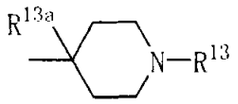
oxadiazol, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo

[Fórmula 51]



o un grupo

[Fórmula 52]



.

Artículo 28: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, representado por la fórmula general (1) en donde $R^4$ representa un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$ (T, $R^{14}$ y $R^{15}$ son los mismos como se define anteriormente) y l representa 0.

Artículo 29: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$ y l es 1.

Artículo 30: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$, l es 1 y T es un grupo $-N(R^{17})-B_2-CO-$.

Artículo 31: El compuesto aromatico o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en

donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$.

Artículo 32: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_4-CO-$.

Artículo 33: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-Q-B_5-CO-$.

Artículo 34: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_6-N(R^{19})-B_7-$.

Artículo 35: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CO-B_8-$.

Artículo 36: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CH(OH)-B_9-$.

Artículo 37: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo

-CO-$B_{10}$-CO-.

Artículo 38: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo -CH(OH)-$B_{11}$-CO-.

Artículo 39: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo -CO-.

Artículo 40: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-SO_2-$.

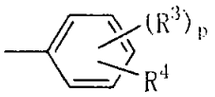
Artículo 41: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_{23a}$-CO-CO-.

Artículo 42: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con cualquiera de los artículos 1 a 21, en donde $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo alquileno inferior.

Artículo 43: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-1), (1-2), (1-8),

(1-9), (1-15), (1-16), (1-29), (1-30), (1-43), (1-44), (1-57), (1-58), (1-64) y (1-65) o una sal del mismo como un ingrediente activo, en donde Y es un grupo -O- o un grupo -$N(R^5)$-, A es un grupo

[Fórmula 53]



, y

$R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$.

Artículo 44: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 43, en donde l es 1 y T es un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$.

Artículo 45: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 43, en donde l es 1 y T es un grupo $-B_4-CO-$.

Artículo 46: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 43, en donde l es 1 y T es un grupo -CO-.

Artículo 47: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 43, en donde l es 0.

Artículo 48: El compuesto aromático o una sal del mismo de acuerdo con el artículo 1, comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-

(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}fenoxi)-piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-3,4-diclorobencensulfonamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperazin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenil)metilamino]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-

1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-{6-[4-(4-bencilpiperazin-1-carbonil)fenoxi]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[4-(4-bencilpiperazin-1-carbonil)fenoxi]piridin-3-il}-3,4-diclorobenzamida, N-[6-({4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenil}metilamino)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}fenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, 1-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-3-(3,4-diclorofenil)-1-etilurea, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-carbonil)piperidin-1-il]fenoxi}piridin-

3-il)-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenil)metilamino]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-(6-{4-[(2-{4-[4-(4-fluorobenzoil)fenil]piperazin-1-il}-2-oxoetil)metilamino]-2-metoxifenoxi}piridin-3-il)-4-trifluorometilbenzamida, 2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-N-{3-metil-4-[5-(4-trifluorometilfenoximetil)piridin-2-iloxi]fenil}-2-oxoacetamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-2-fluoro-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida y éster etílico del ácido 4-(3-{3-metil-4-[5-(4-trifluorometilbenzoilamino)piridin-2-iloxi]fenil}-2-oxohexahidropirimidin-1-il)benzoico,
o una sal del mismo como un ingrediente activo.

El compuesto aromático o una sal del mismo que sirve como el ingrediente activo de la presente invención es un compuesto conocido y descrito en el Documento de Patente 1.

Los ejemplos específicos de los grupos individuales mostrados en la fórmula general (1) son los siguientes.

Los ejemplos del grupo alquenileno inferior incluyen grupos alquenileno lineales o ramificados que tienen

de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles tales como los grupos vinileno, 1-propenileno, 1-metil-1-propenileno, 2-metil-1-propenileno, 2-propenileno, 2-butenileno, 1-butenileno, 3-butenileno, 2-pentenileno, 1-pentenileno, 3-pentenileno, 4-pentenileno, 1,3-butadienileno, 1,3-pentadienileno, 2-penten-4-inileno, 2-hexenileno, 1-hexenileno, 5-hexenileno, 3-hexenileno, 4-hexenileno, 3,3-dimetil-1-propenileno, 2-etil-1-propenileno, 1,3,5-hexatrienileno, 1,3-hexadienileno y 1,4-hexadienileno.

Los ejemplos del grupo alquinileno inferior incluyen grupos alquinileno lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces triples tales como los grupos etinileno, 1-propinileno, 1-metil-1-propinileno, 2-metil-1-propinileno, 2-propinileno, 2-butinileno, 1-butinileno, 3-butinileno, 2-pentinileno, 1-pentinileno, 3-pentinileno, 4-pentinileno, 2-pentin-4-inileno, 2-hexinileno, 1-hexinileno, 5-hexinileno, 3-hexinileno, 4-hexinileno, 3,3-dietil-1-propinileno y 2-etil-1-propinileno.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, terc-butoxilo, pentiloxi y hexiloxi.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior incluyen

grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metilo, etilo, propilo, isopropilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, butilo, isobutilo, terc-butilo, isopentilo, pentilo y hexilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior el cual puede tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente incluyen, además de los grupos alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyente tales como los grupos metoximetilo, 1-etoxietilo, 2-metoxietilo, 2-propoxietilo, 3-isopropoxipropilo, 4-butoxibutilo, 5-pentiloxipentilo, 6-hexiloxihexilo, 1,1-dimetil-2-metoxietilo, 2-metil-3-etoxipropilo y 3-metoxipropilo.

Los ejemplos del grupo alcanoilo inferior incluyen grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos formilo, acetilo, propionilo, butirilo, isobutirilo, pentanoilo, terc-butilcarbonilo y hexanoilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alquilo inferior incluyen grupos fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos bencilo, 2-feniletilo, 1-feniletilo, 3-fenilpropilo, 4-fenilbutilo, 5-fenilpentilo, 6-

fenilhexilo, 1,1-dimetil-2-feniletilo y 2-metil-3-fenilpropilo.

Los ejemplos del grupo alquileno inferior incluyen grupos alquileno lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metileno, etileno, trimetileno, 2-metiltrimetileno, 2,2-dimetiletileno, 2,2-dimetiltrimetileno, 1-metiltrimetileno, metilmetileno, etilmetileno, tetrametileno, pentametileno y hexametileno.

Los ejemplos del grupo alquenileno inferior el cual puede tener un grupo fenilo como sustituyente incluyen grupos alquenileno lineales o ramificados, los cuales tienen de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles y los cuales pueden tener un grupo fenilo como sustituyente tales como los grupos vinileno, 1-propenileno, 1-metil-1-propenileno, 2-metil-1-propenileno, 2-propenileno, 2-butenileno, 1-butenileno, 3-butenileno, 2-pentenileno, 1-pentenileno, 3-pentenileno, 4-pentenileno, 1,3-butadienileno, 1,3-pentadienileno, 2-penten-4-inileno, 2-hexenileno, 1-hexenileno, 5-hexenileno, 3-hexenileno, 4-hexenileno, 3,3-dimetil-1-propenileno, 2-etil-1-propenileno, 1,3,5-hexatrienileno, 1,3-hexadienileno, 1,4-hexadienileno, 1-fenilvinileno, 3-fenil-1-propenileno, 3-fenil-1-metil-1-propenileno, 3-fenil-2-metil-1-propenileno, 1-fenil-2-propenileno, 1-fenil-2-butenileno, 3-fenil-1-butenileno, 1-fenil-3-butenileno, 5-fenil-2-pentenileno, 4-fenil-1-

pentenileno, 2-fenil-3-pentenileno, 1-fenil-4-pentenileno, 1-fenil-1,3-butadienileno, 1-fenil-1,3-pentadienileno, 1-fenil-2-penten-4-inileno, 1-fenil-2-hexenileno, 3-fenil-1-hexenileno, 4-fenil-5-hexenileno, 6-fenil-3-hexenileno, 5-fenil-4-hexenileno, 1-fenil-3,3-dimetil-1-propenileno, 1-fenil-2-etil-1-propenileno, 6-fenil-1,3,5-hexatrienileno, 1-fenil-1,3-hexadienileno y 2-fenil-1,4-hexadienileno.

Los ejemplos del grupo alquileno inferior el cual puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un grupo fenilo incluyen, además de los grupos alquileno inferior descritos anteriormente, grupos alquileno lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden ser sustituidos por 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo fenilo tales como los grupos metoximetileno, 2-feniletileno, 3-etoxitrimetileno, 1-propoxi-2-metiltrimetileno, 1-fenil-2,2-dimetiletileno, 3-fenil-2,2-dimetiltrimetileno, 2-butoxi-1-metiltrimetileno, fenilmetilmetileno, 2-pentiloxietilmetileno, 4-fenil-2-hexiloxitetrametileno, 3-fenilpentametileno, 5-fenilhexametileno, etoximetileno, 1-feniletileno, 3-feniltrimetileno y 2-fenil-1-metoxietileno.

Los ejemplos del grupo heterociclico saturado o insaturado, monocíclico, biciclico o tricíclico de 5 a 15

miembros el cual tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre incluyen grupos pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino, piridilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,5-triazolilo, tiazolidinilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, tienilo, quinolilo, 1,4-dihidroquinolilo, benzotiazolilo, pirazilo, pirimidilo, piridazilo, 2H-pirrolilo, pirrolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrofurilo, furazanilo, carbostirilo, 3,4-dihidrocarbostirilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilo, indolilo, isoindolilo, indolinilo, benzoimidazolilo, benzooxazolilo, imidazolidinilo, isoquinolilo, quinazolidinilo, quinoxalinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, carbazoilo, acridinilo, cromanilo, isoindolinilo, isocromanilo, pirazolilo, imidazolilo, pirazolidinilo, fenotiazinilo, benzofurilo, 2,3-dihidrobenzo[b]furilo, benzotienilo, fenoxatiinilo, fenoxazinilo, 4H-cromenilo, 1H-indazolilo, fenazinilo, xantenilo, tiantrenilo, 2-imidazolinilo, 2-pirrolinilo, furilo, oxazolilo, isooxazolilo, isooxazolidinilo, tiazolilo, isotiazolilo, piranilo, 2-tiazolinilo, 2-pirazolinilo, quinuclidinilo, 1,4-benzooxadinilo, 3,4-dihidro-2H-1,4-benzooxadinilo, 3,4-dihidro-2H-1,4-benzotiazinilo, 1,4-benzotiazinilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinoxalinilo, 1,3-ditia-2,4-dihidronaftalenilo, fenantridinilo, 1,4-ditianaftalenilo, dibenz[b,e]azepina y

6,11-dihidro-5H-dibenz[b,e]azepina.

Los ejemplos del átomo de halógeno incluyen un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo y átomo de yodo.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, terc-butoxi, pentiloxi, hexiloxi, trifluorometoxi, triclorometoxi, clorometoxi, bromometoxi, fluorometoxi, yodometoxi, difluorometoxi, dibromometoxi, 2-cloroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 4,4,4-triclorobutoxi, 4-fluorobutoxi, 5-cloropentiloxi, 3-cloro-2-metilpropoxi, 6-bromohexiloxi y 5,6-diclorohexiloxi.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen, además de los grupos alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos trifluorometilo, triclorometilo, clorometilo, bromometilo, fluorometilo, yodometilo, difluorometilo, dibromometilo, diclorometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-

trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 4,4,4-triclorobutilo, 4-fluorobutilo, 5-cloropentilo, 3-cloro-2-metilpropilo, 5-bromohexilo y 5,6-dibromohexilo.

Los ejemplos del grupo alquilsulfonilo inferior incluyen grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, butilsulfonilo, terc-butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno incluyen grupos fenilo los cuales pueden ser sustituidos, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 átomos de halógeno tales como los grupos fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-butilfenilo, 4-pentilfenilo, 4-hexilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dietilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 3,4,5-trimetilfenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-(bromometil)fenilo, 3-(2-cloroetil)fenilo, 4-(2,3-dicloropropil)fenilo, 4-(4-fluorobutil)fenilo, 3-(5-

cloropentil)fenilo, 4-(5-bromohexil)fenilo, 4-(5,6-dibromohexil)fenilo, 3,4-di(trifluorometil)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)fenilo, 2,5-di(3-cloropropil)fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)fenilo, 2-metil-4-trifluorometilfenilo y 3-etil-4-triclorometilo.

Los ejemplos del grupo alquiltio inferior incluyen grupos alquiltio lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, butiltio, terc-butiltio, pentiltio y hexiltio.

Los ejemplos del grupo amino el cual puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como sustituyente incluyen grupos amino los cuales pueden tener 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste de grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono y grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes tales como los grupos amino, metilamino, etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino, terc-butilamino, pentilamino, hexilamino, dimetilamino, dietilamino, dipropilamino, dibutilamino, dipentilamino, dihexilamino, N-metil-N-etilamino, N-etil-N-propilamino, N-metil-N-butilamino, N-metil-N-hexilamino, N-

acetilamino, N-formilamino, N-propionilamino, N-butirilamino, N-isobutirilamino, N-pentanoilamino, N-terc-butilcarbonilamino, N-hexanoilamino, diacetilamino, N-acetil-N-metilamino y N-acetil-N-etilamino.

Los ejemplos del grupo naftilo el cual puede ser sustituido en el anillo de naftaleno por 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo amino el cual puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior incluyen grupos naftilo los cuales pueden tener, en el anillo de naftaleno, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno y un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1- o 2-)naftilo, 1-metil-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 2-etil-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 3-n-propil-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-naftilo, 4-n-butil-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 4-metil-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 5-n-pentil-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 6-n-hexil-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 7- u 8-)naftilo, 1,7-dimetil-(2-, 3-, 4-, 5-, 6- u 8-)-

naftilo, 1,2,8-trimetil-(3-, 4-, 5-, 6- o 7-)naftilo, 1-dimetilamino-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 2-dimetilamino-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 3-metilamino-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 5-amino-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 5-dimetilamino-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 4-(N-metil-N-etilamino)-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 1-metil-2-dimetilamino-(3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo, 1-cloro-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)-naftilo y 1-acetilamino-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8-)naftilo.

Los ejemplos del grupo alquilo el cual puede tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente incluyen, además de los grupos alquilo inferior descritos anteriormente los cuales pueden tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente, grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 8 átomos de carbono los cuales pueden tener un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyente tales como los grupos heptilo, 1-etilpentilo, octilo, 7-metoxiheptilo, 1-etoxiheptilo, 2-propoxil-1-etilpentilo, 3-isopropoxioctilo, 7-butoxiheptilo, 8-pentiloxioctilo y 5-hexiloxi-1-etilpentilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por amino el cual puede tener un grupo alquilo inferior incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos por un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados

que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos aminometilo, 2-aminoetilo, 1-aminoetilo, 3-aminopropilo, 4-aminobutilo, 5-aminopentilo, 6-aminohexilo, 1,1-dimetil-2-aminoetilo, 2-metil-3-aminopropilo, metilaminometilo, 1-etilaminoetilo, 2-propilaminoetilo, 3-isopropilaminopropilo, 4-butilaminobutilo, 5-pentilaminopentilo, 6-hexilaminohexilo, dimetilaminometilo, 2-dietilaminoetilo, 2-diisopropilaminoetilo, (N-etil-N-propilamino)metilo y 2-(N-metil-N-hexilamino)etilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo incluyen grupos cicloalquilo que tienen de 3 a 16 átomos de carbono tales como los grupos ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo, ciclodecilo, cicloundecilo, ciclododecilo, ciclotridecilo, cicloteradecilo, ciclopentadecilo y ciclohexadecilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo el cual puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino el cual puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente en el anillo de cicloalquilo incluyen, además de los grupos cicloalquilo descritos anteriormente, grupos cicloalquilo que tienen de 3 a 16 átomos de carbono los cuales pueden ser sustituidos, en el anillo de cicloalquilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un

grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido por un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos 4-dimetilaminometilciclohexilo, 2-(aminometil)ciclopropilo, 3-(2-aminometil)ciclobutilo, 2-(1-aminoetil)ciclopentilo, 3-(3-aminopropil)ciclohexilo, 3-(4-aminobutil)cicloheptilo, 4-(5-aminopentil)ciclooctilo, 4-(6-aminohexil)ciclohexilo, 2-(1,1-dimetil-2-aminoetil)-cicloheptilo, 3-(2-metil-3-aminopropil)ciclopentilo, 3-(metilaminometil)ciclohexilo, 2-(1-etilaminoetil)ciclooctilo, 2-(2-propilaminoetil)ciclohexilo, 3-(3-isopropilaminopropil)-ciclopentilo, 4-(4-butilaminobutil)cicloheptilo, 2-(5-pentilaminopentil)ciclohexilo, 2-(6-hexilaminohexil)-ciclopentilo, 3-(dimetilaminometil)ciclohexilo, 3-[(N-etil-N-propilamino)metil]cicloheptilo, 4-[2-(N-metil-N-hexilamino)etil]ciclooctilo, 4-dimetilaminometilciclononilo, 2-(aminometil)ciclodecilo, 3-(2-aminometil)cicloundecilo, 2-(1-aminoetil)ciclododecilo, 3-(3-aminopropil)ciclotridecilo, 3-(4-aminobutil)ciclotetradecilo, 4-(5-aminopentil)-ciclopentadecilo, 4-(6-aminohexil)ciclohexadecilo, 2-(1,1-dimetil-2-aminoetil)ciclononilo, 3-(2-metil-3-aminopropil)-ciclodecilo, 3-(metilaminometil)cicloundecilo, 2-(1-

etilaminoetil)ciclododecilo, 2-(2-propilaminoetil)-ciclotridecilo, 3-(3-isopropilaminopropil)ciclotetradecilo, 4-(4-butilaminobutil)ciclopentadecilo, 2-(5-pentilaminopentil)ciclohexadecilo, 2-(6-hexilaminohexil)-ciclononilo, 3-(dimetilaminometil)ciclododecilo, 3-[(N-etil-N-propilamino)metil]ciclodecilo, 4-[2-(N-metil-N-hexilamino)-etil]ciclohexadecilo, 2,2-dimetilciclopropilo y 2-trifluorometilciclopropilo.

Los ejemplos del grupo alquenilo inferior incluyen grupos alquenilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 atomos de carbono y de 1 a 3 enlaces dobles tales como los grupos vinilo, 1-propenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 2-propenilo, 2-butenilo, 1-butenilo, 3-butenilo, 2-pentenilo, 1-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-butadienilo, 1,3-pentadienilo, 2-penten-4-inilo, 2-hexenilo, 1-hexenilo, 5-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 3,3-dimetil-1-propenilo, 2-etil-1-propenilo, 1,3,5-hexatrienilo, 1,3-hexadienilo y 1,4-hexadienilo.

Los ejemplos del grupo alquenilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen, además de los grupos alquenilo inferior descritos anteriormente, grupos alquenilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y los cuales tienen de 1 a 3 enlaces dobles tales como los grupos 3,3,3-

trifluoro-1-propenilo, 2-bromovinilo, 3-cloro-1-propenilo, 3-yodo-1-metil-1-propenilo, 3-fluoro-2-metil-1-propenilo, 2-butenilo, 4,4,3-tricloro-1-butenilo, 4,4-difluoro-3-butenilo, 5-fluoro-2-pentenilo, 5,5,3-tribromo-1-pentenilo, 5-cloro-3-pentenilo, 5,5,5-trifluoro-4-pentenilo, 4-cloro-1,3-butadienilo, 5-fluoro-1,3-pentadienilo, 5-bromo-2-penten-4-inilo, 6-fluoro-2-hexenilo, 6,6,5-trifluoro-1-hexenilo, 6-cloro-5-hexenilo, 5-bromo-3-hexenilo, 6-cloro-4-hexenilo, 3,3-dimetil-2-cloro-1-propenilo, 3-fluoro-2-etil-1-propenilo, 6-cloro-1,3,5-hexatrienilo, 6-bromo-1,3-hexadienilo y 6-fluoro-1,4-hexadienilo.

Los ejemplos del grupo benzoilo (el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente y un átomo de halógeno) incluyen grupos benzoilo (los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un átomo de halógeno) tales como los grupos benzoilo, 3,4-difluorobenzoilo, 2-fluorobenzoilo, 3-bromobenzoilo, 4-yodobenzoilo, 4-metilbenzoilo, 2-metilbenzoilo, 3-metilbenzoilo, 2-etilbenzoilo, 3-etilbenzoilo, 4-etilbenzoilo, 4-isopropilbenzoilo, 3-

butilbenzoilo, 4-pentilbenzoilo, 4-hexilbenzoilo, 3,4-dimetilbenzoilo, 3,4-dietilbenzoilo, 2,4-dimetilbenzoilo, 2,5-dimetilbenzoilo, 2,6-dimetilbenzoilo, 3,4,5-trimetilbenzoilo, 2-trifluorometilbenzoilo, 3-trifluorometilbenzoilo, 4-trifluorometilbenzoilo, 2-(bromometil)benzoilo, 3-(2-cloroetil)benzoilo, 4-(2,3-dicloropropil)benzoilo, 4-(4-fluorobutil)benzoilo, 3-(5-cloropentil)benzoilo, 4-(5-bromohexil)benzoilo, 4-(5,6-dibromohexil)benzoilo, 3,4-di(trifluorometil)benzoilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)benzoilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)benzoilo, 2,5-di(3-cloropropil)benzoilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)benzoilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)-benzoilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)benzoilo, 2-metil-4-trifluorometilbenzoilo, 3-etil-4-triclorometilbenzoilo, 2-cloro-4-trifluorometilbenzoilo, 3-etil-4-fluorobenzoilo, 3-fluoro-4-triclorometilbenzoilo, 2-metil-3-trifluorometil-4-trifluorometilbenzoilo, 3-fluorobenzoilo, 4-fluorobenzoilo, 2-bromobenzoilo, 4-bromobenzoilo, 2-yodobenzoilo, 3-yodobenzoilo, 2,3-dibromobenzoilo, 2,4-diyodobenzoilo, 2,5-difluorobenzoilo, 2,6-diclorobenzoilo, 2,4,6-triclorobenzoilo, 2,4-difluorobenzoilo, 3,5-difluorobenzoilo, 2,6-difluorobenzoilo, 2-clorobenzoilo, 3-clorobenzoilo, 4-clorobenzoilo, 2,3-diclorobenzoilo, 2,4-diclorobenzoilo, 2,5-diclorobenzoilo, 3,4-diclorobenzoilo, 2,6-diclorobenzoilo, 3,5-diclorobenzoilo, 2,4,6-trifluorobenzoilo y 2,4-

difluorobenzoilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por halógeno incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales tienen de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos trifluorometilo, triclorometilo, clorometilo, bromometilo, fluorometilo, yodometilo, difluorometilo, dibromometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 4,4,4-triclorobutilo, 4-fluorobutilo, 5-cloropentilo, 3-cloro-2-metilpropilo, 5-bromohexilo y 5,6-dibromohexilo.

Los ejemplos del grupo alquilendioxi inferior incluyen grupos alquileno lineales o ramificados que tienen de 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos metilendioxi, etilendioxi, trimetilendioxi y tetrametilendioxi.

Los ejemplos del grupo amino el cual puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo cicloalquilo incluyen grupos amino los cuales pueden tener 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo benzoilo y un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 16

átomos de carbono tales como los grupos amino, metilamino, etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino, terc-butilamino, pentilamino, hexilamino, dimetilamino, dietilamino, dipropilamino, dibutilamino, dipentilamino, dihexilamino, N-metil-N-etilamino, N-etil-N-propilamino, N-metil-N-butilamino, N-metil-N-hexilamino, N-metil-N-acetilamino, N-acetilamino, N-formilamino, N-propionilamino, N-butirilamino, N-isobutirilamino, N-pentanoilamino, N-terc-butilcarbonilamino, N-hexanoilamino, N-etil-N-acetilamino, N-benzoilamino, N-etil-N-benzoilamino, N-metil-N-benzoilamino, N-acetil-N-benzoilamino, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino, ciclohexilamino, cicloheptilamino, ciclooctilamino, N-metil-N-ciclohexilamino, N-metil-N-ciclopentilamino, N-metil-N-cicloheptilamino, N-ciclohexil-N-acetilamino, N-ciclopentil-N-benzoilamino, ciclononilamino, ciclodecilamino, ciclododecilamino, ciclotridecilamino, ciclotetradecilamino, ciclopentadecilamino, N-metil-N-ciclohexadecilamino, N-metil-N-ciclononilamino, N-metil-N-ciclodecilamino, N-cicloundecil-N-acetilamino y N-ciclohexadecil-N-benzoilo.

Los ejemplos del grupo alcanoilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen, además de los grupos alcanoilo inferior descritos anteriormente, grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de

1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos 2,2,2-trifluoroacetilo, 2,2,2-tricloroacetilo, 2-cloroacetilo, 2-bromoacetilo, 2-fluoroacetilo, 2-yodoacetilo, 2,2-difluoroacetilo, 2,2-dibromoacetilo, 3,3,3-trifluoropropionilo, 3,3,3-tricloropropionilo, 3-cloropropionilo, 2,3-dicloropropionilo, 4,4,4-triclorobutirilo, 4-fluorobutirilo, 5-cloropentanoilo, 3-cloro-2-metilpropionilo, 6-bromohexanoilo y 5,6-dibromohexanoilo.

Los ejemplos del grupo alcoxicarbonilo inferior incluyen grupos alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, butoxicarbonilo, terc-butoxicarbonilo, pentiloxicarbonilo y hexiloxicarbonilo.

Los ejemplos del grupo alcanoiloxi inferior incluyen grupos alcanoiloxi lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos acetiloxi, propioniloxi, butiriloxi, isobutiriloxi, pentanoiloxi, terc-butilcarboniloxi y hexanoiloxi.

Los ejemplos del grupo heterocíclico saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno, o atomos de azufre incluyen grupos pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino,

tiomorfolino, piridilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridilo, tienilo, pirazilo, pirimidilo, piridazilo, pirrolilo, 2H-pirrolilo, imidazolidinilo, pirazolilo, imidazolilo, pirazolidinilo, furazanilo, 2-imidazolinilo, imidazolidinilo, 2-pirrolinilo, furilo, oxazolilo, isooxazolidinilo, isooxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, piranilo, 2-pirazolidinilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,5-triazolilo, tiazolidinilo, 2-tiazolinilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, tetrahidropiranilo y tetrahidrofurilo.

Los ejemplos del anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros formado al unir $R^{11}$ y $R^{12}$ uno al otro, junto con átomos de nitrógeno unidos a ellos, a través o no a través de un átomo de nitrógeno, un átomo de azufre o un átomo de oxígeno, incluyen grupos pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino, tiomorfolino y homopiperazinilo.

Los ejemplos del grupo imidazolil-alquilo inferior incluyen grupos imidazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 4 o 5-)imidazolilmetilo, 2-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]etilo, 1-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]etilo, 3-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]propilo, 4-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]butilo, 5-[(1, 2, 4 o 5-)-imidazolil]pentilo, 6-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]etilo y 2-metil-3-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior incluyen grupos 1,2,4-triazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 3 o 5-)1,2,4-triazolilmetilo, 2-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]etilo, 1-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]etilo, 3-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]propilo, 4-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]butilo, 5-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]pentilo, 6-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]etilo y 2-metil-3-[(1, 3 o 5-)1,2,4-triazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,3-triazolil-alquilo inferior incluyen grupos 1,2,3-triazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 4 o 5-)1,2,3-triazolilmetilo, 2-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]etilo, 1-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]etilo, 3-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]propilo, 4-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]butilo, 5-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]pentilo, 6-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]etilo y 2-metil-3-[(1, 4 o 5-)1,2,3-triazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior incluyen grupos 1,2,5-triazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de

1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 3 o 4-)1,2,5-triazolilmetilo, 2-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]etilo, 1-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]etilo, 3-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]propilo, 4-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]butilo, 5-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]pentilo, 6-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]etilo y 2-metil-3-[(1, 3 o 4-)1,2,5-triazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirazolil-alquilo inferior incluyen grupos pirazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 3, 4 o 5-)pirazolilmetilo, 2-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]etilo, 1-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]-etilo, 3-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]propilo, 4-[(1, 3, 4 o 5-)-pirazolil]butilo, 5-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]pentilo, 6-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 3, 4 o 5-)-pirazolil]etilo y 2-metil-3-[(1, 3, 4 o 5-)pirazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirimidinil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de pirimidina incluyen grupos pirimidinilalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de pirimidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 4, 5 o 6-)pirimidinilmetilo, 2-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]etilo, 1-[(2, 4, 5 o

6-)pirimidinil]etilo, 3-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]propilo, 4-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]butilo, 5-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]pentilo, 6-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]etilo, 2-metil-3-[(2, 4, 5 o 6-)pirimidinil]propilo, [(1, 3, 4 o 5-)2,6-dioxopirimidinil]metilo, [(1, 3, 4, 5 o 6-)2-oxopirimidinil]metilo, [(1, 2, 4 o 5-)6-oxopirimidinil]metilo, [(1, 2, 5 o 6-)4-oxopirimidinil]metilo, [(1, 3, 5 o 6-)2,4-dioxopirimidinil]metilo, 2-[(4 o 6-)2,5-dioxopirimidinil]etilo, 1-[(1, 3, 4 o 5-)2,6-dioxopirimidinil]etilo, 3-[(1, 3 o 5-)2,4,6-trioxopirimidinil]propilo, 4-[(1, 3, 4 o 5-)2,6-dioxopirimidinil]butilo, 5-[(4 o 6-)2,5-dioxopirimidinil]pentilo, 6-[(1, 3, 5 o 6-)2,4-dioxopirimidinil]hexilo, 1,1-dimetil-[(1, 3, 4 o 5-)2,6-dioxopirimidinil]etilo y 2-metil-3-[(1, 3, 4 o 5-)2,6-dioxopirimidinil]propilo.

Los ejemplos del grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-iliden-alquilo inferior incluyen grupos 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenmetilo, 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenetilo, 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenpropilo, 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenisopropilo, 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenbutilo, 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ilidenpentilo y 3,5-dioxoisoxazolidin-4-

ilidenhexilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de 1,2,4-oxadiazol incluyen grupos 1,2,4-oxadiazolilalquilo los cuales pueden tener un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyente en el anillo de 1,2,4-oxadiazol y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (3 o 5-)1,2,4-oxadiazolilmetilo, 2-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]etilo, 1-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]etilo, 3-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]propilo, 4-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]butilo, 5-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]pentilo, 6-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]etilo, 2-metil-3-[(3 o 5-)1,2,4-oxadiazolil]propilo, 5-metil-3-(1,2,4-oxadiazolil)metilo, 3-etil-2-[5-(1,2,4-oxadiazolil)]etilo, 1-[3-propil-5-(1,2,4-oxadiazolil)]etilo, 3-[5-butil-3-(1,2,4-oxadiazolil)]propilo, 4-[3-pentil-5-(1,2,4-oxadiazolil)]butilo, 5-[5-hexil-3-(1,2,4-oxadiazolil)]pentilo, 6-[3-metil-5-(1,2,4-oxadiazolil)]hexilo, 1,1-dimetil-2-[5-isopropil-3-(1,2,4-oxadiazolil)]etilo y 2-metil-3-[3-isobutil-5-(1,2,4-oxadiazolil)]propilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente

en el anillo de tiazolidina incluyen grupos tiazolidinilalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 3, 4 o 5-)tiazolidinilmetilo, 2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 1-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propilo, 4-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-butilo, 5-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]pentilo, 6-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 2-metil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propilo, 2,4-dioxo-5-tiazolidinilmetilo, 2-[2-oxo-(3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 1-[4-oxo-(2, 3 o 5-)tiazolidinil]etilo, 3-[5-oxo-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]-propilo, 4-[2,5-dioxo-(3 o 4-)tiazolidinil]butilo, 5-[2,4,5-trioxo-3-tiazolidinil]pentilo, 6-[4,5-dioxo-(2 o 3-)tiazolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]etilo, 2-metil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]propilo y 3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]-propilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen, además de los grupos fenil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos fenilalquilo los cuales pueden tener un grupo alquilendioxi

lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como sustituyente en el anillo de fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 3,4-metilendioxibencilo, 3,4-trimetilendioxibencilo, 2-(2,3-etilendioxifenil)etilo, 1-(3,4-trimetilendioxifenil)etilo, 3-(2,3-tetrametilendioxifenil)propilo, 4-(3,4-metilendioxifenil)butilo, 5-(2,3-etilendioxifenil)pentilo, 6-(3,4-trimetilendioxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,3-metilendioxifenil)etilo y 2-metil-3-(3,4-etilendioxifenil)propilo.

Los ejemplos del grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior incluyen grupos alcoxicarbonilalquilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, 2-metoxicarboniletilo, 2-etoxicarboniletilo, 1-etoxicarboniletilo, 3-metoxicarbonilpropilo, 3-etoxicarbonilpropilo, 4-etoxicarbonilbutilo, 5-isopropoxicarbonilpentilo, 6-propoxicarbonilhexilo, 1,1-dimetil-2-butoxicarboniletilo, 2-metil-3-terc-butoxicarbonilpropilo, 2-pentiloxicarboniletilo y hexiloxicarbonilmetilo.

Los ejemplos del grupo carboxi-alquilo inferior incluyen grupos carboxialquilo cuya porción alquilo es un

grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como grupos carboximetilo, 2-carboxietilo, 1-carboxietilo, 3-carboxipropilo, 4-carboxibutilo, 5-carboxipentilo, 6-carboxihexilo, 1,1-dimetil-2-carboxietilo y 2-metil-3-carboxipropilo.

Los ejemplos del grupo alcanoilo inferior sustituido por morfolino incluyen grupos alcanoilo sustituidos por morfolino cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-[(2, 3 o 4-)morfolino]-acetilo, 3-[(2, 3 o 4-)morfolino]propionilo, 2-[(2, 3 o 4-)morfolino]propionilo, 4-[(2, 3 o 4-)morfolino]butirilo, 5-[(2, 3 o 4-)morfolino]pentanoilo, 6-[(2, 3 o 4-)morfolino]-hexanoilo, 2,2-dimetil-2-[(2, 3 o 4-)morfolino]propionilo y 2-metil-3-[(2, 3 o 4-)morfolino]propionilo.

Los ejemplos del grupo piperazinilcarbonil-alquilo inferior el cual puede ser sustituido en el anillo de piperazina por un grupo fenil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos piperazinilcarbonilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede ser sustituido en el anillo de piperazina por 1 a 3 grupos fenilalquilo los cuales pueden tener un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como

sustituyente en el grupo fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(1, 2 o 3-)piperazinil]-carbonilmetilo, 2-[(1, 2 o 3-)piperazinil]-carboniletilo, 1-[(1, 2 o 3-)piperazinil]carboniletilo, 3-[(1, 2 o 3-)piperazinil]carbonilpropilo, 4-[(1, 2 o 3-)piperazinil]-carbonilbutilo, 5-[(1, 2 o 3-)piperazinil]-carbonilpentilo, 6-[(1, 2 o 3-)piperazinil]carbonilhexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2 o 3-)piperazinil]carboniletilo, 2-metil-3-[(1, 2 o 3-)piperazinil]carbonilpropilo, (4-bencil-1-piperazinil-carbonil)metilo, 2-[4-(2-feniletil)-1-piperazinilcarbonil]-etilo, 1-[4-(3-fenilpropil)-1-piperazinilcarbonil]etilo, 3-[4-(4-fenilbutil)-1-piperazinilcarbonil]propilo, 4-[4-(5-fenilpentil)-1-piperazinilcarbonil]butilo, 5-[4-(6-fenilpropil)-1-piperazinilcarbonil]pentilo, 6-(4-bencil-1-piperazinilcarbonil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-bencil-1-piperazinilcarbonil)etilo, 2-metil-3-(4-bencil-1-piperazinilcarbonil)propilo, [4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]metilo, 2-{4-[2-(2,3-etilendioxifenil)-etil]-1-piperazinilcarbonil}etilo, 1-{4-[3-(3,4-trimetilen-dioxifenil)propil]-1-piperazinilcarbonil}etilo, 3-{4-[4-(2,3-tetrametilendioxifenil)butil]-1-piperazinilcarbonil}propilo, 4-{4-[5-(3,4-metilendioxifenil)-pentil]-1-piperazinil-carbonil}butilo, 5-{4-[3-(2,3-etilendioxifenil)propil]-1-piperazinilcarbonil}pentilo, 6-[4-(3,4-trimetilendioxibencil)-

1-piperazinilcarbonil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[4-(2,3-tetrametilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]etilo, 2-metil-3-[4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]-propilo, (3,4-dibencil-1-piperazinilcarbonil)metilo, (3,4,5-tribencil-1-piperazinilcarbonil)metilo, [2,4-di(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]metilo, [2,4,6-tri(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]metilo y [3-bencil-4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinilcarbonil]-metilo.

Los ejemplos del grupo piperazinil-alcanoilo inferior el cual puede ser sustituidos en el anillo de piperazina por un grupo fenil-alquilo inferior los cuales pueden tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos piperazinilalcanoilo cuya porcion alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y el cual puede ser sustituido en el anillo de piperazina por 1 a 3 grupos fenilalquilo los cuales pueden tener un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como sustituyente en el anillo de fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como los grupos 2-[(1, 2 o 3-)piperazinil]acetilo, 3-[(1, 2 o 3-)piperazinil]-propionilo, 2-[(1, 2 o 3-)piperazinil]propionilo, 4-[(1, 2 o 3-)piperazinil]butirilo, 5-[(1, 2 o 3-)piperazinil]-

pentanoilo, 6-[(1, 2 o 3-)piperazinil]hexanoilo, 2,2-dimetil-3-[(1, 2 o 3-)piperazinil]propionilo, 2-metil-3-[(1, 2 o 3-)piperazinil]propionilo, 2-(4-bencil-1-piperazinil)acetilo, 3-[4-(2-feniletil)-1-piperazinil]propionilo, 2-[4-(3-fenilpropil)-1-piperazinil]propionilo, 4-[4-(4-fenilbutil)-1-piperazinil]butirilo, 5-[4-(5-fenilpentil)-1-piperazinil]-pentanoilo, 6-[4-(6-fenilpropil)-1-piperazinil]hexanoilo, 6-(4-bencil-1-piperazinil)hexanoilo, 2,2-dimetil-3-(4-bencil-1-piperazinil)propionilo, 2-metil-3-(4-bencil-1-piperazinil)-propionilo, 2-[4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinil]-acetilo, 3-{4-[2-(2,3-etilendioxifenil)etil]-1-piperazinil}-propionilo, 2-{4-[3-(3,4-trimetilendioxifenil)propil]-1-piperazinil}propionilo, 4-{4-[4-(2,3-tetrametilendioxifenil)-butil]-1-piperazinil}-butirilo, 5-{4-[5-(3,4-metilendioxi-fenil)pentil]-1-piperazinil}pentanoilo, 5-{4-[3-(2,3-etilendioxifenil)propil]-1-piperazinil}pentanoilo, 6-[4-(3,4-trimetilendioxibencil)-1-piperazinil]hexanoilo, 2,2-dimetil-3-[4-(2,3-tetrametilendioxibencil)-1-piperazinil]-propionilo, 2-metil-3-[4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinil]propionilo, 2-(3,4-dibencil-1-piperazinil)-acetilo, 2-(3,4,5-tribencil-1-piperazinil)acetilo, 2-[2,4-di(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinil]acetilo, 2-[2,4,6-tri(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinil]acetilo y 2-[3-bencil-4-(3,4-metilendioxibencil)-1-piperazinil]acetilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior

sustituido por morfolinocarbonilo incluyen grupos morfolinocarbonilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2, 3 o 4-)morfolino]-carbonilmetilo, 2-[(2, 3 o 4-)morfolino]carboniletilo, 1-[(2, 3 o 4-)morfolino]carboniletilo, 3-[(2, 3 o 4-)morfolino]-carbonilpropilo, 4-[(2, 3 o 4-)morfolino]carbonilbutilo, 5-[(2, 3 o 4-)morfolino]carbonilpentilo, 6-[(2, 3 o 4-)morfolino]carbonilhexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 3 o 4-)morfolino]carboniletilo y 2-metil-3-[(2, 3 o 4-)morfolino]carbonilpropilo.

Los ejemplos del grupo imidazolil-alcanoilo inferior incluyen grupos imidazolilalcanoilo cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]acetilo, 3-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]-propionilo, 2-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]propionilo, 4-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]butirilo, 5-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]-pentanoilo, 6-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]hexanoilo, 2,2-dimetil-3-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]propionilo y 2-metil-3-[(1, 2, 4 o 5-)imidazolil]propionilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilcarbonilo incluyen grupos cicloalquilcarbonilo cuya porción cicloalquilo es un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 16 átomos de carbono tales como los grupos ciclopropilcarbonilo,

ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexilcarbonilo, cicloheptilcarbonilo, ciclooctilcarbonilo, ciclononilcarbonilo, ciclodecilcarbonilo, cicloundecilcarbonilo, ciclododecilcarbonilo, ciclotridecilcarbonilo, ciclotetradecilcarbonilo, ciclopentadecilcarbonilo y ciclohexadecilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo alcanoilo inferior sustituido por amino los cuales pueden tener un grupo alquilo inferior como sustituyente incluyen grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono sustituidos por un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes tales como los grupos aminoacetilo, 2-aminopropionilo, 3-aminopropionilo, 4-aminobutirilo, 5-aminopentanoilo, 6-aminohexanoilo, 2,2-dimetil-3-aminopropionilo, 2-metil-3-aminopropionilo, metilaminoacetilo, 2-etilaminopropionilo, 3-propilaminopropionilo, 3-isopropilaminopropionilo, 4-butilaminobutirilo, 5-pentilaminopentanoilo, 6-hexilaminohexanoilo, dimetilaminoacetilo, 3-diisopropilaminopropionilo, (N-etil-N-propilamino)acetilo y 2-(N-metil-N-hexilamino)acetilo.

Los ejemplos del grupo alquileno inferior el cual puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente incluyen, además de los grupos alquileno inferior descritos

anteriormente, grupos alquileno lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes tales como los grupos 1-hidroximetileno, 2-hidroxietileno, 1-hidroxietileno, 2-hidroxitrimetileno, 3-hidroxitrimetileno, 1-hidroxitrimetileno, 3-hidroxi-2-metiltrimetileno, 1-hidroxi-2-metiltrimetileno, 3-hidroxi-2,2-dimetiltrimetileno, 1-hidroxi-2,2-dimetiltrimetileno, 3-hidroxi-1-metiltrimetileno, 2-hidroxi-1-metiltrimetileno, 1-hidroximetilmetileno, hidroximetilmetileno, 2-hidroximetiltrimetileno, 2-hidroximetil-2-metiltrimetileno, (2-hidroxietil)metileno, (1-hidroxietil)metileno, 4-hidroxitetrametileno, 2-hidroxitetrametileno, 3-hidroxitetrametileno, 1-hidroxitetrametileno, 5-hidroxipentametileno, 4-hidroxipentametileno, 3-hidroxipentametileno, 2-hidroxipentametileno, 1-hidroxipentametileno, 6-hidroxihexametileno, 5-hidroxihexametileno, 4-hidroxihexametileno, 3-hidroxihexametileno, 2-hidroxihexametileno, 1-hidroxihexametileno, 1,2-dihidroxitrimetileno, 2,2,4-trihidroxitetrametileno, 1,2,6-trihidroxihexametileno y 3,4,5-trihidroxipentametileno.

Los ejemplos del grupo alquilo el cual puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente incluyen, además de los grupos alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 16 átomos de

carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes tales como los grupos heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, tridecilo, tetradecilo, pentadecilo, 1-metilhexilo, hexadecilo, hidroximetilo, 2-hidroxietilo, 1-hidroxietilo, 3-hidroxipropilo, 2,3-dihidroxipropilo, 4-hidroxibutilo, 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, 5,5,4-trihidroxipentilo, 5-hidroxipentilo, 6-hidroxihexilo, 1-hidroxiisopropilo y 2-metil-3-hidroxipropilo.

Los ejemplos del grupo alquilo sustituido por un grupo hidroxilo incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 16 átomos de carbono y de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes tales como los grupos hidroximetilo, 2-hidroxietilo, 1-hidroxietilo, 3-hidroxipropilo, 2,3-dihidroxipropilo, 4-hidroxibutilo, 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, 5,5,4-trihidroxipentilo, 5-hidroxipentilo, 6-hidroxihexilo, 1-hidroxiisopropilo y 2-metil-3-hidroxipropilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquilo el cual puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior incluyen, además de los grupos cicloalquilo descritos anteriormente, grupos cicloalquilo que tienen de 3 a 16 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo

alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-hidroxiciclopropilo, 3-hidroxiciclobutilo, 3-hidroxiciclopentilo, 2-hidroxiciclohexilo, 4-hidroxiciclohexilo, 3-hidroxicicloheptilo, 4-hidroxiciclooctilo, 5-hidroxiciclononilo, 3-hidroxiciclodecilo, 4-hidroxicicloundecilo, 5-hidroxiciclododecilo, 6-hidroxiciclotridecilo, 7-hidroxiciclotetradecilo, 6-hidroxiciclopentadecilo, 8-hidroxiciclohexadecilo, 2,4-dihidroxiciclohexilo, 2,4,6-trihidroxiciclohexilo, 1-metilciclopentilo, 2-etilciclopropilo, 3-n-propilciclobutilo, 2-n-butilciclohexilo, 4-n-pentilcicloheptilo, 4-n-hexilciclooctilo, 2,3-dimetilciclohexilo, 2,3,4-trimetilciclohexilo y 2-metil-4-hidroxiciclohexilo.

Los ejemplos del grupo fenoxi-alquilo inferior incluyen grupos fenoxialquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos fenoximetilo, 2-fenoxietilo, 1-fenoxietilo, 3-fenoxipropilo, 4-fenoxibutilo, 1,1-dimetil-2-fenoxietilo, 5-fenoxipentilo, 6-fenoxihexilo, 1-fenoxiisopropilo y 2-metil-3-fenoxipropilo.

Los ejemplos del grupo amino-alcoxi inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1

a 6 átomos de carbono sustituidos por un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos aminometoxi, 2-aminoetoxi, 1-aminoetoxi, 3-aminopropoxi, 4-aminobutoxi, 5-aminopentiloxi, 6-aminohexiloxi, 1,1-dimetil-2-aminoetoxi, 2-metil-3-aminopropoxi, metilaminometoxi, 1-etilaminoetoxi, 2-propilaminoetoxi, 3-isopropilaminopropoxi, 4-butilaminobutoxi, 5-pentilaminopentiloxi, 6-hexilaminohexiloxi, dimetilaminometoxi, 2-dietilaminoetoxi, 2-diisopropilaminoetoxi, (N-etil-N-propilamino)metoxi y 2-(N-metil-N-hexilamino)etoxi.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por un grupo hidroxilo incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales tienen de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes tales como los grupos hidroximetilo, 1-hidroxietilo, 2-hidroxietilo, 3-hidroxipropilo, 2,3-dihidroxipropilo, 4-hidroxibutilo, 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, 5,5,4-trihidroxipentilo, 5-hidroxipentilo, 6-hidroxihexilo, 1-hidroxiisopropilo y 2-metil-3-hidroxipropilo.

Los ejemplos del grupo amino el cual puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como sustituyente incluyen grupos amino los cuales pueden tener 1 o 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que tienen de de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes tales como los grupos

amino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, propilsulfonilamino, isopropilsulfonilamino, butilsulfonilamino, terc-butilsulfonilamino, pentilsulfonilamino, hexilsulfonilamino, dimetilsulfonilamino, dietilsulfonilamino, dipropilsulfonilamino, dibutilsulfonilamino, dipentilsulfonilamino, dihexilsulfonilamino, N-metilsulfonil-N-etilsulfonilamino, N-etilsulfonil-N-propilsulfonilamino, N-metilsulfonil-N-butilsulfonilamino y N-metilsulfonil-N-hexilsulfonilamino.

Los ejemplos del grupo alquinilo inferior incluyen grupos alquinilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos etinilo, 2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-pentinilo y 2-hexinilo.

Los ejemplos del grupo anilino el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos anilino los cuales pueden tener de 1 a 3 atomos de halógeno como sustituyentes en el anillo de fenilo tales como los grupos anilino, 2-fluoroanilino, 3-fluoroanilino, 4-fluoroanilino, 2-bromoanilino, 3-bromoanilino, 4-bromoanilino, 2-yodoanilino, 3-yodoanilino, 4-yodoanilino, 2,3-dibromoanilino, 2,4-diyodoanilino, 2,5-difluoroanilino, 2,6-dicloroanilino, 2,4,6-tricloroanilino, 2,6-difluoroanilino, 3,5-difluoroanilino, 2,6-difluoroanilino, 2-cloroanilino, 3-cloroanilino, 4-

cloroanilino, 2,3-dicloroanilino, 2,4-dicloroanilino, 2,5-dicloroanilino, 3,4-dicloroanilino, 2,6-dicloroanilino, 3,5-dicloroanilino, 2,4,6-trifluoroanilino, 2,4-difluoroanilino y 3,4-difluoroanilino.

Los ejemplos del grupo piperazinilo el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de piperazina incluyen grupos piperazinilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de piperazina tales como los grupos (1-, 2- o 3-)piperazinilo, 4-metil-(1-, 2- o 3-)piperazinilo, 2,3-dimetil-(1- o 5-)piperazinilo y 2,3,4-trimetil-(1-, 5- o 6-)piperazinilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinilo el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de pirrolidina incluyen grupos pirrolidinilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de pirrolidina tales como los grupos (1-, 2- o 3-)pirrolidinilo, 2-oxo-(1-, 3-, 4- o 5-)pirrolidinilo, 3-oxo-(1-, 2-, 4- o 5-)pirrolidinilo, 2,3-dioxo-(1-, 4- o 5-)pirrolidinilo y 2,5-dioxo-(1-, 3- o 4-)pirrolidinilo.

Los ejemplos del grupo alcanoil-amino inferior incluyen grupos alcanoil-amino lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 átomos de carbono los cuales tienen de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos

acetil-amino, propionil-amino, butiril-amino, pentanoil-amino, 2-metilpropionil-amino y hexanoil-amino.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo amino-alcoxi inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo hidroxilo; un grupo fenil-alquilo inferior; un grupo alquinilo inferior; un grupo amino el cual puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como sustituyente; un grupo alquiltio inferior; un grupo cicloalquilo; un grupo feniltio; un grupo adamantilo; un grupo anilino el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente en el anillo de fenilo; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo piperazinilo el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de piperazina; un grupo alcanoilamino inferior; un grupo ciano; un grupo pirrolidinilo el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de pirrolidina; y un grupo fenoxi incluyen grupos fenilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo alcoxi lineal o

ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno; un átomo de halógeno; un grupo aminoalcoxi cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes; un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes; un grupo fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo alquinilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono; un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes; un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 16 átomos de carbono; un grupo feniltio; un grupo adamantilo; un grupo anilino el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes en el anillo de fenilo; un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 2 a 6 atomos de carbono; un grupo ciano; un grupo piperazinilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como

sustituyentes en el anillo de piperazina; un grupo pirrolidinilo el cual puede tener 1 o 2 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de pirrolidina; y un grupo fenoxi tales como los grupos fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 2-isopropilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-butilfenilo, 4-pentilfenilo, 4-hexilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dietilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 3,4,5-trimetilfenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2-etoxifenilo, 3-etoxifenilo, 4-etoxifenilo, 4-isopropoxifenilo, 3-butoxifenilo, 4-pentiloxifenilo, 4-hexiloxifenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3,4-dietoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,5-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 3,4,5-trimetoxifenilo, 2-trifluorometoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 2-(bromometoxi)fenilo, 3-(2-cloroetoxi)fenilo, 4-(2,3-dicloropropoxi)fenilo, 4-(4-fluorobutoxi)fenilo, 3-(5-cloropentiloxi)fenilo, 4-(5-bromohexiloxi)fenilo, 4-(5,6-dibromohexiloxi)fenilo, 3,4-di(trifluorometoxi)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutoxi)-fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metoxipropil)fenilo, 2,5-di(3-cloropropoxi)fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetoxi)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometoxi)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetoxi)-fenilo, 2-metil-4-trifluorometoxifenilo, 3-etil-4-triclorometoxifenilo, 2-metoxi-4-trifluorometoxifenilo, 3-

etoxi-4-triclorometoxifenilo, 2-metil-3-trifluorometoxi-4-trifluorometoxifenilo, 2-fenoxifenilo, 3-fenoxifenilo, 4-fenoxifenilo, 2,3-difenoxifenilo, 3,4-difenoxifenilo, 2,6-difenoxifenilo, 3,4,5-trifenoxifenilo, 2-metil-4-fenoxifenilo, 3-etil-4-fenoxifenilo, 2-metoxi-4-fenoxifenilo, 3-etoxi-4-fenoxifenilo, 2-metil-3-fenoxi-4-trifluorometoxifenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,4-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2-bromofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, 2-yodofenilo, 3-yodofenilo, 4-yodofenilo, 2,3-dibromofenilo, 2,4-diyodofenilo, 4-metiltiofenilo, 4-ciclohexilfenilo, 4-cloro-2-anilinofenilo, 2-(4-cloro anilino)-5-etoxi carbonilfenilo, 4-[2-(N,N-dietilamino)etoxi]fenilo, 4-(4-metil-1-piperazinil)fenilo, 4-(2-oxo-1-pirrolidinil)fenilo, 4-metilsulfonilaminofenilo, 4-(2-hidroxietil)fenilo, 4-bencilfenilo, 4-etinilfenilo, 4-feniltiofenilo, 4-(1-adamantil)fenilo, 5-acetilamino-2-clorofenilo, 2-propanoilaminofenilo, 3-cianofenilo, 2-cianofenilo, 4-cianofenilo, 3,4-dicianofenilo y 3,4,5-tricianofenilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alquilo inferior el

cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente y un grupo alquilo inferior incluyen, además de los grupos fenil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tenga 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 4-fluorobencilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo, 4-clorobencilo, 2-(2-fluorofenil)etilo, 2-(4-fluorofenil)etilo, 2-(4-clorofenil)etilo, 3,4-dibromobencilo, 3,4-diyodobencilo, 2,4-difluorobencilo, 2,5-diclorobencilo, 2,6-diclorobencilo, 3,4,5-trifluorobencilo, 3-(4-clorofenil)propilo, 1-(2-bromofenil)etilo, 4-(3-fluorofenil)butilo, 5-(4-yodofenil)pentilo, 6-(4-clorofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(3-fluorofenil)etilo, 2-metil-3-(4-clorofenil)propilo, 2-metilbencilo, 2-(3-metilfenil)etilo, 3-(4-metilfenil)propilo, 1-(2-etilfenil)etilo, 4-(3-etilfenil)butilo, 5-(4-etilfenil)pentilo, 6-(4-isopropilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-

(3-butilfenil)etilo, 2-metil-3-(4-pentilfenil)propilo, 4-hexilbencilo, 3,4-dimetilbencilo, 3,4-dietilbencilo, 2,4-dimetilbencilo, 2,5-dimetilbencilo, 2,6-dimetilbencilo, 3,4,5-trimetilbencilo, 2-metoxibencilo, 2-(2-metoxifenil)etilo, 2-(3-metoxifenil)etilo, 2-(4-metoxifenil)etilo, 4-metoxibencilo, 1-(2-etoxifenil)etilo, 3-(3-etoxifenil)propilo, 4-(4-etoxifenil)butilo, 5-(4-isopropoxifenil)pentilo, 6-(3-butoxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-pentiloxifenil)etilo, 2-metil-3-(4-hexiloxifenil)propilo, 3,4-dimetoxibencilo, 3,4-dietoxibencilo, 2,4-dimetoxibencilo, 2,5-dimetoxibencilo, 2,6-dimetoxibencilo, 3,4,5-trimetoxibencilo, 2-trifluorometoxibencilo, 3-trifluorometoxibencilo, 4-trifluorometoxibencilo, 2-[2-(bromometoxi)fenil]etilo, 1-[3-(2-cloroetoxi)fenil]etilo, 3-[4-(2,3-dicloropropoxi)fenil]-propilo, 4-[4-(4-fluorobutoxi)fenil]butilo, 5-[3-(5-cloropentiloxi)fenil]pentilo, 6-[4-(5-bromohexiloxi)fenil]-hexilo, 1,1-dimetil-2-[4-(5,6-dibromohexiloxi)fenil]etilo, 3,4-di(trifluorometoxi)bencilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutoxi)-bencilo, 2,4-di(3-cloro-2-metoxipropil)bencilo, 2,5-di(3-cloropropoxi)bencilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetoxi)bencilo, 3,4,5-tri(trifluorometoxi)bencilo, 4-(2,2,2-tricloroetoxi)-bencilo, 2-metil-4-trifluorometoxibencilo, 3-etil-4-triclorometoxibencilo, 2-metoxi-4-trifluorometoxibencilo, 3-etoxi-4-triclorometoxibencilo, 2-metil-3-trifluorometoxi-4-

trifluorometoxibencilo, 2-cloro-3-metilbencilo, 4-fluoro-2-trifluorometoxibencilo y 3-cloro-2-metil-4-metoxibencilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alquilo inferior el cual tiene un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos fenilalquilo los cuales tienen un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como sustituyente en el anillo de fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 3,4-metilendioxibencilo, 3,4-trimetilendioxibencilo, 2-(2,3-etilendioxifenil)etilo, 1-(3,4-trimetilendioxifenil)etilo, 3-(2,3-tetrametilendioxifenil)-propilo, 4-(3,4-metilendioxifenil)butilo, 5-(2,3-etilendioxifenil)pentilo, 6-(3,4-trimetilendioxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,3-metilendioxifenil)etilo y 2-metil-3-(3,4-etilendioxifenil)-propilo.

Los ejemplos del grupo amino el cual puede tener un grupo alcanoilo inferior como sustituyente incluyen grupos amino los cuales pueden tener un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyente tales como los grupos amino, N-acetilamino, N-formilamino, N-propionilamino, N-butirilamino, N-isobutirilamino, N-pentanoilamino, N-terc-butilcarbonilamino y N-hexanoilamino.

Los ejemplos del grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo

el cual puede tener, en el anillo de tetrahidroquinolina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilendioxi inferior incluyen grupos 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo los cuales pueden tener, en el anillo de tetrahidroquinolina, 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 2-oxo-6,7-metilendioxi-(1, 3, 4, 5 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 2,4-dioxo-(1, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 2,4-dioxo-6,7-metilendioxi-(1, 3, 5 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 5,6-etilendioxi-(1, 2, 3, 4, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 7,8-trimetilendioxi-(1, 2, 3, 4, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 6,7-tetrametilendioxi-(1, 2, 3, 4, 5 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 5-metoxi-2-oxo-(1, 3, 4, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo y 2-oxo-6,7-etilendioxi-(1, 3, 4, 5 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo.

Los ejemplos del grupo cicloalquil-alquilo inferior incluyen grupos cicloalquilalquilo que tienen de 3 a 16 átomos de carbono cuya porción alquilo es un grupo alquilo

lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos ciclopropilmetilo, ciclohexilmetilo, 2-ciclopropiletilo, 1-ciclobutiletilo, 3-ciclopentilpropilo, 4-ciclohexilbutilo, 5-cicloheptilpentilo, 6-ciclooctilhexilo, 1,1-dimetil-2-ciclononiletilo, 2-metil-3-ciclodecilpropilo, cicloundecilmetilo, 2-ciclododeciletilo, 1-ciclotrideciletilo, 3-ciclotetradecilpropilo, 4-ciclopentadecilbutilo y 5-ciclohexadecilpentilo.

Los ejemplos del grupo piridil-alquilo inferior incluyen grupos piridilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 3 o 4-)piridilmetilo, 2-[(2, 3 o 4-)piridil]etilo, 1-[(2, 3 o 4-)piridil]etilo, 3-[(2, 3 o 4-)piridil]propilo, 4-[(2, 3 o 4-)piridil]butilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 3 o 4-)piridil]etilo, 5-[(2, 3 o 4-)piridil]pentilo, 6-[(2, 3 o 4-)piridil]hexilo, 1-[(2, 3 o 4-)piridil]isopropilo y 2-metil-3-[(2, 3 o 4-)piridil]-propilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por un grupo amino el cual puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un

grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos aminometilo, 2-aminoetilo, 1-aminoetilo, 3-aminopropilo, 4-aminobutilo, 5-aminopentilo, 6-aminohexilo, 1,1-dimetil-2-aminoetilo, 2-metil-3-aminopropilo, metilaminometilo, 1-etilaminoetilo, 2-propilaminoetilo, 3-isopropilaminopropilo, 4-butilaminobutilo, 5-pentilaminopentilo, 6-hexilaminohexilo, dimetilaminometilo, 2-diisopropilaminoetilo, (N-etil-N-propilamino)metilo, 2-(N,N-dimetilamino)etilo, 2-(N-metil-N-hexilamino)etilo, formilaminometilo, acetilaminometilo, 1-propionilaminoetilo, 2-acetilaminoetilo, 3-butirilaminopropilo, 4-pentanoilaminobutilo, 5-hexanoilaminopentilo, 6-acetilaminohexilo, N-metil-N-acetilaminometilo, 2-(N-etil-N-propanoilamino)etilo, (N-etil-N-butirilamino)metilo, 2-(N-metil-N-hexanoilamino)etilo y 3-(N,N-dimetilamino)propilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior-alquilo inferior incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuale tienen un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, como sustituyente tales como los grupos metoximetilo, 1-etoxietilo, 2-metoxietilo, 2-propoxietilo, 3-isopropoxipropilo, 4-butoxibutilo, 5-pentiloxipentilo, 6-hexiloxihexilo, 1,1-dimetil-2-metoxietilo, 2-metil-3-

etoxipropilo y 3-metoxipropilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonilo incluyen grupos 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil-alquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonilmetilo, 2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]-etilo, 1-[((1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil)etilo, 3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]propilo, 4-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]-butilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]etilo, 5-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]pentilo, 6-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]-hexilo, 1-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]isopropilo y 2-metil-3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonil]-propilo.

Los ejemplos del grupo piperidinilcarbonilo el cual puede tener, en el anillo de piperidina, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior y un grupo furil-alquilo inferior incluyen grupos

piperidinilcarbonilo los cuales pueden tener, en el anillo de piperidina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo furilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-bencil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(2 o 3-)furilmetil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(2-feniletil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{2-[(1 o 2-)furil]etil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(1-feniletil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{3-[(1 o 2-)furil]propil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(3-fenilpropil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{1-[(1 o 2-)furil]etil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(4-fenilbutil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{4-[(1 o 2-)furil]butil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(5-fenilpentil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{5-[(1 o 2-)furil]pentil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-(6-fenilhexil)-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-{6-[(1 o 2-)furil]hexil}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1,2-dibencil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilcarbonilo, 1,3-di(1 o 2-)furilmetil-(2, 4, 5 o

6-)piperidinilcarbonilo, 1,3,5-tribencil-(2, 4 o 6-)piperidinilcarbonilo, 1,2,6-tri(1 o 2-)furilmetil-(3, 4 o 5-)piperidinilcarbonilo, 1-bencil-3-(1 o 2-)furilmetil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilcarbonilo, 1-{1-[(1 o 2-)furil]etil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-metoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-etoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-propoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-butoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-terc-butoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-pentiloxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1-hexiloxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilcarbonilo, 1,2-dimetoxicarbonil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilcarbonilo, 1,2,6-trietoxicarbonil-(3, 4 o 5-)piperidinilcarbonilo, 1-(1 o 2-)furilmetil-3-terc-butoxicarbonil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilcarbonilo, 1-bencil-2-metoxicarbonil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilcarbonilo y 1-(1 o 2-)furilmetil-2,4-dimetoxicarbonil-(3, 5 o 6-)piperidinil-carbonilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tiazolidina incluyen grupos tiazolidinilalcanoilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-

[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]acetilo, 3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 4-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]butirilo, 5-[(2, 3, 4 o 5-)1,2,4-tiazolidinil]pentanoilo, 6-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]hexanoilo, 2,2-dimetil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 2-metil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil-acetilo, 3-[2-oxo-(3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 2-[4-oxo-(2, 3 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 4-[5-oxo-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]butirilo, 5-[2,5-dioxo-(3 o 4-)tiazolidinil]-pentanoilo, 6-[2,4,5-trioxo-3-tiazolidinil]hexanoilo, 2-[4,5-dioxo-(2 o 3-)tiazolidinil]acetilo, 2,2-dimetil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]propionilo y 2-metil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]propionilo.

Los ejemplos del grupo piperidinilo el cual puede ser sustituido en el anillo de piperidina por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo furil-alquilo inferior incluyen grupos piperidinilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de piperidina por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal

o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo benzoilo y un grupo furilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-bencil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(2 o 3-)furilmetil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(2-feniletil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{2-[(1 o 2-)furil]etil}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(1-feniletil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{3-[(1 o 2-)furil]propil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(3-fenilpropil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{1-[(1 o 2-)furil]etil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(4-fenilbutil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{4-[(1 o 2-)furil]butil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(5-fenilpentil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{5-[(1 o 2-)furil]pentil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-(6-fenilhexil)-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-{6-[(1 o 2-)furil]hexil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1,2-dibencil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1,3-di(1 o 2-)furilmetil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1,3,5-tribencil-(2, 4 o 6-)piperidinilo, 1,2,6-tri(1 o 2-)furilmetil-(3, 4 o 5-)piperidinilo, 1-bencil-3-(1 o 2-)furilmetil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1-{1-[(1 o 2-)furil]etil]}-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-benzoil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1,2-dibenzoil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1,3,5-tribenzoil-(2, 4 o 6-)piperidinilo, 1-metil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-etil-(2, 3 o

4-)piperidinilo, 1-propil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-isopropil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-butil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-isobutil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-terc-butil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-pentil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-hexil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1,2-dimetil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1,2,6-trimetil-(3, 4 o 5-)piperidinilo, 1-metil-3-bencil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1-benzoil-2-metil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1-(1 o 2-)furilmetil-2,4-dimetil-(3, 5 o 6-)piperidinilo, 1-metoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-etoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-propoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-butoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-terc-butoxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-pentiloxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-hexiloxicarbonil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1,2-dimetoxicarbonil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1,2,6-trietoxicarbonil-(3, 4 o 5-)piperidinilo, 1-metil-3-terc-butoxicarbonil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1-benzoil-2-metoxicarbonil-(2, 4, 5 o 6-)piperidinilo, 1-(1 o 2-)furilmetil-2,4-dimetoxicarbonil-(3, 5 o 6-)piperidinilo y 1-bencil-2,4-dimetoxicarbonil-(3, 5 o 6-)piperidinilo.

Los ejemplos del grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo:

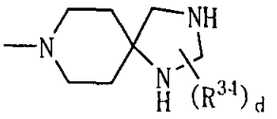
[Fórmula 54]



(en adelante llamado "grupo A") incluyen grupos carbonilalquilo sustituidos por un grupo A cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos carbonilmetilo sustituidos por un grupo A, carboniletilo sustituido por un grupo 2-A, carboniletilo sustituido por un grupo 1-A, carbonilpropilo sustituido por un grupo 3-A, carbonilbutilo sustituido por un grupo 4-A, carboniletilo sustituido por un grupo 1,1-dimetil-2-A, carbonilpentilo sustituido por un grupo 5-A, carbonilhexilo sustituido por un grupo 6-A, carbonilisopropilo sustituido por un grupo 1-A y carbonilpropilo sustituido por un grupo 2-metil-3-A.

Los ejemplos del grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo:

[Fórmula 55]



en donde $R^{34}$ es un grupo oxo o un grupo fenilo y d es un número entero de 0 a 3 (en adelante llamado "grupo B"), incluyen grupos carbonilalquilo sustituidos por un grupo B cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado

que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos carbonilmetilo sustituido por un grupo B, carboniletilo sustituido por un grupo 2-B, carboniletilo sustituido por un grupo 1-B, carbonilpropilo sustituido por un grupo 3-B, carbonilbutilo sustituido por un grupo 4-B, carboniletilo sustituido por un grupo 1,1-dimetil-2-B, carbonilpentilo sustituido por un grupo 5-B, carbonilhexilo sustituido por un grupo 6-B, carbonilisopropilo sustituido por un grupo 1-B y carbonilpropilo sustituido por un grupo 2-metil-3-B.

Los ejemplos del grupo pirrolidinil-alquilo inferior incluyen grupos pirrolidinilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1-, 2- o 3-)pirrolidinilmetilo, 2-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]etilo, 1-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]etilo, 3-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]propilo, 4-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]butilo, 5-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]pentilo, 6-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]etilo y 2-metil-3-[(1-, 2- o 3-)pirrolidinil]propilo.

Los ejemplos del grupo morfolino-alquilo inferior incluyen grupos morfolinoalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2-, 3- o 4-)morfolinometilo, 2-[(2-, 3- o 4-)morfolino]etilo, 1-[(2-,

3- o 4-)morfolino]-etilo, 3-[(2-, 3- o 4-)morfolino]propilo, 4-[(2-, 3- o 4-)morfolino]butilo, 5-[(2-, 3- o 4-)morfolino]pentilo, 6-[(2-, 3- o 4-)morfolino]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2-, 3- o 4-)morfolino]etilo y 2-metil-3-[(2-, 3- o 4-)morfolino]-propilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alquenilo inferior incluyen grupos fenilalquenilo cuya porción alquenilo es un grupo alquenilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y los cuales tienen de 1 a 3 enlaces dobles tales como los grupos estirilo, grupo 3-fenil-2-propenilo (nombre común: grupo cinamilo), 4-fenil-2-butenilo, 4-fenil-3-butenilo, 5-fenil-4-pentenilo, 5-fenil-3-pentenilo, 6-fenil-5-hexenilo, 6-fenil-4-hexenilo, 6-fenil-3-hexenilo, 4-fenil-1,3-butadienilo y 6-fenil-1,3,5-hexatrienilo.

Los ejemplos del grupo anilinocarbonil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos anilinocarbonilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de fenilo tales como los grupos anilinocarbonilmetilo, 2-anilinocarboniletilo, 1-anilinocarboniletilo, 3-anilinocarbonilpropilo, 4-anilinocarbonilbutilo, 5-anilinocarbonilpentilo, 6-

anilinocarbonilhexilo, 1,1-dimetil-2-anilinocarboniletilo, 2-metil-3-anilinocarbonilpropilo, (4-metilanilinocarbonil)-metilo, 2-(3-metilanilinocarbonil)etilo, 3-(4-metilanilinocarbonil)propilo, 1-(2-etilanilinocarbonil)etilo, 4-(3-etilanilinocarbonil)butilo, 5-(4-etilanilinocarbonil)-pentilo, 6-(4-isopropilanilinocarbonil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(3-butilanilinocarbonil)etilo, 2-metil-3-(4-pentilanilino-carbonil)propilo, 4-hexilanilinocarbonilmetilo, 3,4-dimetilanilinocarbonilmetilo, 3,4-dietilanilinocarbonil-metilo, 2,4-dimetilanilinocarbonilmetilo, 2,5-dimetilanilinocarbonilmetilo, 2,6-dimetilanilinocarbonil-metilo y 3,4,5-trimetilanilinocarbonilmetilo.

Los ejemplos del grupo piperazinil-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de piperazina, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos piperazinilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener, en el anillo de piperazina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo fenilalquilo el cual puede tener un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como

sustituyente en el anillo de fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(1-, 2- o 3-)piperazinil]metilo, 2-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo, 1-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo, 3-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]propilo, 4-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]butilo, 5-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]pentilo, 6-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo, 2-metil-3-[(1-, 2- o 3-)piperazinil]-propilo, [1-metil-(2-, 3- o 4-)piperazinil]metilo, 2-[1-etil-(2-, 3- o 4-)piperazinil]etilo, 1-[4-propil-(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo, 3-[3-isopropil-(1-, 2-, 4-, 5- o 6-)piperazinil]propilo, 4-[2-butil-(1-, 3-, 4-, 5- o 6-)piperazinil]butilo, 5-[1-isobutil-(2-, 3- o 4-)piperazinil]pentilo, 3-[4-metil-(1-, 2- o 3-)piperazinil]-propilo, 6-[1-terc-butil-(2-, 3- o 4-)piperazinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[4-pentil-(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo, [1,2-dimetil-(3-, 4-, 5- o 6-)piperazinil]metilo, [1,2,6-trimetil-(3-, 4- o 5-)piperazinil]metilo y 2-[4-(3,4-metilendioxibencil)-(1-, 2- o 3-)piperazinil]etilo.

Los ejemplos del grupo amidino-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente incluyen grupos amidinoalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilo

lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos amidinometilo, 2-amidinoetilo, 1-amidinoetilo, 3-amidinopropilo, 4-amidinobutilo, 5-amidinopentilo, 6-amidinohexilo, 1,1-dimetil-2-amidinoetilo, 2-metil-3-amidinopropilo, N,N-dimetilamidinometilo, 2-(N,N-dimetilamidino)etilo, 1-(N-metilamidino)etilo, 3-(N-etilamidino)propilo, 4-(N-n-propilamidino)propilo, 5-(N-n-pentilamidino)pentilo, 6-(N-n-hexilamidino)hexilo y (N-metil-N-etilamidino)metilo.

Los ejemplos del grupo carbazolilo el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de carbazol incluyen grupos carbazolilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de carbazol tales como los grupos (1-, 2-, 3- o 4-)carbazolilo, 9-metil-(1-, 2-, 3- o 4-)carbazolilo, 9-etil-(1-, 2-, 3- o 4-)carbazolilo, 1-etil-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)carbazolilo, 2-n-propil-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 8- o 9-)carbazolilo, 3-n-butil-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)carbazolilo, 4-n-pentil-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)carbazolilo, 5-n-hexil-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7-, 8- o 9-)carbazolilo, 6,9-dimetil-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 7- u 8-)carbazolilo y 1,7,8-tritil-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- o 9-)carbazolilo.

Los ejemplos del grupo amidino el cual puede tener

un grupo alquilo inferior como sustituyente incluyen grupos amidino los cuales pueden tener 1 o 2 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes tales como los grupos amidino, N,N-dimetilamidino, N-metilamidino, N-etilamidino, N-n-propilamidino, N-n-butilamidino, N-n-pentilamidino, N-n-hexilamidino, N,N-dietilamidino y N-metil-N-etilamidino.

Los ejemplos del grupo fenil-alquilo inferior (el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior), incluyen, además de los grupos fenil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (y los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono y un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) tales como los grupos 3,4-metilendioxibencilo, 3,4-trimetilendioxibencilo, 2-(2,3-etilendioxifenil)etilo, 1-(3,4-trimetilendioxifenil)etilo, 3-(2,3-tetrametilendioxi-fenil)propilo, 4-(3,4-metilendioxifenil)butilo, 5-(2,3-etilendioxifenil)pentilo, 6-(3,4-trimetilendioxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,3-metilendioxifenil)etilo, 2-metil-3-(3,4-

etilendioxifenil)propilo, 2-metoxibencilo, 2-(2-metoxifenil)etilo, 2-(3-metoxifenil)etilo, 2-(4-metoxifenil)etilo, 4-metoxibencilo, 1-(2-etoxifenil)etilo, 3-(3-etoxifenil)propilo, 4-(4-etoxifenil)butilo, 5-(4-isopropoxifenil)pentilo, 6-(3-butoxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-pentiloxifenil)etilo, 2-metil-3-(4-hexiloxifenil)propilo, 3,4-dimetoxibencilo, 3,4-dietoxibencilo, 2,4-dimetoxibencilo, 2,5-dimetoxibencilo, 2,6-dimetoxibencilo y 3,4,5-trimetoxibencilo.

Los ejemplos del grupo oxalilo sustituido por un grupo piperazinilo el cual puede tener, en el anillo de piperazina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenil-alquilo inferior (el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior) y un grupo piridil-alquilo inferior incluyen grupos oxalilo sustituidos por piperazinilo los cuales pueden tener, en el anillo de piperazina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (y el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono y un grupo alcoxi lineal o

ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono) y un grupo piridilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 4-(3,4-metilendioxibencil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-(2-, 3- o 4-piridilmetil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-(3,4-dimetoxibencil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-(2,3-metilendioxibencil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-(3,4-etilendioxibencil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-[2-(2-, 3- o 4-piridil)etil]-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 4-[3-(2-, 3- o 4-piridil)propil-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 2,4-bis(2-, 3- o 4-piridilmetil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo, 2-(3,4-metilendioxibencil)-4-(2-, 3- o 4-piridilmetil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo y 2,3,4-tri(2-, 3- o 4-piridilmetil)-(1-, 2- o 3-)piperaziniloxalilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por ciano incluyen grupos cianoalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos cianometilo, 2-cianoetilo, 1-cianoetilo, 3-cianopropilo, 4-cianobutilo, 5-cianopentilo, 6-cianohexilo, 1,1-dimetil-2-cianoetilo y 2-metil-3-cianopropilo.

Los ejemplos del anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros formado al unir $R^{36}$ y $R^{37}$ uno al otro, junto con átomos de nitrógeno unidos a ellos, a través o no a través de

un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre incluyen grupos pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino, tiomorfolino y homopiperazinilo.

Los ejemplos del anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros, saturado o insaturado formado al unir $R^{14}$ y $R^{15}$ entre sí, junto con átomos de nitrógeno unido a ellos, a través o no a través de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre incluyen grupos 1,2,3,4,5,6-hexahidropirimidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino, tiomorfolino, homopiperazinilo, homopiperidinilo, tiazolidinilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 2-pirrolinilo, 2-imidazolinilo, imidazolidinilo, 2-pirazolinilo, pirazolidinilo, 1,2-dihidropiridilo, 1,2-dihidroquinolilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilo, 1,2-dihidroisoquinolilo, indolilo, isoindolilo, indolinilo, isoindolinilo, 3,4-dihidro-2H-1,4-benzooxazinilo, 3,4-dihidro-2H-1,4-benzotiazolidinilo, 1,4-benzotiazinilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinoxalinilo, 1,2,3,4-tetrahidrocinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroftalazinilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinazolinilo, 1,2-dihidroquinoxalinilo, 3,4-dihidroquinoxalinilo, 1,4-dihidroquinoxalinilo, 1,2-dihidrocinolinilo, 1,2-dihidroftalazinilo, 3,4-dihidroftalazinilo, 1,2-dihidroquinazolinilo, 3,4-dihidroquinazolinilo, indazolilo, indazolinilo, 6-

azabiciclo[3,2,1]octilo, 3-aza-espiro[5,5]undecilo y tiazolidinilo. De preferencia, $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, se unen uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno para formar un grupo heterocíclico saturado de 6 miembros. Muy preferiblemente, incluyen grupos piperidinilo y piperazinilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alcoxi inferior incluyen grupos fenilalcoxi cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos benciloxi, 2-feniletoxi, 1-feniletoxi, 3-fenilpropoxi, 4-fenilbutoxi, 5-fenilpentiloxi, 6-fenilhexiloxi, 1,1-dimetil-2-feniletoxi y 2-metil-3-fenilpropoxi.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por fenilo el cual tiene 1 o 2 grupos fenilo que pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino el cual puede tener un grupo alcanoilo inferior como sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior; y los

cuales pueden tener un grupo piridilo en el grupo alquilo inferior incluyen además de los grupos fenil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo sustituidos por fenilo que tienen 1 o 2 grupos fenilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alcanoilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes, un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes, un grupo fenilalcoxi cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo hidroxi y un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; los cuales pueden tener un grupo piridilo en el grupo alquilo, y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como los grupos 1-fenil-1-(2, 3 o 4-)piridil-metilo, 1,1-difenilmetilo, 1,1-

di(4-fluorofenil)metilo, 1-fenil-1-(4-metoxifenil)metilo, 3,4-metilendioxibencilo, 3,4-etilendioxibencilo, 3,4-trimetilendioxibencilo, 2,5-difluorobencilo, 2,4-difluorobencilo, 3,4-difluorobencilo, 3,5-difluorobencilo, 2,6-difluorobencilo, 3-trifluorometilbencilo, 2-trifluorometilbencilo, 4-trifluorometilbencilo, 3,4-dimetoxibencilo, 3,5-dimetoxibencilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo, 4-clorobencilo, 2-metilbencilo, 3-metilbencilo, 4-metilbencilo, 3,4-dimetilbencilo, 2,3-dimetilbencilo, 2-metoxibencilo, 3-metoxibencilo, 4-cianobencilo, 2-cianobencilo, 3-cianobencilo, 4-metoxibencilo, 2,3-diclorobencilo, 2,4-diclorobencilo, 2,5-diclorobencilo, 3,4-diclorobencilo, 2,6-diclorobencilo, 4-fluorobencilo, 3-fluorobencilo, 2-fluorobencilo, 4-nitrobencilo, 3-nitrobencilo, 2-nitrobencilo, 3-trifluorometoxibencilo, 4-trifluorometoxibencilo, 2-trifluorometoxibencilo, 4-metoxicarbonilbencilo, 3-metoxicarbonilbencilo, 4-terc-butilbencilo, 4-etilbencilo, 4-isopropilbencilo, 4-metoxi-3-clorobencilo, 2-(4-metoxifenil)etilo, 2-(4-fluorofenil)etilo, 2-(4-clorofenil)etilo, 2-(3-metoxifenil)etilo, 2-(4-metilfenil)etilo, 4-fenilbencilo, 3,3-difenilpropilo, 3-metil-4-nitrobencilo, 4-(4-metoxifenil)butilo, 2-(4-metilfenil)etilo, 4-terc-butoxicarbonilbencilo, 3-cloro-6-metoxibencilo, 4-acetilaminobencilo, 4-nitro-3-metilbencilo, 4-hidroxibencilo, 3-hidroxibencilo, 2-hidroxibencilo, 4-terc-

butirilbencilo, 4-benciloxibencilo, 4-pivaloilbencilo, 2-(4-acetilfenil)etilo, 1-(3-propionilfenil)etilo, 3-(2-butirilfenil)propilo, 4-(4-pentanoilfenil)butilo, 5-(3-hexanoilfenil)pentilo, 6-(2,4-diacetilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4,6-triacetilfenil)etilo, 2-metil-3-(3,4-diacetilfenil)propilo, 2-(4-aminofenil)etilo, 1-(3-propionilaminofenil)etilo, 3-(2-butirilaminofenil)propilo, 4-(4-pentanoilamino)fenilbutilo, 5-(hexanoilaminofenil)pentilo, 6-(N-acetil-N-propionilaminofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(3,4-diaminofenil)etilo, 2-metil-3-(3,4,5-triacetilaminofenil)-propilo, 2-(2-etoxicarbonilfenil)etilo, 1-(3-propoxicarbonilfenil)etilo, 3-(4-pentiloxicarbonilfenil)-propilo, 4-(3-hexiloxicarbonilfenil)butilo, 5-(3,4-dimetoxicarbonilfenil)pentilo, 6-(3,4,5-trietoxicarbonil-fenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-butoxicarbonilfenil)etilo, 2-metil-3-(4-metoxicarbonilfenil)propilo, 2-(2-cianofenil)etilo, 1-(3-cianofenil)etilo, 3-(4-cianofenil)propilo, 4-(2-cianofenil)butilo, 5-(3-cianofenil)pentilo, 6-(4-cianofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dicianofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-tricianofenil)-propilo, 2-(2-nitrofenil)etilo, 1-(3-nitrofenil)etilo, 3-(4-nitrofenil)propilo, 4-(2-nitrofenil)butilo, 5-(3-nitrofenil)pentilo, 6-(4-nitrofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dinitrofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trinitrofenil)-propilo, 2-(2-fenilfenil)etilo, 1-(3-fenilfenil)etilo, 3-(4-

fenilfenil)propilo, 4-(2-fenilfenil)butilo, 5-(3-fenilfenil)pentilo, 6-(4-fenilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-difenilfenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trifenilfenil)-propilo, 2-(2-fluorofenil)etilo, 1-(3-bromofenil)etilo, 3-(4-yodofenil)propilo, 4-(2-bromofenil)butilo, 5-(3-clorofenil)pentilo, 6-(4-bromofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-diclorofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-propilo, 2-(2-etilfenil)etilo, 1-(3-propilfenil)etilo, 3-(4-butilfenil)propilo, 4-(2-pentilfenil)butilo, 5-(3-hexilfenil)pentilo, 6-(4-trifluorometilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetilfenil)etilo, 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometil)fenil]propilo, 2-(2-etoxifenil)etilo, 1-(3-propoxifenil)etilo, 3-(4-butoxifenil)propilo, 4-(2-pentiloxifenil)butilo, 5-(3-hexiloxifenil)pentilo, 6-(4-trifluorometoxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetoxifenil)etilo, 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometoxi)-fenil]propilo, 2-(2-benciloxifenil)etilo, 1-[3-(2-feniletoxi)fenil]etilo, 3-[4-(3-fenilpropoxi)fenil]propilo, 4-[2-(4-fenilbutoxi)fenil]butilo, 5-[3-(5-fenilpentiloxi)-fenil]pentilo, 6-[4-(6-fenilhexiloxi)fenil]hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dibenciloxifenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-tribenciloxifenil)propilo, 2-(2-hidroxifenil)etilo, 1-(3-hidroxifenil)etilo, 3-(4-hidroxifenil)propilo, 4-(2-hidroxifenil)butilo, 5-(3-hidroxifenil)pentilo, 6-(4-hidroxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dihidroxifenil)etilo,

2-metil-3-(2,4,6-trihidroxifenil)propilo, 2-(3,4-metilendioxifenil)etilo, 1-(2,3-etilendioxifenil)etilo, 3-(3,4-trimetilendioxifenil)propilo, 4-(3,4-tetrametilendioxifenil)butilo, 5-(3,4-metilendioxifenil)pentilo, 6-(3,4-etilendioxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(3,4-metilendioxi)-etilo y 2-metil-3-(3,4-metilendioxifenil)propilo. De preferencia, incluyen grupos alquilo inferior sustituidos por fenilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por grupo(s), como sustituyente(s), seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino el cual puede tener un grupo alcanoilo inferior como sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior.

Los ejemplos del grupo piridil-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de piridina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior el cual puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente incluyen, además de los grupos piridil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos piridilalquilo los cuales pueden tener,

en el anillo de piridina, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxi y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos hidroxi como sustituyentes, y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [2-metil-(3, 4, 5 o 6-)piridil]metilo, [2-metil-3-hidroxi-5-hidroximetil-(4 o 6-)piridil]metilo, 2-[3-etil-(2, 4, 5 o 6-)piridil]etilo, 1-[4-propil-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 3-[2-butil-(3, 4, 5 o 6-)piridil]propilo, 4-[3-pentil-(2, 4, 5 o 6-)piridil]butilo, 1,1-dimetil-2-[4-hexil-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 5-[2,3-dimetil-(4, 5 o 6-)piridil]pentilo, 6-[2,4,6-trimetil-(3 o 5-)piridil]hexilo, 1-[2-hidroxi-(2, 3, 5 o 6-)piridil]-isopropilo, 2-metil-3-[3-hidroxi-(2, 4, 5 o 6-)piridil]-propilo, [2-hidroxi-(3, 4, 5 o 6-)piridil]metilo, 2-[3-hidroxi-(2, 4, 5 o 6-)piridil]etilo, 1-[4-hidroxi-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 3-[2-hidroxi-(3, 4, 5 o 6-)piridil]propilo, 4-[3-hidroxi-(2, 4, 5 o 6-)piridil]butilo, 1,1-dimetil-2-[4-hidroxi-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 5-[2,3-dihidroxi-(4, 5 o 6-)piridil]pentilo, 6-[2,4,6-trihidroxi-(3 o 5-)piridil]-hexilo, [2-hidroximetil-(3, 4, 5 o 6-)piridil]metilo, 2-[3-(2-hidroxietil)-(2, 4, 5 o 6-)piridil]etilo, 1-[4-(3-hidroxipropil)-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 3-[2-(4-hidroxibutil)-(3, 4, 5 o 6-)piridil]propilo, 4-[3-(5-

hidroxipentil)-(2, 4, 5 o 6-)piridil]butilo, 1,1-dimetil-2-[4-(6-hidroxihexil)-(2, 3, 5 o 6-)piridil]etilo, 5-[2,3-di(hidroximetil)-(4, 5 o 6-)piridil]pentilo, 6-[2,4,6-tri(hidroximetil)-(3 o 5-)piridil]hexilo, 1-[2-hidroximetil-(2, 3, 5 o 6-)piridil]isopropilo, 2-metil-3-[3-(2,3-dihidroxipropil)-(2, 4, 5 o 6-)piridil]propilo, [2-metil-3-(2,2,4-trihidroxibutil)-(4, 5 o 6-)piridil]metilo y [2-metil-5-hidroximetil-(3, 4 o 6-)piridil]metilo.

Los ejemplos del grupo pirrolil-alquilo inferior el cual puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el anillo de pirrol incluyen grupos pirrolilalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en el anillo de pirrol y cuya porción alquilo es un grupo alquiló lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(1, 2 o 3-)pirrolil]metilo, 2-[(1, 2 o 3-)pirrolil]etilo, 1-[(1, 2 o 3-)pirrolil]etilo, 3-[(1, 2 o 3-)pirrolil]propilo, 4-[(1, 2 o 3-)pirrolil]-butilo, 5-[(1, 2 o 3-)pirrolil]pentilo, 6-[(1, 2 o 3-)pirrolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2 o 3-)pirrolil]etilo, 2-metil-3-[(1, 2 o 3-)pirrolil]propilo, [1-metil-(2 o 3-)pirrolil]metilo, 2-[2-etil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolil]etilo, 1-[3-propil-(1, 2, 4 o 5-)pirrolil]etilo, 3-[1-butil-(2, 3 o 4-)pirrolil]propilo, 4-[2-pentil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolil]-butilo, 5-[3-hexil-(1, 2, 4 o 5-)pirrolil]pentilo, 6-[1,2-

dimetil-(3, 4 o 5-)pirrolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[1,2,3-trimetil-(4 o 5-)pirrolil]etilo y 2-metil-3-[1-etil-2-metil-(3, 4 o 5-)pirrolil]propilo.

Los ejemplos del grupo benzoxazolil-alquilo inferior incluyen grupos benzoxazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]metilo, 2-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]-etilo, 1-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]etilo, 3-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]propilo, 4-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]butilo, 5-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]-pentilo, 6-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]etilo y 2-metil-3-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzooxazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo benzotiazolil-alquilo inferior incluyen grupos benzotiazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]metilo, 2-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]-etilo, 1-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]etilo, 3-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]propilo, 4-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]butilo, 5-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]-pentilo, 6-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]etilo y 2-metil-3-[(2, 4, 5, 6 o 7-)benzotiazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo furil-alquilo inferior incluyen grupos furilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2 o 3-)furil]metilo, 2-[(2 o 3-)furil]etilo, 1-[(2 o 3-)furil]etilo, 3-[(2 o 3-)furil]-propilo, 4-[(2 o 3-)furil]butilo, 5-[(2 o 3-)furil]pentilo, 6-[(2 o 3-)furil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2 o 3-)furil]etilo y 2-metil-3-[(2 o 3-)furil]propilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tiazolidina incluyen grupos tiazolidinilalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 3, 4 o 5-)tiazolidinilmetilo, 2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-etilo, 1-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propilo, 4-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-butilo, 5-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]pentilo, 6-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 2-metil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propilo, [2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]-metilo, 2-[2-oxo-(3, 4 o 5-)tiazolidinil]etilo, 1-[4-oxo-(2, 3 o 5-)tiazolidinil]etilo, 3-[2-oxo-(3, 4 o 5-)tiazolidinil]-propilo, 4-[5-oxo-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]butilo, 5-[2,5-

dioxo-(3 o 4-)tiazolidinil]pentilo, 6-[2,4,5-trioxo-3-tiazolidinil]hexilo, 1-[4,5-dioxo-(2 o 3-)tiazolidinil]etilo, 2-[4,5-dioxo-(2- o 3-)tiazolidinil]etilo, 1,1-dimetil-2-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]etilo y 2-metil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]propilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidiniliden-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tiazolidina incluyen grupos tiazolidinilidenalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenmetilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenetilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenpropilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenisopropilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenbutilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenpentilo, (2, 4 o 5-)tiazolidinilidenhexilo, 4,5-dioxo-2-tiazolidinilidenmetilo, 2,5-dioxo-4-tiazolidinilidenmetilo, 2,4-dioxo-5-tiazolidinilidenmetilo, 4-oxo-(2 o 5-)tiazolidinilidenetilo, 5-oxo-(2 o 4-)tiazolidinilidenpropilo y 2-oxo-(4 o 5-)tiazolidinilidenbutilo.

Los ejemplos del grupo benzoilo el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo amino el cual puede tener un grupo alquilsulfonilo

inferior como sustituyente, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo tiazolidiniliden-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tiazolidina y un grupo alquilendioxi inferior incluyen grupos benzoilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano; un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 grupos alquilsulfonilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes; un átomo de halógeno; un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes; un grupo tiazolidinilalquilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo tiazolidinilidenalquilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tiazolidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; y un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos

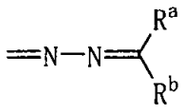
de carbono tales como los grupos benzoilo, 4-cianobenzoilo, 3,4-metilendioxibenzoilo, 2-aminobenzoilo, 3-aminobenzoilo, 4-aminobenzoilo, 3,4-diaminobenzoilo, 2,4,6-triaminobenzoilo, 4-metoxibenzoilo, 4-trifluorometilbenzoilo, 4-clorobenzoilo, 3,4-difluorobenzoilo, 2-fluorobenzoilo, 3-bromobenzoilo, 4-yodobenzoilo, 3,4-dimetoxibenzoilo, 4-fluorobenzoilo, 3-cianobenzoilo, 2-cianobenzoilo, 2,3-dicianobenzoilo, 3,4,5-tricianobenzoilo, 4-metilbenzoilo, 4-(2,4-dioxotiazolidinilmetil)benzoilo, 4-(2,4-dioxotiazolidinilidenmetil)benzoilo, 2-metilbenzoilo, 3-metilbenzoilo, 2-etilbenzoilo, 3-etilbenzoilo, 4-etilbenzoilo, 4-isopropilbenzoilo, 3-butilbenzoilo, 4-pentilbenzoilo, 4-hexilbenzoilo, 3,4-dimetilbenzoilo, 3,4-dietilbenzoilo, 2,4-dimetilbenzoilo, 2,5-dimetilbenzoilo, 2,6-dimetilbenzoilo, 3,4,5-trimetilbenzoilo, 2-metoxibenzoilo, 3-metoxibenzoilo, 2-etoxibenzoilo, 3-etoxibenzoilo, 4-etoxibenzoilo, 4-isopropoxibenzoilo, 3-butoxibenzoilo, 4-pentiloxibenzoilo, 4-hexiloxibenzoilo, 3,4-dietoxibenzoilo, 2,4-dimetoxibenzoilo, 2,5-dimetoxibenzoilo, 2,6-dimetoxibenzoilo, 3,4,5-trimetoxibenzoilo, 2-trifluorometilbenzoilo, 3-trifluorometilbenzoilo, 4-trifluorometilbenzoilo, 2-(bromometil)benzoilo, 3-(2-cloroetil)benzoilo, 4-(2,3-dicloropropil)benzoilo, 4-(4-fluorobutil)benzoilo, 3-(5-cloropentil)benzoilo, 4-(5-bromohexil)benzoilo, 4-(5,6-dibromohexil)benzoilo, 3,4-

di(trifluorometil)benzoilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)-benzoilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)benzoilo, 2,5-di(3-cloropropil)benzoilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)benzoilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)benzoilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)-benzoilo, 2-metil-4-trifluorometilbenzoilo, 3-etil-4-triclorometilbenzoilo, 2-metoxi-4-trifluorometilbenzoilo, 3-etil-4-fluorobenzoilo, 3-etoxi-4-triclorometilbenzoilo, 2-metil-3-trifluorometil-4-trifluorometilbenzoilo, 3-fluorobenzoilo, 4-fluorobenzoilo, 2-bromobenzoilo, 4-bromobenzoilo, 2-yodobenzoilo, 3-yodobenzoilo, 2,3-dibromobenzoilo, 2,4-diyodobenzoilo, 2,5-difluorobenzoilo, 2,6-diclorobenzoilo, 2,4,6-triclorobenzoilo, 2,4-difluorobenzoilo, 3,4-difluorobenzoilo, 3,5-difluorobenzoilo, 2,6-difluorobenzoilo, 2-clorobenzoilo, 3-clorobenzoilo, 4-clorobenzoilo, 2,3-diclorobenzoilo, 2,4-diclorobenzoilo, 2,5-diclorobenzoilo, 3,4-diclorobenzoilo, 2,6-diclorobenzoilo, 3,5-diclorobenzoilo, 2,4,6-trifluorobenzoilo, 2,4-difluorobenzoilo, 3,4-difluorobenzoilo, 3,4-metilendioxibenzoilo, 3,4-trimetilendioxibenzoilo, 2,3-etilendioxibenzoilo, 3,4-trimetilendioxibenzoilo, 2,3-tetrametilendioxibenzoilo, 2,3-metilendioxibenzoilo, 3,4-etilendioxibenzoilo y 2-metanosulfonilaminobenzoilo.

Los ejemplos del grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior el cual puede ser sustituido en el anillo de tiazolidina por un grupo seleccionado del grupo que consiste

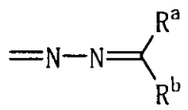
de un grupo oxo y un grupo de la fórmula:

[Fórmula 56]



en donde $R^a$ y $R^b$ cada uno representa un grupo alquilo inferior, incluyen grupos tiazolidinilalcanoilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de tiazolidina por 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo y un grupo de la fórmula:

[Fórmula 57]



en donde $R^a$ y $R^b$ cada uno representa un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tienen de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]acetilo, 3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 2-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 4-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]butirilo, 5-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]pentanoilo, 6-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-hexanoilo, 2,2-dimetil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 2-metil-3-[(2, 3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, [2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]acetilo, 3-[2-oxo-(3, 4 o

5-)tiazolidinil]propionilo, 2-[4-oxo-(2, 3 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 4-[5-oxo-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]butirilo, 5-[2,5-dioxo-(3 o 4-)tiazolidinil]pentanoilo, 6-[2,4,5-trioxo-3-tiazolidinil]hexanoilo, 2-[4,5-dioxo-(2 o 3-)tiazolidinil]-acetilo, 2,2-dimetil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 2-metil-3-[2,4-dioxo-(3 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 2-[4-oxo-2-isopropilidenhidrazono-(3 o 5-)tiazolidinil]acetilo, 2-[2-oxo-5-isopropilidenhidrazono-(3 o 4-)tiazolidinil]acetilo, 2-[2,4-di(isopropilidenhidrazono)-(3 o 5-)tiazolidinil]acetilo, 3-[2-metilidenhidrazono-(3, 4 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 2-[4-etilidenhidrazono-(2, 3 o 5-)tiazolidinil]propionilo, 4-[5-propilidenhidrazono-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]butirilo, 5-[2,5-di(isopropilidenhidrazono)-(3 o 4-)tiazolidinil]pentanoilo, 6-[2,4,5-tri(isopropilidenhidrazono)-3-tiazolidinil]hexanoilo, 2-[4,5-di(isopropilidenhidrazono)-(2 o 3-)tiazolidinil]acetilo, 2,2-dimetil-3-[4-butilidenhidrazono(2, 3 o 5-)tiazolidinil]-propionilo, 2-metil-3-[5-pentilideno-(2, 3 o 4-)tiazolidinil]propionilo y 2-(hexilidenhidrazono)-(3, 4 o 5-)tiazolidinilacetilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior el cual puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un átomo de halógeno incluyen, además de los grupos alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo lineales o ramificados que

tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxi y un átomo de halógeno tales como los grupos hidroximetilo, 2-hidroxietilo, 1-hidroxietilo, 3-hidroxipropilo, 2,3-dihidroxipropilo, 4-hidroxibutilo, 1,1-dimetil-2-hidroxietilo, 5,5,4-trihidroxipentilo, 5-hidroxipentilo, 6-hidroxihexilo, 1-hidroxiisopropilo, 2-metil-3-hidroxipropilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorometilo, bromometilo, fluorometilo, yodometilo, difluorometilo, dibromometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 4,4,4-triclorobutilo, 4-fluorobutilo, 5-cloropentilo, 3-cloro-2-metilpropilo, 5-bromohexilo, 5,6-dibromohexilo, 2-hidroxi-3-fluoropropilo y 2,2-dicloro-3-hidroxibutilo.

Los ejemplos del grupo carbamoilo el cual puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior y un grupo alquilo inferior incluyen grupos carbamoilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual tiene un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos carbamoilo, N-(2-metoxietil)carbamoilo,

metilcarbamoilo, etilcarbamoilo, propilcarbamoilo, isopropilcarbamoilo, butilcarbamoilo, terc-butilcarbamoilo, pentilcarbamoilo, hexilcarbamoilo, dimetilcarbamoilo, dietilcarbamoilo, dipropilcarbamoilo, dibutilcarbamoilo, dipentilcarbamoilo, dihexilcarbamoilo, N-metil-N-etilcarbamoilo, N-etil-N-propilcarbamoilo, N-metil-N-butilcarbamoilo, N-metil-N-hexilcarbamoilo, N-(metoximetil)carbamoilo, N-(3-propoxipropil)carbamoilo, N-(4-butoxibutil)carbamoilo, N-(4-etoxibutil)carbamoilo, N-(5-pentiloxipentil)carbamoilo, N-(5-metoxipentil)carbamoilo, N-(6-hexiloxihexil)carbamoilo, di(2-metoxietil)carbamoilo, N-(2-metoxietil)-N-metilcarbamoilo y N-(2-metoxietil)-N-etilcarbamoilo.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo carbamoilo el cual puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior y un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo ciano, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo benzoilo el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-

alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente en el anillo de fenilo y un grupo hidroxilo incluyen grupos fenilo los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo carbamoilo el cual puede tener 1 o 2 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxialquilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono; un grupo carboxi; un grupo ciano; un grupo fenilo; un átomo de halógeno; un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes; un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes; un grupo benzoilo el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes en el anillo de fenilo; un grupo fenilalquilo el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes en el anillo de fenilo y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo hidroxilo tales como los

grupos fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-butilfenilo, 4-pentilfenilo, 4-hexilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dietilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 2,3-dimetilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 3,4,5-trimetilfenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2-etoxifenilo, 3-etoxifenilo, 4-etoxifenilo, 4-isopropoxifenilo, 3-butoxifenilo, 4-pentiloxifenilo, 4-hexiloxifenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3,4-dietoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,5-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 3,4,5-trimetoxifenilo, 2-trifluorometoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 2-(bromometoxi)fenilo, 3-(2-cloroetoxi)fenilo, 4-(2,3-dicloropropoxi)fenilo, 4-(4-fluorobutoxi)fenilo, 3-(5-cloropentiloxi)fenilo, 4-(5-bromohexiloxi)fenilo, 4-(5,6-dibromohexiloxi)fenilo, 3,4-di(trifluorometoxi)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutoxi)-fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metoxipropil)fenilo, 2,5-di(3-cloropropoxi)fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetoxi)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometoxi)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetoxi)-fenilo, 2-metil-4-trifluorometoxifenilo, 3-etil-4-triclorometoxifenilo, 2-metoxi-4-trifluorometoxifenilo, 3-etoxi-4-triclorometoxifenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-(bromometil)fenilo, 3-(2-cloroetil)fenilo, 4-(2,3-

dicloropropil)fenilo, 4-(4-fluorobutil)fenilo, 3-(5-cloropentil)fenilo, 4-(5-bromohexil)fenilo, 4-(5,6-dibromohexil)fenilo, 3,4-di(trifluorometil)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)-fenilo, 2,5-di(3-cloropropil)fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)fenilo, 2-metil-4-trifluorometilfenilo, 3-etil-4-triclorometilfenilo, 2-metoxicarbonilfenilo, 3-metoxicarbonilfenilo, 4-metoxicarbonilfenilo, 2-etoxicarbonilfenilo, 3-etoxicarbonilfenilo, 4-etoxicarbonilfenilo, 4-isopropoxicarbonilfenilo, 3-butoxicarbonilfenilo, 4-terc-butoxicarbonilfenilo, 4-pentiloxicarbonilfenilo, 4-hexiloxicarbonilfenilo, 3,4-dimetoxicarbonilfenilo, 3,4-dietoxicarbonilfenilo, 2,4-dimetoxicarbonilfenilo, 2,5-dietoxicarbonilfenilo, 2,6-dimetoxicarbonilfenilo, 3,4,5-trietoxicarbonilfenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 3,4-dicianofenilo, 3,5-dicianofenilo, 2,4-dicianofenilo, 2,5-dicianofenilo, 2,6-dicianofenilo, 3,4,5-tricianofenilo, 2-fenilfenilo, 3-fenilfenilo, 4-fenilfenilo, 3,4-difenilfenilo, 3,5-difenilfenilo, 2,4-difenilfenilo, 2,5-difenilfenilo, 2,6-difenilfenilo, 3,4,5-trifenilfenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2-

fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,4-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2-bromofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, 2-yodofenilo, 3-yodofenilo, 4-yodofenilo, 2,3-dibromofenilo, 2,4-diyodofenilo, 2-hidroxifenilo, 3-hidroxifenilo, 4-hidroxifenilo, 3,4-dihidroxifenilo, 3,5-dihidroxifenilo, 2,4-dihidroxifenilo, 2,5-dihidroxifenilo, 2,6-dihidroxifenilo, 3,4,5-trihidroxifenilo, 3-bencilfenilo, 2-(2-feniletil)fenilo, 4-(1-feniletil)fenilo, 2-(3-fenilpropil)fenilo, 3-(4-fenilbutil)fenilo, 4-(5-fenilpentil)fenilo, 2-(6-fenilhexil)fenilo, 4-(1,1-dimetil-2-feniletil)fenilo, 3-(2-metil-3-fenilpropil)fenilo, 2-(4-fluorobencil)fenilo, 2-metil-5-clorofenilo, 2-metoxi-5-clorofenilo, 4-(4-fluorobenzoil)fenilo, 4-(4-fluorobencil)fenilo, 3-(2-clorobencil)fenilo, 4-(3-clorobencil)fenilo, 2-(4-clorobencil)fenilo, 3-[2-(4-fluorofenil)etil]fenilo, 4-[2-(4-clorofenil)etil]fenilo, 2-(3,4-dibromobencil)fenilo, 3-(3,4-diyodobencil)fenilo, 4-(2,4-difluorobencil)fenilo, 2-(2,5-diclorobencil)fenilo, 3-(2,6-diclorobencil)fenilo, 4-(3,4,5-trifluorobencil)fenilo, 2-[3-(4-clorofenil)propil]fenilo, 3-[1-(2-bromofenil)etil]-fenilo, 4-[4-(3-fluorofenil)butil]fenilo, 2-[5-(4-yodofenil)pentil]fenilo, 3-[6-(4-clorofenil)hexil]fenilo, 2-[1,1-dimetil-2-(3-fluorofenil)etil]fenilo, 4-[2-metil-3-(4-

clorofenil)propil]fenilo, 2,4-dibencilfenilo, 2,4,6-tribencilfenilo, 2-cloro-4-cianofenilo, 3-hidroxi-4-fenilfenilo, 3-etoxicarbonil-2-benzoilfenilo, 2-bencil-4-metil-6-metoxifenilo, 4-[(2-metoxietil)carbamoil]fenilo, 3-(N-etil-N-isopropilcarbamoil)fenilo, 4-dimetilcarbamoilfenilo, 2-carboxifenilo, 3-carboxifenilo y 4-carboxifenilo.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual tiene un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo incluyen grupos fenilo los cuales tienen un grupo alquilendioxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono como sustituyente en el anillo de fenilo tales como los grupos 3,4-metilendioxifenilo, 3,4-trimetilendioxifenilo, 2,3-etilendioxifenilo, 2,3-tetrametilendioxifenilo, 2,3-metilendioxifenilo, 3,4-etilendioxifenilo y 2,3-trimetilendioxifenilo.

Los ejemplos del grupo naftil-alquilo inferior incluyen grupos naftilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1 o 2-)naftilmetilo, 2-[(1 o 2-)naftil]etilo, 1-[(1 o 2-)naftil]etilo, 3-[(1 o 2-)naftil]propilo, 4-[(1 o 2-)naftil]butilo, 5-[(1 o 2-)naftil]pentilo, 6-[(1 o 2-)naftil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1 o 2-)naftil]etilo y 2-metil-3-[(1 o 2-)naftil]propilo.

Los ejemplos del grupo fenoxi el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos

seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente y un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen grupos fenoxi los cuales pueden ser sustituidos en el grupo fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos fenoxi, 2-metilfenoxi, 3-metilfenilo, 4-metilfenoxi, 2-etilfenoxi, 3-etilfenoxi, 4-etilfenoxi, 4-isopropilfenoxi, 3-butilfenoxi, 4-pentilfenoxi, 4-hexilfenoxi, 3,4-dimetilfenoxi, 3,4-dietilfenoxi, 2,4-dimetilfenoxi, 2,5-dimetilfenoxi, 2,6-dimetilfenoxi, 3,4,5-trimetilfenoxi, 2-metoxifenoxi, 3-metoxifenoxi, 4-metoxifenoxi, 2-etoxifenoxi, 3-etoxifenoxi, 4-etoxifenoxi, 4-isopropoxifenoxi, 3-butoxifenoxi, 4-pentiloxifenoxi, 4-hexiloxifenoxi, 3,4-dimetoxifenoxi, 3,4-dietoxifenoxi, 2,4-dimetoxifenoxi, 2,5-dimetoxifenoxi, 2,6-dimetoxifenoxi, 3,4,5-trimetoxifenoxi, 2-trifluorometoxifenoxi, 3-trifluorometoxifenoxi, 4-trifluorometoxifenoxi, 2-(bromometoxi)fenoxi, 3-(2-cloroetoxi)fenoxi, 4-(2,3-dicloropropoxi)fenoxi, 4-(4-fluorobutoxi)fenoxi, 3-(5-

cloropentiloxi)fenoxi, 4-(5-bromohexiloxi)fenoxi, 4-(5,6-dibromohexiloxi)fenoxi, 3,4-di(trifluorometoxi)fenoxi, 3,4-di(4,4,4-triclorobutoxi)fenoxi, 2,4-di(3-cloro-2-metoxipropil)fenoxi, 2,5-di(3-cloropropoxi)fenoxi, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetoxi)fenoxi, 3,4,5-tri(trifluorometoxi)-fenoxi, 4-(2,2,2-tricloroetoxi)fenoxi, 2-metil-4-trifluorometoxifenoxi, 3-etil-4-triclorometoxifenoxi, 2-metoxi-4-trifluorometoxifenoxi, 3-etoxi-4-triclorometoxi-fenoxi, 2-trifluorometilfenoxi, 3-trifluorometilfenoxi, 4-trifluorometilfenoxi, 2-(bromometil)fenoxi, 3-(2-cloroetil)fenoxi, 4-(2,3-dicloropropil)fenoxi, 4-(4-fluorobutil)fenoxi, 3-(5-cloropentil)fenoxi, 4-(5-bromohexil)fenoxi, 4-(5,6-dibromohexil)fenoxi, 3,4-di(trifluorometil)fenoxi, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)fenoxi, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)fenoxi, 2,5-di(3-cloropropil)-fenoxi, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)fenoxi, 3,4,5-tri(trifluorometil)fenoxi, 4-(2,2,2-tricloroetil)fenoxi, 2-metil-4-trifluorometilfenoxi, 3-etil-4-triclorometilfenoxi, 2-cianofenoxi, 3-cianofenoxi, 4-cianofenoxi, 3,4-dicianofenoxi, 3,5-dicianofenoxi, 2,3-dicianofenoxi, 2,4-dicianofenoxi, 2,5-dicianofenoxi, 2,6-dicianofenoxi, 3,4,5-tricianofenoxi, 2-ciano-4-metilfenoxi, 3-ciano-4-metoxifenoxi, 3-ciano-5-trifluorometilfenoxi y 4-ciano-3-trifluorometoxifenoxi.

Los ejemplos del grupo fenil-alcoxi inferior el

cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente y un grupo alcoxi inferior el cuales puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen, además de los grupos fenil-alcoxi inferior descritos anteriormente, grupos fenilalcoxi los cuales pueden ser sustituidos en el anillo de fenilo por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2,5-difluorobenciloxi, 2,4-difluorobenciloxi, 3,4-difluorobenciloxi, 3,5-difluorobenciloxi, 2,6-difluorobenciloxi, 3-trifluorometilbenciloxi, 2-trifluorometilbenciloxi, 4-trifluorometilbenciloxi, 3,4-dimetoxibenciloxi, 3,5-dimetoxibenciloxi, 2-clorobenciloxi, 3-clorobenciloxi, 4-clorobenciloxi, 2-metilbenciloxi, 3-metilbenciloxi, 4-metilbenciloxi, 3,4-dimetilbenciloxi, 2,3-dimetilbenciloxi, 2-metoxibenciloxi, 3-metoxibenciloxi, 4-metoxibenciloxi, 2,3-diclorobenciloxi, 2,4-diclorobenciloxi,

2,5-diclorobenciloxi, 3,4-diclorobenciloxi, 2,6-diclorobenciloxi, 4-fluorobenciloxi, 3-fluorobenciloxi, 2-fluorobenciloxi, 3-trifluorometoxibenciloxi, 4-trifluorometoxibenciloxi, 2-trifluorometoxibenciloxi, 4-terc-butilbenciloxi, 4-etilbenciloxi, 4-isopropilbenciloxi, 4-metoxi-3-clorobenciloxi, 2-(4-metoxifenil)etoxi, 2-(4-fluorofenil)etoxi, 2-(4-clorofenil)etoxi, 2-(3-metoxifenil)etoxi, 2-(4-metilfenil)etoxi, 3-metil-4-clorobenciloxi, 4-(4-metoxifenil)butoxi, 2-(4-metilfenil)etoxi, 4-terc-butoxibenciloxi, 3-cloro-6-metoxibenciloxi, 4-metoxi-3-metilbenciloxi, 2-(2-fluorofenil)etoxi, 1-(3-bromofenil)etoxi, 3-(4-yodofenil)propoxi, 4-(2-bromofenil)butoxi, 5-(3-clorofenil)pentiloxi, 6-(4-bromofenil)hexiloxi, 1,1-dimetil-2-(2,4-diclorofenil)etoxi, 2-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)-propoxi, 2-(2-etilfenil)etoxi, 1-(3-propilfenil)etoxi, 3-(4-butilfenil)propoxi, 4-(2-pentilfenil)butoxi, 5-(3-hexilfenil)pentiloxi, 6-(4-trifluorometilfenil)hexiloxi, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetilfenil)etoxi, 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometil)fenil]propoxi, 2-(2-etoxifenil)etoxi, 1-(3-propoxifenil)etoxi, 3-(4-butoxifenil)propoxi, 4-(2-pentiloxifenil)butoxi, 5-(3-hexiloxifenil)pentiloxi, 6-(4-trifluorometoxifenil)hexiloxi, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetoxifenil)etoxi y 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometoxi)-fenil]propoxi.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo el cual puede tener de 1 a 5 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno incluyen grupos alquilo sustituidos por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo los cuales pueden tener de 1 a 5 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftilmetilo, 2-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo, 1-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo, 3-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]propilo, 4-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]butilo, 5-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]pentilo, 6-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo, 2-metil-3-[(1, 2, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]propilo, 1,1,4,4-tetrametil(2, 3, 5 o 6-)1,2,3,4-tetrahidronaftilmetilo, 1,1,4,4,5-pentametil(2, 3, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftilmetilo, 1,4,4-trimetil(2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftilmetilo, 5,6-dimetil(2, 3, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftilmetilo, 2-[1-metil-(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo, 1-[2-etil-(1, 2, 3, 4, 5,

6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo, 3-[3-propil-(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]propilo, 4-[(4-butil-(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]butilo, 5-[5-pentil-(1, 2, 3, 4, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]pentilo, 6-[6-hexil-(1, 2, 3, 4, 5, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[1,7-dimetil-(1, 2, 3, 4, 5, 6 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]etilo y 2-metil-3-[1,1,4-trimetil-(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidronaftil]propilo.

Los ejemplos del grupo piperidinilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el anillo de piperidina incluyen grupos piperidinilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de piperidina tales como los grupos (1, 2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-metil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-etil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-propil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-isopropil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-butil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-isobutil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-terc-butil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-pentil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1-hexil-(2, 3 o 4-)piperidinilo, 1,2-dimetil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinilo y 1,2,6-trimetil-(3, 4 o 5-)piperidinilo.

Los ejemplos del grupo quinolil-alquilo inferior incluyen grupos quinolilalquilo cuya porción alquilo es un

grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)quinolilmetilo, 2-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)quinolil]etilo, 1-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)quinolil]etilo, 3-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)quinolil]propilo, 4-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)quinolil]butilo, 5-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)pentilo y 6-[(2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)hexilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de tetrazol, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior incluyen grupos 1,2,3,4-tetrazolilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y los cuales pueden tener, en el anillo de tetrazol, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo fenil-alquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como los grupos [(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]metilo, 2-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]etilo, 1-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]etilo, 3-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]propilo, 4-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]butilo, 5-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]pentilo, 6-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]hexilo, 5-[1-metil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]pentilo, 6-[1-metil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]-

hexilo, 5-metil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)metilo, 2-[5-etil-1-(1,2,3,4-tetrazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil)]etilo, 2-metil-3-[(1 o 5-)1,2,3,4-tetrazolil]propilo, [1-metil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, [1-etil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, 2-[1-propil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]etilo, 1-[1-butil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]etilo, 3-[1-pentil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]-propilo, 3-[5-propil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]propilo, 4-[5-butil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]butilo, 5-[5-pentil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]pentilo, 6-[5-hexil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]-hexilo, [1-etil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, [1-bencil-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, 1-[(2-feniletil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, 2-[1-(3-fenilpropil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]-etilo, 1-[1-(4-fenilbutil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]etilo, 3-[1-(5-fenilpentil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]propilo, 4-[1-(6-fenilhexil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]butilo, 5-[1-(1,1-dimetil-2-feniletil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]metilo, 6-[1-(2-metil-3-fenilpropil)-5-(1,2,3,4-tetrazolil)]hexilo, 5-bencil-1-(1,2,3,4-tetrazolil)-metilo, 2-[5-(1-feniletil)-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]etilo, 3-[5-(3-fenilpropil)-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]-propilo, 4-[5-(4-fenilbutil)-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]butilo, 5-[5-(5-fenilpentil)-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]pentilo y 6-[5-(6-fenilhexil)-1-(1,2,3,4-tetrazolil)]hexilo.

Los ejemplos del grupo tiazolil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo fenilo como sustituyente en el

anillo de tiazol incluyen grupos tiazolilalquilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos fenilo como sustituyentes en el anillo de tiazol y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2, 4 o 5-)tiazolil]metilo, 2-[(2, 4 o 5-)tiazolil]etilo, 1-[(2, 4 o 5-)tiazolil]etilo, 3-[(2, 4 o 5-)tiazolil]propilo, 4-[(2, 4 o 5-)tiazolil]butilo, 5-[(2, 4 o 5-)tiazolil]pentilo, 6-[(2, 4 o 5-)tiazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2, 4 o 5-)tiazolil]etilo, 2-metil-3-[(2, 4 o 5-)tiazolil]propilo, [2-fenil-(4 o 5-)tiazolil]metilo, 2-[4-fenil-(2 o 5-)tiazolil]etilo, 1-[5-fenil-(2 o 4-)tiazolil]etilo, 3-[2-fenil-(2 o 5-)tiazolil]propilo, 4-(2,4-difenil-5-tiazolil)butilo, 5-(2,5-difenil-4-tiazolil)-pentilo, 6-(4,5-difenil-2-tiazolil)hexilo, 1,1-dimetil-2-[2-fenil-(4 o 5-)tiazolil]etilo, 2-metil-3-[4-fenil-(2 o 5-)tiazolil]propilo, [4-fenil-(2 o 5-)tiazolil]metilo, [5-fenil-(2 o 4-)tiazolil]metilo, (2,4-difenil-5-tiazolil)metilo, (2,5-difenil-4-tiazolil)metilo y (4,5-difenil-2-tiazolil)metilo.

Los ejemplos del grupo benzoil-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un átomo de halógeno incluyen grupos benzoilalquilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que

consiste de un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un átomo de halógeno y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos benzoilmetilo, 2-benzoiletilo, 1-benzoiletilo, 3-benzoilpropilo, 4-benzoilbutilo, 5-benzoilpentilo, 6-benzoilhexilo, 1,1-dimetil-2-benzoiletilo, 2-metil-3-benzoilpropilo, 4-fluorobenzoilmetilo, 2-clorobenzoilmetilo, 3-clorobenzoilmetilo, 4-clorobenzoilmetilo, 2-(4-fluorobenzoil)etilo, 2-(4-clorobenzoil)etilo, 3,4-dibromobenzoilmetilo, 3,4-diyodobenzoilmetilo, 2,4-difluorobenzoilmetilo, 2,5-diclorobenzoilmetilo, 2,6-diclorobenzoilmetilo, 3,4,5-trifluorobenzoilmetilo, 3-(4-clorobenzoil)propilo, 1-(2-bromobenzoil)etilo, 4-(3-fluorobenzoil)butilo, 5-(4-yodobenzoil)pentilo, 6-(4-clorobenzoil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(3-fluorobenzoil)etilo, 2-metil-3-(4-clorobenzoil)propilo, 2-metoxibenzoilmetilo, 2-(3-metoxibenzoil)etilo, 2-(4-metoxibenzoil)etilo, 4-metoxibenzoilmetilo, 1-(2-etoxibenzoil)etilo, 3-(3-etoxibenzoil)propilo, 4-(4-etoxibenzoil)butilo, 5-(4-isopropoxibenzoil)pentilo, 6-(3-butoxibenzoil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-pentiloxibenzoil)etilo, 2-metil-3-(4-hexiloxibenzoil)propilo, 3,4-dimetoxibenzoilmetilo, 3,4-dietoxibenzoilmetilo, 2,4-dimetoxibenzoilmetilo, 2,5-dimetoxibenzoilmetilo, 2,6-dimetoxibenzoilmetilo, 3,4,5-

trimetoxibenzoilmetilo, 2-cloro-4-metoxibenzoilmetilo y 3-fluoro-5-etoxibenzoilmetilo.

Los ejemplos del grupo piperidinil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo alquilo inferior como sustituyente en el anillo de piperidina incluyen grupos piperidinilalquilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de piperidina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]metilo, 2-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]etilo, 1-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]etilo, 3-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]propilo, 4-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]butilo, 5-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]pentilo, 6-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]etilo, 2-metil-3-[(1, 2, 3 o 4-)piperidinil]propilo, [1-metil-(2, 3 o 4-)piperidinil]-metilo, 2-[1-etil-(2, 3 o 4-)piperidinil]etilo, 1-[4-propil-(1, 2 o 3-)piperidinil]etilo, 3-[3-isopropil-(1, 2, 4, 5 o 6-)piperidinil]propilo, 4-[2-butil-(1, 3, 4, 5 o 6-)piperidinil]butilo, 5-[1-isobutil-(2, 3 o 4-)piperidinil]-pentilo, 6-[1-terc-butil-(2, 3 o 4-)piperidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[4-pentil-(1, 2 o 3-)piperidinil]etilo, 2-metil-3-[1-hexil-(2, 3 o 4-)piperidinil]propilo, [1,2-dimetil-(3, 4, 5 o 6-)piperidinil]metilo y [1,2,6-trimetil-(3, 4 o

5-)piperidinil]metilo.

Los ejemplos del grupo imidazolilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos fenilo como sustituyentes en el anillo de imidazol incluyen grupos imidazolilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos fenilo como sustituyentes en el anillo de imidazol tales como los grupos (1, 2, 4 o 5-)imidazolilo, 1-fenil-(2, 4 o 5-)imidazolilo, 2-fenil-(1, 4 o 5-)imidazolilo, 4-fenil-(1, 2 o 5-)imidazolilo, 5-fenil-(1, 2 o 4-)imidazolilo, 1,2-difenil-(4 o 5-)imidazolilo, 2,4-difenil-(1 o 5-)imidazolilo, 4,5-difenil-(1 o 2-)imidazolilo, 2,5-difenil-(1 o 4-)imidazolilo y 2,4,5-trifenil-1-imidazolilo.

Los ejemplos del grupo bencimidazolilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como sustituyentes en el anillo de bencimidazol incluyen grupos bencimidazolilo los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de bencimidazol tales como los grupos (1, 2, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 1-metil-(2, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 2-etil-(1, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 4-propil-(1, 2, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 5-butil-(1, 2, 4, 6 o 7-)bencimidazolilo, 6-pentil-(1, 2, 4, 5 o 7-)bencimidazolilo, 7-hexil-(1, 2, 4, 5 o 6-)bencimidazolilo, 1-etil-(2, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolil]hexilo, 1-butil-(2, 4, 5, 6 o

7-)bencimidazolilo, 1-isopropil-(1, 2, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 1,2-dimetil-(4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 1-metil-4-etil-(2, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo, 1-propil-5-metil-(2, 4, 6 o 7-)bencimidazolilo y 1,2,5-trimetil-(2, 4, 5, 6 o 7-)bencimidazolilo.

Los ejemplos del grupo piridil-alcoxi inferior incluyen grupos piridilalcoxi cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2, 3 o 4-)piridilmetoxi, 2-[(2, 3 o 4-)piridil]etoxi, 1-[(2, 3 o 4-)piridil]etoxi, 3-[(2, 3 o 4-)piridil]propoxi, 4-[(2, 3 o 4-)piridil]butoxi, 1-1-dimetil-2-[(2, 3 o 4-)piridil]etoxi, 5-[(2, 3 o 4-)piridil]pentiloxi, 6-[(2, 3 o 4-)piridil]hexiloxi, 1-[(2, 3 o 4-)piridil]isopropoxi y 2-metil-3-[(2, 3 o 4-)piridil]-propoxi.

Los ejemplos del grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina incluyen grupos 1,2,3,4-tetrahidroquinolilalquilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tetrahidroquinolina y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilmetilo, 2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]etilo, 1-[(1, 2, 3, 4, 5, 6,

7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]etilo, 3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]propilo, 4-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]butilo, 5-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]pentilo, 6-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]etilo, 2-metil-3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]propilo, [2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]metilo, [4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]metilo, [2,4-dioxo-(1, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]metilo, 2-[2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]etilo, 3-[4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]propilo, 4-[2,4-dioxo-(1, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]butilo, 5-[2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]pentilo y 6-[4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]hexilo.

Los ejemplos del grupo 1,3,4-oxadiazolil-alquilo inferior el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de 1,3,4-oxadiazol incluyen grupos 1,3,4-oxadiazolilalquilo los cuales pueden tener un grupo oxo como sustituyente en al anillo de 1,3,4-oxadiazol y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2 o 5-)1,3,4-oxadiazolilmetilo, 2-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]etilo, 1-[(2

o 5-)1,3,4-oxadiazolil]etilo, 3-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]propilo, 4-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]butilo, 5-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]pentilo, 6-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]etilo, 2-metil-3-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]propilo, 2-oxo-[(3 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]metilo, 5-oxo-[(2 o 3-)1,3,4-oxadiazolil]metilo, 2-[2-oxo-(3 o 5-)(1,3,4-oxadiazolil)]etilo, 1-[5-oxo-(2 o 3-)1,3,4-oxadiazolil]etilo, 3-[(2 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]propilo, 4-[2-oxo(3 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]butilo, 5-[5-oxo(2 o 3-)1,3,4-oxadiazolil]pentilo, 6-[2-oxo(3 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[5-oxo(2 o 3-)1,3,4-oxadiazolil]etilo y 2-metil-3-[2-oxo(3 o 5-)1,3,4-oxadiazolil]propilo.

Los ejemplos del grupo tienil-alquilo inferior incluyen grupos tienilalquilo cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos (2 o 3-)tienilmetilo, 2-[(2 o 3-)tienil]etilo, 1-[(2 o 3-)tienil]etilo, 3-[(2 o 3-)tienil]-propilo, 4-[(2 o 3-)tienil]butilo, 5-[(2 o 3-)tienil]pentilo, 6-[(2 o 3-)tienil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2 o 3-)tienil]etilo y 2-metil-3-[(2 o 3-)tienil]propilo.

Los ejemplos del grupo pirimidinilcarbonilo el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de pirimidina incluyen grupos pirimidinilcarbonilo los cuales

pueden tener de 1 a 3 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de pirimidina tales como los grupos (2, 3, 4 o 6-)pirimidinilcarbonilo, 2,6-dioxo-(1, 3, 4 o 5-)pirimidinil-carbonilo, 2-oxo-(1, 3, 4, 5 o 6-)pirimidinilcarbonilo, 6-oxo-(1, 2, 3, 4 o 5-)pirimidinilcarbonilo, 4-oxo-(1, 2, 3, 5 o 6-)pirimidinilcarbonilo, 2,4-dioxo-(1, 3, 4 o 6-)pirimidinilcarbonilo y 2,4,6-trioxo-(1, 3 o 5-)pirimidinilcarbonilo.

Los ejemplos del grupo alcoxi inferior-alcoxi inferior incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyente tales como los grupos metoximetoxi, 1-etoxietoxi, 2-metoxietoxi, 2-propoxietoxi, 3-isopropoxipropoxi, 4-butoxibutoxi, 5-pentiloxipentiloxi, 6-hexiloxihexiloxi, 1,1-dimetil-2-metoxietoxi, 2-metil-3-etoxipropoxi y 3-metoxipropoxi.

Los ejemplos del grupo alcoxicarbonilo inferior-alcoxi inferior incluyen grupos alcoxicarbonilalcoxi cuyas dos porciones alcoxi son grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos metoxicarbonilmetoxi, etoxicarbonilmetoxi, 2-metoxicarboniletoxi, 2-etoxicarboniletoxi, 1-etoxicarboniletoxi, 3-metoxicarbonilpropoxi, 3-etoxicarbonilpropoxi, 4-etoxicarbonilbutoxi, 5-

isopropoxicarbonilpentiloxi, 6-propoxicarbonilhexiloxi, 1,1-dimetil-2-butoxicarboniletoxi, 2-metil-3-terc-butoxicarbonil-propoxi, 2-pentiloxicarboniletoxi y hexiloxicarbonilmetoxi.

Los ejemplos del grupo carboxi-alcoxi inferior incluyen grupos carboxialcoxi cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos carboximetoxi, 2-carboxietoxi, 1-carboxietoxi, 3-carboxipropoxi, 4-carboxibutoxi, 5-carboxipentiloxi, 6-carboxihexiloxi, 1,1-dimetil-2-carboxietoxi y 2-metil-3-carboxipropoxi.

Los ejemplos del grupo fenoxi-alcanoilo inferior incluyen grupos fenoxialcanoilo cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-fenoxiacetilo, 3-fenoxipropionilo, 2-fenoxipropionilo, 4-fenoxibutirilo, 5-fenoxipentanoilo, 6-fenoxihexanoilo, 2,2-dimetil-2-fenoxipropionilo y 2-metil-3-fenoxipropionilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilcarbonilo el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina incluyen grupos 1,2,3,4-tetrahidroquinolilcarbonilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tetrahidroquinolina tales como los grupos [(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]carbonilo, [2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]carbonilo,

[4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]-carbonilo y [2,4-dioxo-(1, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolil]carbonilo.

Los ejemplos del grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo el cual puede tener un grupo oxo como sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina incluyen grupos 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo los cuales pueden tener 1 o 2 grupos oxo como sustituyentes en el anillo de tetrahidroquinolina tales como los grupos (1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 2-oxo-(1, 3, 4, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo, 4-oxo-(1, 2, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo y 2,4-dioxo-(1, 3, 5, 6, 7 u 8-)1,2,3,4-tetrahidroquinolilo.

Los ejemplos del grupo amino el cual puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior como sustituyente incluyen grupos amino los cuales pueden tener un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos amino, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, propoxicarbonilamino, isopropoxicarbonilamino, butoxicarbonil-amino, terc-butoxicarbonilamino, pentiloxicarbonilamino y hexiloxicarbonilamino.

Los ejemplos del grupo benzoilo el cual puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como sustituyentes en el anillo de fenilo incluyen grupos benzoilo los cuales pueden

tener de 1 a 3 grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes en el anillo de fenilo tales como los grupos benzoilo, 2-metoxibenzoilo, 3-metoxibenzoilo, 4-metoxibenzoilo, 2-etoxibenzoilo, 3-etoxibenzoilo, 4-etoxibenzoilo, 4-isopropoxibenzoilo, 3-butoxibenzoilo, 4-pentiloxibenzoilo, 4-hexiloxibenzoilo, 3,4-dimetoxibenzoilo, 3,4-dietoxibenzoilo, 2,4-dimetoxibenzoilo, 2,5-dimetoxibenzoilo, 2,6-dimetoxibenzoilo y 3,4,5-trimetoxibenzoilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior el cual tiene 1 o 2 grupos fenilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente y un grupo alquiltio inferior incluyen, además de los grupos fenil-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos alquilo lineales o ramificados los vuales tienen de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 2 grupos fenilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo cuya porción alcoxi es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo

ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 1,1-difenilmetilo, 1,1-di(4-fluorofenil)metilo, 1-fenil-1-(4-metoxifenil)metilo, 3,3-difenilpropilo, 2,5-difluorobencilo, 2,4-difluorobencilo, 3,4-difluorobencilo, 3,5-difluorobencilo, 2,6-difluorobencilo, 3-trifluorometilbencilo, 2-trifluorometilbencilo, 4-trifluorometilbencilo, 3,4-dimetoxibencilo, 3,5-dimetoxibencilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo, 4-clorobencilo, 2-metilbencilo, 3-metilbencilo, 4-metilbencilo, 3,4-dimetilbencilo, 2,3-dimetilbencilo, 2-metoxibencilo, 3-metoxibencilo, 4-cianobencilo, 2-cianobencilo, 3-cianobencilo, 4-metoxibencilo, 2,3-diclorobencilo, 2,4-diclorobencilo, 2,5-diclorobencilo, 3,4-diclorobencilo, 2,6-diclorobencilo, 4-fluorobencilo, 3-fluorobencilo, 2-fluorobencilo, 4-nitrobencilo, 3-nitrobencilo, 2-nitrobencilo, 3-trifluorometoxibencilo, 4-trifluorometoxibencilo, 2-trifluorometoxibencilo, 4-metoxicarbonilbencilo, 3-metoxicarbonilbencilo, 4-terc-butilbencilo, 4-etilbencilo, 4-isopropilbencilo, 4-metoxi-3-

clorobencilo, 2-(4-metoxifenil)etilo, 2-(4-fluorofenil)etilo, 2-(4-clorofenil)etilo, 2-(3-metoxifenil)etilo, 2-(4-metilfenil)etilo, 4-fenilbencilo, 3,3-difenilpropilo, 3-metil-4-nitrobencilo, 4-(4-metoxifenil)butilo, 2-(4-metilfenil)etilo, 4-terc-butoxicarbonilbencilo, 3-cloro-6-metoxibencilo, 4-nitro-3-metilbencilo, 4-terc-butirilbencilo, 2-(2-etoxicarbonilfenil)etilo, 1-(3-propoxicarbonilfenil)-etilo, 3-(4-pentiloxicarbonilfenil)propilo, 4-(3-hexiloxicarbonilfenil)butilo, 5-(3,4-dimetoxicarbonilfenil)-pentilo, 6-(3,4,5-dietoxicarbonilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(4-butoxicarbonilfenil)etilo, 2-metil-3-(4-metoxicarbonilfenil)propilo, 2-(2-cianofenil)etilo, 1-(3-cianofenil)etilo, 3-(4-cianofenil)propilo, 4-(2-cianofenil)butilo, 5-(3-cianofenil)pentilo, 6-(4-cianofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dicianofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-tricianofenil)propilo, 2-(2-nitrofenil)etilo, 1-(3-nitrofenil)etilo, 3-(4-nitrofenil)propilo, 4-(2-nitrofenil)butilo, 5-(3-nitrofenil)pentilo, 6-(4-nitrofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dinitrofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trinitrofenil)propilo, 2-(2-fenilfenil)etilo, 1-(3-fenilfenil)etilo, 3-(4-fenilfenil)propilo, 4-(2-fenilfenil)butilo, 5-(3-fenilfenil)pentilo, 6-(4-fenilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-difenilfenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trifenilfenil)propilo, 2-(2-fluorofenil)etilo, 1-(3-bromofenil)etilo, 3-(4-yodofenil)propilo, 4-(2-

bromofenil)butilo, 5-(3-clorofenil)pentilo, 6-(4-bromofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-diclorofenil)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trifluorofenil)propilo, 2-(2-etilfenil)etilo, 1-(3-propilfenil)etilo, 3-(4-butilfenil)propilo, 4-(2-pentilfenil)butilo, 5-(3-hexilfenil)pentilo, 6-(4-trifluorometilfenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetilfenil)-etilo, 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometil)fenil]propilo, 2-(2-etoxifenil)etilo, 1-(3-propoxifenil)etilo, 3-(4-butoxifenil)propilo, 4-(2-pentiloxifenil)butilo, 5-(3-hexiloxifenil)pentilo, 6-(4-trifluorometoxifenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetoxifenil)etilo, 2-metil-3-[2,4,6-tri(trifluorometoxi)fenil]propilo, 2-metiltiobencilo, 3-metiltiobencilo, 4-metiltiobencilo, 3,4-dimetiltiobencilo, 2,3-dimetiltiobencilo, 2-(2-etiltiofenil)etilo, 2-(4-metiltiofenil)etilo, 1-(3-propiltiofenil)etilo, 3-(4-butiltiofenil)propilo, 4-(2-pentiltiofenil)butilo, 5-(3-hexiltiofenil)pentilo, 6-(4-metiltiofenil)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetiltiofenil)etilo, 2-metil-3-[2,4,6-trimetiltiofenil]propilo, 2-metil-4-cianobencilo, 3-etoxi-4-etoxicarbonilbencilo, 4-fenil-3-nitrobencilo, 3-fluoro-4-metoxibencilo, 4-trifluorometil-3-cianobencilo y 3-trifluorometoxi-3-fluorobencilo.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior el cual puede

tener un átomo de halógeno como sustituyente y un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente incluyen grupos fenilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno como sustituyentes tales como los grupos fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-butilfenilo, 4-pentilfenilo, 4-hexilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dietilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 3,4,5-trimetilfenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2-etoxifenilo, 3-etoxifenilo, 4-etoxifenilo, 4-isopropoxifenilo, 3-butoxifenilo, 4-pentiloxifenilo, 4-hexiloxifenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3,4-dietoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,5-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 3,4,5-trimetoxifenilo, 2-trifluorometoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 2-(bromometoxi)fenilo, 3-(2-cloroetoxi)fenilo, 4-(2,3-dicloropropoxi)fenilo, 4-(4-fluorobutoxi)fenilo, 3-(5-cloropentiloxi)fenilo, 4-(5-bromohexiloxi)fenilo, 4-(5,6-dibromohexiloxi)fenilo, 3,4-di(trifluorometoxi)fenilo, 3,4-

di(4,4,4-triclorobutoxi)fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metoxipropil)-fenilo, 2,5-di(3-cloropropoxi)fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetoxi)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometoxi)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetoxi)fenilo, 2-metil-4-trifluorometoxifenilo, 3-etil-4-triclorometoxifenilo, 2-metoxi-4-trifluoro-metoxifenilo, 3-etoxi-4-triclorometoxifenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-(bromometil)fenilo, 3-(2-cloroetil)fenilo, 4-(2,3-dicloropropil)fenilo, 4-(4-fluorobutil)fenilo, 3-(5-cloropentil)fenilo, 4-(5-bromohexil)fenilo, 4-(5,6-dibromohexil)fenilo, 3,4-di(trifluorometil)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)fenilo, 2,5-di(3-cloropropil)-fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)fenilo, 2-metil-4-trifluorometilfenilo y 3-etil-4-triclorometilfenilo.

Los ejemplos del grupo pirrolidinil-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de pirrolidina, de 1 a 3 grupos alquilo inferior los cuales pueden tener un grupo hidroxilo como sustituyente incluyen grupos pirrolidinilalquilo los cuales pueden tener, en el anillo de pirrolidina, de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono los cuales pueden tener de 1 a 3 grupos hidroxilo como sustituyentes y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de

1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(1, 2 o 3-)pirrolidinil]metilo, 2-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]etilo, 1-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]etilo, 3-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]-propilo, 4-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]butilo, 5-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]pentilo, 6-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]etilo, 2-metil-3-[(1, 2 o 3-)pirrolidinil]propilo, [1-metil-(2 o 3-)pirrolidinil]metilo, 2-[2-etil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 1-[3-propil-(1, 2, 4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 3-[1-butil-(2 o 3-)pirrolidinil]-propilo, 4-[2-pentil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]butilo, 5-[3-hexil-(1, 2, 4 o 5-)pirrolidinil]pentilo, 6-[1,2-dimetil-(3, 4 o 5-)pirrolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[1,2,3-trimetil-(4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 2-metil-3-[1-etil-2-metil-(3, 4 o 5-)pirrolidinil]propilo, [1-(2-hidroxietil)-(2 o 3-)pirrolidinil]metilo, [2-hidroximetil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]metilo, 2-[2-hidroximetil-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 1-[3-(3-hidroxipropil)-(1, 2, 4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 3-[1-(4-hidroxibutil)-(2 o 3-)pirrolidinil]propilo, 4-[2-(5-hidroxipentil)-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]butilo, 5-[3-(6-hidroxihexil)-(1, 2, 4 o 5-)pirrolidinil]pentilo, 6-[1,2-dihidroximetil-(3, 4 o 5-)pirrolidinil]hexilo, 1,1-dimetil-2-[1,2,3-trihidroximetil-(4 o 5-)pirrolidinil]etilo, 2-metil-3-[2-(1,2-hidroxietil)-

trihidroxibutil)-(1, 3, 4 o 5-)pirrolidinil]metilo.

Los ejemplos del grupo alquilo inferior sustituido por amino el cual puede tener un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo fenilo y un grupo alquilo inferior incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos por un grupo amino el cual puede tener 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenilo y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos aminometilo, 2-aminometilo, 1-aminoetilo, 3-aminopropilo, 4-aminobutilo, 5-aminopentilo, 6-aminohexilo, 1,1-dimetil-2-aminoetilo, N,N-dietil-2-aminoetilo, 2-metil-3-aminopropilo, metilaminometilo, 1-etilaminoetilo, 2-propilaminoetilo, 3-isopropilaminopropilo, 4-butilaminobutilo, 5-pentilaminopentilo, 6-hexilaminohexilo, dimetilaminometilo, 2-diisopropilaminoetilo, (N-etil-N-propilamino)metilo, 2-(N-metil-N-hexilamino)etilo, fenilaminometilo, 1-fenilaminoetilo, 2-fenilaminoetilo, 3-fenilaminopropilo, 4-fenilaminobutilo, 5-fenilaminopentilo, 6-fenilaminohexilo, N-metil-N-fenilaminometilo, 2-(N-etil-N-fenilamino)etilo, (N-etil-N-fenilamino)metilo y 2-(N-metil-N-fenilamino)etilo.

Los ejemplos del grupo tetrahidrofuril-alquilo inferior el cual puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente en el grupo alquilo inferior incluyen grupos

tetrahidrofurilalquilo los cuales pueden tener un grupo hidroxilo como sustituyente en el grupo alquilo inferior y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos [(2 o 3-)tetrahidrofuril]metilo, 2-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]-etilo, 1-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]etilo, 3-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]propilo, 4-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]-butilo, 5-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]pentilo, 6-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]hexilo, 1,1-dimetil-2-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]etilo, 2-metil-3-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]-propilo, 1-hidroxi-1-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]metilo, 2-hidroxi-2-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]etilo, 2-hidroxi-1-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]etilo, 3-hidroxi-3-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]-propilo, 4-hidroxi-4-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]butilo, 5-hidroxi-5-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]pentilo, 6-hidroxi-6-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]hexilo, 2-hidroxi-1,1-dimetil-2-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]etilo y 3-hidroxi-2-metil-3-[(2 o 3-)tetrahidrofuril]propilo.

Los ejemplos del grupo fenoxi-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo nitro incluyen, además de los grupos fenoxi-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos fenoxialquilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que

consiste de un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono y un grupo nitro y cuya porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-metilfenoximetilo, 3-metilfenoximetilo, 4-metilfenoximetilo, 3,4-dimetilfenoximetilo, 2,3-dimetilfenoximetilo, 3,4,5-trimetilfenoximetilo, 2-(2-etilfenoxi)etilo, 2-(3-metilfenoxi)etilo, 2-(4-metilfenoxi)etilo, 1-(3-propilfenoxi)etilo, 3-(4-butilfenoxi)propilo, 4-(2-pentilfenoxi)butilo, 5-(3-hexilfenoxi)pentilo, 6-(4-metilfenoxi)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2, 4-dimetilfenoxi)etilo, 2-metil-3-(2,4,6-trimetilfenoxi)propilo, 2-(4-nitro-3-metilfenoxi)etilo, 4-nitrofenoximetilo, 3-nitrofenoximetilo, 2-nitrofenoximetilo, 2-(2-nitrofenoxi)etilo, 2-(4-nitrofenoxi)etilo, 1-(3-nitrofenoxi)etilo, 3-(4-nitrofenoxi)-propilo, 4-(2-nitrofenoxi)butilo, 5-(3-nitrofenoxi)pentilo, 6-(4-nitrofenoxi)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dinitrofenoxi)-etilo y 2-metil-3-(2,4,6-trinitrofenoxi)propilo.

Los ejemplos del grupo fenil-alcanoilo inferior incluyen grupos fenilalcanoilo cuya porción alcanoilo es un grupo alcanoilo lineal o ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-fenilacetilo, 3-fenilpropionilo, 2-fenilpropionilo, 4-fenilbutirilo, 5-fenilpentanoilo, 6-fenilhexanoilo, 2,2-dimetil-3-fenilpropionilo y 2-metil-3-fenilpropionilo.

Los ejemplos del grupo fenilo el cual puede tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno incluyen grupos fenilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno y un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono el cual puede tener de 1 a 3 átomos de halógeno tales como los grupos fenilo, 3,4-difluorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-bromofenilo, 4-yodofenilo, 4-metilfenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 2-etilfenilo, 3-etilfenilo, 4-etilfenilo, 4-isopropilfenilo, 3-butilfenilo, 4-pentilfenilo, 4-hexilfenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dietilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 2,5-dimetilfenilo, 2,6-dimetilfenilo, 3,4,5-trimetilfenilo, 2-trifluorometilfenilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-(bromometil)fenilo, 3-(2-cloroetil)fenilo, 4-(2,3-dicloropropil)fenilo, 4-(4-fluorobutil)fenilo, 3-(5-cloropentil)fenilo, 4-(5-bromohexil)fenilo, 4-(5,6-dibromohexil)fenilo, 3,4-di(trifluorometil)fenilo, 3,4-di(4,4,4-triclorobutil)fenilo, 2,4-di(3-cloro-2-metilpropil)-fenilo, 2,5-di(3-cloropropil)-fenilo, 2,6-di(2,2,2-trifluoroetil)fenilo, 3,4,5-tri(trifluorometil)fenilo, 4-(2,2,2-tricloroetil)fenilo, 2-metil-4-trifluorometilfenilo, 3-etil-4-triclorometilfenilo,

2-cloro-4-trifluorometilfenilo, 3-etil-4-fluorofenilo, 3-fluoro-4-triclorometilfenilo, 2-metil-3-trifluorometil-4-trifluorometilfenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-bromofenilo, 4-bromofenilo, 2-yodofenilo, 3-yodofenilo, 2,3-dibromofenilo, 2,4-diyodofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,4-difluorofenilo, 3,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo y 2,4-difluorofenilo.

Los ejemplos del grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros formado al unir mutuamente $R^{20}$ y $R^{21}$, $R^{22}$ y $R^{23}$, $R^{26}$ y $R^{27}$, $R^{29}$ y $R^{30}$ o $R^{32}$ y $R^{33}$ junto con los átomos de nitrógeno unidos a ellos, a través o no a través de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, incluyen grupos pirrolidinilo, piperidinilo, piperazinilo, morfolino, tiomorfolino y homopiperazinilo.

Los ejemplos del grupo fenoxi-alquilo inferior el cual puede tener, en el anillo de fenilo, un grupo alquilo inferior como un sustituyente incluyen, además de los grupos fenoxi-alquilo inferior descritos anteriormente, grupos fenoxialquilo los cuales pueden tener, en el anillo de fenilo, de 1 a 3 grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono como sustituyentes y cuya

porción alquilo es un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tales como los grupos 2-metilfenoximetilo, 3-metilfenoximetilo, 4-metilfenoximetilo, 3,4-dimetilfenoximetilo, 2,3-dimetilfenoximetilo, 3,4,5-trimetilfenoximetilo, 2-(2-etilfenoxi)etilo, 2-(4-metilfenoxi)etilo, 1-(3-propilfenoxi)etilo, 3-(4-butilfenoxi)propilo, 4-(2-pentilfenoxi)butilo, 5-(3-hexilfenoxi)pentilo, 6-(4-metilfenoxi)hexilo, 1,1-dimetil-2-(2,4-dimetilfenoxi)etilo y 2-metil-3-(2,4,6-trimetilfenoxi)-propilo.

Se prefiere más un compuesto representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo, en donde

$X_1$ representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CH=,

$R^1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$, un grupo $-B-N(R^8)-$, un grupo $-B_0-O-$ o un grupo $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior o un grupo fenil-alquilo inferior,

B representa un grupo -CO- o un grupo alquileno inferior,

$B_0$ representa un grupo alquileno inferior,

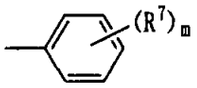
$R^{9a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{9b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo

inferior,

$R^6$ representa un grupo

[Fórmula 58]



$R^7$ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

m representa un número entero de 1 o 2 (cuando m representa 2, dos $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

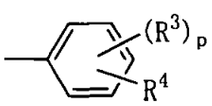
$R^2$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior,

Y representa un grupo -O- o un grupo $-N(R^5)-$,

$R^5$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

A representa un grupo

[Fórmula 59]



p representa 1 o 2,

$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

$R^4$ representa un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$,

T representa un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$, un grupo $-B_4-CO-$ o un grupo $-CO-$,

$R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_4$ representa un grupo alquenileno inferior o un grupo alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente,

l representa 0 o 1,

$R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente,

$R^{15}$ representa (36a) un grupo oxalilo sustituido por piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenil-alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior como sustituyente(s) en el anillo de fenilo) y un grupo piridil-alquilo inferior como sustituyente(s) en el anillo de piperazina,

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, forman un grupo heterocíclico el cual es un grupo piperidinilo o piperazinilo,

en donde el anillo heterocíclico puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de (28) un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo que puede ser

sustituido por un grupo, en el anillo de fenilo, seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior (49) un grupo $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$ o (84) un grupo $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$,

$B_{12}$ representa un grupo alquileno inferior,

t representa 0 o 1,

$R^{20}$ y $R^{21}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, forman un grupo heterocíclico saturado el cual es un grupo piperidinilo o piperazinilo que, en el anillo heterocíclico, puede ser sustituido por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo,

$B_{15}$ representa un grupo alquileno inferior,

s representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{27}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo imidazolil-alquilo inferior y $R^{26}$ y $R^{27}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual

se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde el anillo heterocíclico puede ser sustituido por 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior en el anillo de fenilo).

Por ejemplo, se prefiere además un compuesto representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo, en donde

$X_1$ representa un átomo de nitrógeno,

$R^1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

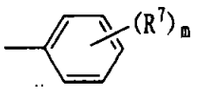
Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente,

B representa un grupo -CO-,

$R^6$ representa un grupo

[Fórmula 60]



$R^7$ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

m representa un número entero de 1 o 2 (cuando m representa

2, dos $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

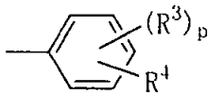
$R^2$ representa un átomo de hidrógeno,

Y representa un grupo -O- o un grupo $-N(R^5)-$,

$R^5$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

A representa un grupo

[Fórmula 61]



p representa 1 o 2,

$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

$R^4$ representa un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$,

T representa un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$, un grupo $-B_4-CO-$ o un grupo -CO-,

$R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_4$ representa un grupo alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente,

l representa 0 o 1,

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, forman un grupo heterocíclico el cual es un grupo

piperidinilo o piperazinilo que, en el anillo heterocíclico, puede ser sustituido por (28) un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo que puede ser sustituido por un grupo alquilendioxi inferior en el anillo de fenilo.

Otro ejemplo más preferido es un compuesto representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo, en donde

$X_1$ representa un átomo de nitrógeno,

$R^1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

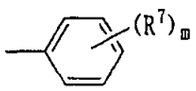
Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como sustituyente,

B representa un grupo $-CO-$,

$R^6$ representa un grupo

[Fórmula 62]



$R^7$ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

m representa un número entero de 1 o 2 (cuando m representa 2, dos $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

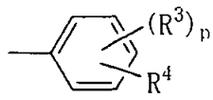
$R^2$ representa un átomo de hidrógeno,

Y representa un grupo $-O-$ o un grupo $-N(R^5)-$,

$R^5$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

A representa un grupo

[Fórmula 63]



p representa 1 o 2,

$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como sustituyente,

$R^4$ representa un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$,

$R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_4$ representa un grupo alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como sustituyente,

1 representa 0,

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, forman un grupo heterocíclico el cual es un grupo piperidinilo o piperazinilo

en donde, en el anillo heterocíclico, puede estar presente un sustituyente el cual se selecciona del grupo que consiste de (49) un grupo $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$ y (84) un grupo $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$,

$B_{12}$ representa un grupo alquileno inferior,

t representa 0 o 1,

$R^{20}$ y $R^{21}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, forman un grupo heterocíclico saturado el cual es piperazina o piperidina

en donde, en el anillo heterocíclico, puede estar presente un sustituyente el cual es un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo,

$B_{15}$ representa un grupo alquileno inferior,

s representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{27}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, uno al otro, directamente o por vía de un átomo de oxígeno o átomo de nitrógeno para formar un anillo heterocíclico saturado de 6 miembros (en donde el anillo heterocíclico puede ser sustituido por 1 a 3 grupos fenilalquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior como sustituyente en el anillo de fenilo).

El compuesto aromático (1) o una sal del mismo contenido en el inhibidor de la activación de STAT3/5 de la presente invención incluye un estereoisómero, isómero óptico y solvato (hidrato, etanolato, etcétera).

De los compuestos aromáticos (1), un compuesto que tiene un grupo básico se puede hacer reaccionar fácilmente con un ácido convencional farmacológicamente aceptable para

formar una sal. Los ejemplos de este ácido incluyen ácidos minerales tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico y ácido fosfórico y ácidos orgánicos tales como ácido metanosulfónico, ácido p-toluensulfónico, ácido acético, ácido cítrico, ácido tartárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido malónico y ácido láctico.

De los compuestos aromáticos (1), un compuesto que tiene un grupo ácido se puede hacer reaccionar fácilmente con un compuesto básico, convencional, farmacológicamente aceptable para formar una sal. Los ejemplos de esta sal incluyen una sal de sodio, una sal de potasio y una sal de calcio.

El compuesto aromático (1) o una sal del mismo se puede preparar de la misma manera que en el documento WO2006/014012.

A continuación se describirá una formulación médica que contiene el compuesto aromático (1) o una sal del mismo como un ingrediente activo.

La formulación médica se obtiene al formular el compuesto aromático (1) o una sal del mismo en la forma de una preparación farmacéutica, y más específicamente, se prepara usando un diluyente o un excipiente tal como un material de relleno, expansor, sustancia aglutinante, humectante, desintegrante, agente tensoactivo o

lubricante.

La forma de esta formulación medicinal puede seleccionarse de varias formas dependiendo del propósito terapéutico y las formas típicas incluyen tabletas, píldoras, polvos, líquidos, suspensiones, emulsiones, gránulos, cápsulas, supositorios e inyecciones (líquidos, suspensiones).

El portador a ser utilizado para formar las tabletas puede seleccionarse ampliamente de los portadores conocidos convencionalmente. Los ejemplos del portador incluyen excipientes tales como lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, urea, almidón, carbonato de calcio, kaolín y celulosa cristalina, sustancias aglutinantes tales como agua, etanol, propanol, jarabe simple, una solución de glucosa, una solución de almidón, una solución de gelatina, carboximetilcelulosa, goma laca, metilcelulosa, fosfato de potasio y polivinilpirrolidona, desintegrantes tales como almidón seco, arginato de sodio, agar en polvo, laminarán en polvo, bicarbonato de sodio, carbonato de calcio, éster de ácido graso de polioxietilensorbitán, laurilsulfato de sodio, monoglicérido de ácido esteárico, almidón y lactosa, anti-desintegrantes tales como sacarosa, estearina, manteca de cacao y aceite hidrogenado, factores de absorción tales como base de amonio cuaternario y laurilsulfato de sodio, agentes humectantes tales como glicerol y almidón,

adsorbentes tales como almidón, lactosa, kaolín, bentonita y silicato coloidal y lubricantes tales como talco purificado, estearato, ácido bórico en polvo y polietilenglicol.

Además, las tabletas pueden ser recubiertas de una manera convencional según se requiera. Los ejemplos de tabletas recubiertas incluyen tabletas recubiertas con azúcar, tabletas recubiertas con gelatina, tabletas con recubrimiento entérico, tabletas recubiertas con película o tabletas de doble o de varias capas.

Los portadores a ser utilizados para formar píldoras pueden seleccionarse ampliamente de los portadores conocidos convencionalmente. Los ejemplos del portador incluyen excipientes tales como glucosa, lactosa, almidón, manteca de cacao, aceite vegetal hidrogenado, caolín y talco, sustancias aglutinantes tales como goma arábiga en polvo, tragacanto en polvo, gelatina y etanol y desintegrantes tales como laminarán y agar.

Los portadores a ser utilizados para formar supositorios pueden seleccionarse ampliamente de los portadores conocidos convencionalmente. Los ejemplos del portador incluyen polietilenglicol, manteca de cacao, alcoholes superiores, ésteres de alcoholes superiores, gelatina y glicéridos semi-sintéticos.

Cuando se preparan líquidos, emulsiones y suspensiones como preparaciones para inyección, se

esterilizan y controlan de preferencia para ser isotónicos con la sangre. Los diluyentes a ser utilizados para formar estas preparaciones líquidas, emulsiones y suspensiones pueden seleccionarse ampliamente de los diluyentes conocidos convencionalmente. Los ejemplos de los diluyentes incluyen agua, etanol, propilenglicol, alcohol isoestearílico etoxilado, alcohol isoestearílico polioxilado y éster de ácido graso de polioxietilen-sorbitán. En este caso, las formulaciones médicas pueden contener cloruro de sodio, glucosa o glicerol en una cantidad suficiente para preparar soluciones isotónicas. También pueden estar contenidos solubilizadores, amortiguadores, analgésicos convencionales y similares, y, según sea necesario, agentes colorantes, conservadores, especias, saborizantes, edulcorantes y similares, u otros productos farmacéuticos.

Aunque la cantidad del compuesto aromático (1) o una sal del mismo contenida en una formulación médica no está limitada particularmente y puede seleccionarse adecuadamente de una amplia gama de compuestos. Es preferible que el compuesto aromático (1) o una sal del mismo esté contenido en una cantidad de 1 a 70% en peso en una formulación médica.

El método para administrar una formulación médica de acuerdo con la presente invención no está limitado particularmente. La formulación médica puede administrarse

mediante un método determinado dependiendo de la forma de la formulación médica, la edad del paciente, sexo, gravedad de la enfermedad y otras condiciones. Por ejemplo, las tabletas, píldoras, líquidos, suspensiones, emulsiones, gránulos y cápsulas se administran oralmente. Las formulaciones para inyección se administran individualmente o al mezclarlas con un reemplazo de fluido convencional tal como una solución de glucosa o solución de aminoácidos, intravenosamente o, según sea necesario, se administra individualmente por la vía intramuscular, intradérmica, subcutánea o intraperitoneal. Los supositorios se administran al recto.

La dosis para la formulación médica mencionada anteriormente se puede seleccionar adecuadamente dependiendo del uso, edad del paciente, sexo y gravedad de la enfermedad y otras condiciones. Típicamente, de 0.001 a 100 mg por kg (peso corporal) al día, de preferencia de 0.001 a 50 mg por kg (peso corporal) al día, se administra una vez o varias veces al día.

Ya que la dosificación descrita anteriormente varía dependiendo de condiciones variables, la dosificación puede ser más pequeña que el límite inferior del rango descrito anteriormente o mayor que el límite superior del rango descrito anteriormente.

El compuesto aromático (1) o una sal del mismo en

la presente invención tiene una acción inhibitoria de la activación de STAT3/5 y es útil como un inhibidor de la activación de STAT3/5.

El compuesto aromático (1) o una sal del mismo tiene una acción inhibitoria de la activación de STAT3 y por lo tanto es útil como un fármaco medicinal para prevenir o tratar una enfermedad autoinmunitaria, diabetes, infección, enfermedad central, enfermedad asociada con el cáncer o psoriasis.

Los ejemplos de la enfermedad autoinmunitaria incluyen discrasia sanguínea autoinmunitaria (por ejemplo, anemia hemolítica, anemia aplásica y trombocitopenia idiopática), reumatismo, lupus eritematoso sistémico, policondritis, escleroderma, granulomatosis de Wegener, dermatomiositis, hepatitis activa crónica, síndrome de Stevens-Johnson miasténico grave, esprúe idiopático, enfermedad inflamatoria del intestino (por ejemplo, colitis ulcerativa y enfermedad de Crohn), oftalmopatía endocrina, enfermedad de Graves, sarcoidosis, esclerosis múltiple, cirrosis biliar primaria, diabetes de comienzo juvenil (diabetes Tipo I), uveitis (uveitis frontal y posteroir), queratoconjuntivitis seca, queratoconjuntivitis vernal, artritis psoriática, glomerulonefritis (con y sin un síntoma de nefrosis, tal como síndrome nefrótico ideopático o nefropatía de cambio mínimo).

Como la enfermedad central, se puede mencionar la enfermedad de Alzheimer.

Como la enfermedad asociada con el cáncer, se puede mencionar la caquexia.

Como la infección, se pueden mencionar la infección con el virus de hepatitis C (HCV, por sus siglas en inglés) y la infección con el virus de herpes asociado con sarcoma de Kaposi (CSB, por sus siglas en inglés).

Además, el compuesto de la presente invención tiene una acción inhibitoria de la activación de STAT5 y es útil como inhibidor de la activación de STAT5, específicamente como agente preventivo o de tratamiento para enfermedades autoinmunes, alergias, inflamaciones, hiperprolactinemia y similares mencionados anteriormente.

En la presente invención, el compuesto aromático (1) o una sal del mismo se puede utilizar en combinación con otro inhibidor de la activación de STAT3, inhibidor de la actividad de STAT3, agente inmunosupresor, agente antiflogístico, agente terapéutico para la diabetes, agente terapéutico para una enfermedad infecciosa, agente terapéutico para una enfermedad central, agente terapéutico para una enfermedad asociada con el cáncer, agente terapéutico para psoriasis, agente anti-tumoral y agente supresor de fibrosis.

Las patentes, solicitudes de patente y

bibliografías citadas en la presente invención se incorporan en este documento a manera de referencia.

[Ejemplo 1]

Efecto del compuesto de prueba sobre la cantidad de STAT3 activado en el núcleo de las células Hep G2 después de la estimulación con IL-6

1) Cultivo

Después de que las células Hep G2 se lavan con PBS (-) dos veces, se lavan una vez con solución de tripsina/EDTA y se separan utilizando una solución de tripsina/EDTA. Las células se centrifugan y se suspenden en un medio complementado con antibióticos (medio MEM (FBS al 10% + antibiótico (100 U/mL de penicilina + 100 µg/mL de estreptomicina)). Después de que el número de células se cuenta, las células se siembran en placas de 12 pocillos a una densidad de $1.2 \times 10^5$ células/1 mL por pocillo.

Dos días después de la siembra, el medio de cultivo se reemplaza por 1 mL de medio de cultivo libre de antibióticos (medio MEM (FBS al 10%)).

2) Adición del compuesto de prueba

Dos días después del reemplazo del medio, se agrega un compuesto de prueba para obtener concentraciones de 0, 1, 10 y 100 nM.

Tres horas después de la adición del compuesto de prueba, se agrega IL-6 (Código No. KTS102S manufacturado por

Kamakura Techno Science Inc.) a una concentración final de 0 o 500 ng/mL.

Cinco minutos después de la adición de IL-6, se realiza la extracción por medio del uso de un Kit de Extracción Nuclear (Código No. 40410 manufacturado por Active Motif Inc.)

3) Extracción de la fracción nuclear

El sobrenadante de las células se retira por medio de succión. Las células se lavan con 1 mL de PBS helado que contiene inhibidor de fosfatasa (en lo sucesivo, inhibidor de PBS/fosfatasa) y el sobrenadante de las células se retira nuevamente por medio de succión.

Las células se recolectan con un raspador de células en 0.6 mL de inhibidores helados de PBS/fosfatasa y se dividen en microtubos helados de 1.5 mL.

Después de que el microtubo es centrifugado a 4°C y a una velocidad de 400 x g durante 5 minutos, el sobrenadante es retirado.

Las células se resuspenden en 0.2 mL de amortiguador hipotónico al pipetear hacia arriba y hacia bajo varias veces y se mantienen sobre hielo durante 15 minutos.

A esta suspensión, se agregan 10 µL de un detergente y se remolinean durante 10 segundos. Después de

que la centrifugación se realiza a 4°C y a una velocidad de 20,400 x g durante 30 segundos, el sobrenadante es retirado.

A las células resultantes, se agregan 50 µL de Amortiguador de Lisis Completo. La suspensión se pipetea, se remolinea durante 10 segundos y se agita sobre hielo durante 30 minutos.

Después de ser remolineada durante 30 segundos, la suspensión se centrifuga a 4°C y a una velocidad de 20,400 x g durante 10 minutos.

El sobrenadante se divide en microtubos helados de 1.5 mL y se almacena a -80°C.

4) La unión de ADN se mide por medio del uso del Kit TransAM STAT3$^{MR}$ (Código No. 45196 manufacturado por Active Motif Inc.).

A cada uno de los pocillos de una placa de ELISA, se agregan 30 µL de Amortiguador de Unión Completo y 20 µL de una muestra (extraída de un núcleo).

Un control positivo: 10 µl de extracto nuclear de Hep G2 (2.5 mg/mL) se diluyen con 40 µL de Amortiguador de Lisis Completo (10 µg/20 µL). Las diluciones se prepararon a 5, 2.5, 1.25, 0.625 y 0.313 µg/20 µL por medio de la dilución secuencial a la mitad y 20 µL de diluciones se agregan a cada pocillo.

Pocillo vacío: Se agregan 20 µL de Amortiguador de Lisis Completo.

Después de que la placa se sella, la placa se agita suavemente a temperatura ambiente durante una hora, seguido por el lavado con 200 µL de amortiguador de lavado tres veces.

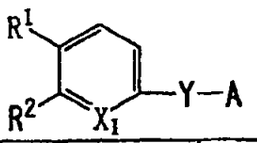
Se agregan 100 µL de un anticuerpo de STAT3 y la placa se sella. Después de eso, la placa se agita suavemente a temperatura ambiente. Una hora después, la placa se lava con 200 µL de amortiguador de lavado tres veces. Después del lavado, se agregan 100 µL de un anticuerpo conjugado con HRP. La placa se sella, se agita suavemente a temperatura ambiente durante una hora, seguido por el lavado con 200 µL de amortiguador de lavado cuatro veces.

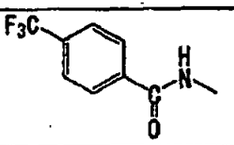
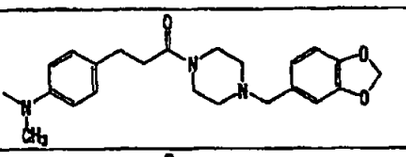
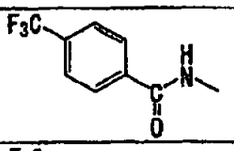
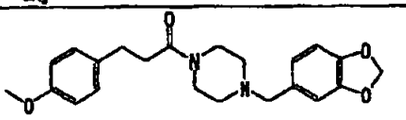
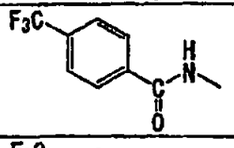
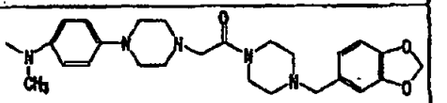
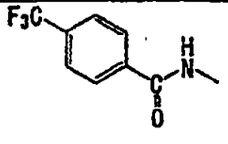
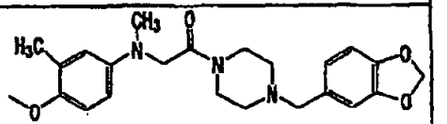
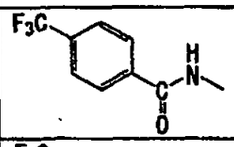
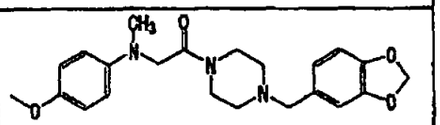
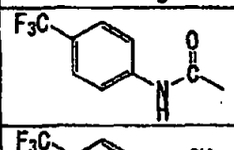
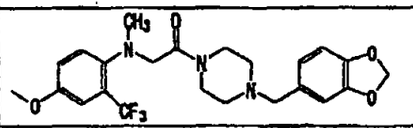
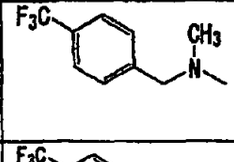
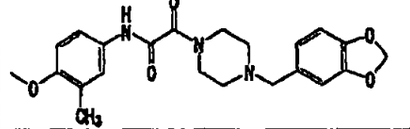
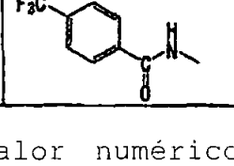
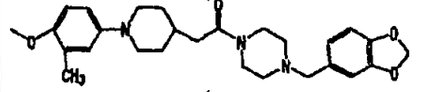
Después de eso, se agregan 100 µL de una solución de desarrollo regresada a la temperatura ambiente, la placa se incuba durante 2 a 10 minutos protegida de la luz. Después de que se confirma el desarrollo de color, se agregan 100 µL de una solución de detención y se determina la absorbancia a 450 nm y 630 nm dentro de 5 minutos.

5) Los resultados de los compuestos de prueba listados en la Tabla 1 a continuación se muestran en la Tabla 2.

[Tabla 1]

·Compuestos de prueba



| Compuesto de Prueba No. ( )* | $R^1$ | $R^2$ | $X_1$ | -Y-A |
|---|---|---|---|---|
| 1 (Ej. 582) |  | H- | N |  |
| 2 (Ej. 1039) |  | H- | N |  |
| 3 (Ej. 322) |  | H- | N |  |
| 4 (Ej. 1503) |  | H- | N |  |
| 5 (Ej. 1049) |  | H- | CH |  |
| 6 (Ej. 940) |  | H- | N |  |
| 7 (Ej. 2228) |  | H- | N |  |
| 8 (Ej. 1202) |  | H- | N |  |

*: ( ) El valor numérico dentro de los paréntesis es el número del Ejemplo en el documento WO 2006/014012.

[Tabla 2]

·Resultados

| Compuesto de prueba No. | $IC_{50}$ (nM) |
|---|---|
| 1 | < 150 |
| 2 | < 150 |
| 3 | < 150 |
| 4 | < 150 |
| 5 | < 150 |
| 6 | < 150 |
| 7 | < 150 |
| 8 | < 150 |

[Ejemplo 2]

Efecto del compuesto de prueba sobre la supresión de la fosforilación del STAT3

(1) Células

· Siembra de células

Después de que las células Hep G2 se lavan con PBS (-) dos veces, se lavan y se retiran por medio de una solución de tripsina/EDTA y se retiran adicionalmente por medio de una solución de tripsina/EDTA. Las células se centrifugan y se suspenden en un medio complementado con antibióticos (medio MEM (FBS al 10% + antibiótico (100 U/mL de penicilina + 100 µg/mL de estreptomicina))). Después de que el número de células se cuenta, las células se siembran en una placa de 6

pocillos a una proporción de 2.4 x $10^5$/2 mL por pocillo.

Dos días después, el medio complementado con antibióticos se reemplaza por un medio no complementado con antibióticos (medio MEM (FBS al 10%)).

· Tratamiento de las células con un fármaco medicinal

Dos días después del reemplazo del medio, se agrega un compuesto de prueba para obtener concentraciones de 0, 1, 10 y 100 nM.

Tres horas después de la adición del compuesto de prueba, se agrega IL-6 (Código No. KTS102S manufacturado por Kamakura Techno Science Inc.) para obtener una concentración de 100 ng/mL.

· Recuperación de las células

Cinco minutos después de la adición de IL-6, las células se lavan con PBS frío (-) dos veces, y se desprenden de la placa por medio de un raspador. Las células se recolectan en un microtubo de 1.5 mL por medio del uso de PBS (-). Las células recolectadas en el microtubo de 1.5 mL se centrifugan y el sobrenadante se retira. Las células recolectadas en el microtubo de 1.5 mL se crioconservan en un refrigerador criogénico hasta el uso.

· Tratamiento de lisis

A las células congeladas, se agrega amortiguador de RIPA. Las células congeladas se suspenden por medio del uso de una jeringa de 1 mL con una aguja para inyección de 26G x

1/2 y la solución de suspensión se deja inmóvil en agua fría durante 30 a 60 minutos. La solución de suspensión de células se centrifuga y el sobrenadante (lisado de células) se transfiere a un nuevo tubo. El lisado de células recolectado en el tubo se crioconserva en un refrigerador criogénico hasta el uso.

· Medición de la concentración de proteínas

La cantidad de proteínas de cada lisado de células se mide de acuerdo con el protocolo adjunto a un conjunto de reactivos para ensayo de proteínas BCA.

(2) Análisis de inmunotransferencia Western

· PAGE (Electroforesis)

Después de que la cantidad de proteínas de cada lisado de células se ajusta al mismo valor, el tratamiento de desnaturalización se realiza bajo condiciones reducidas. Después de que las muestras y un marcador molecular se aplican a un gel de poliacrilamida, se realiza la electroforesis.

· Inmunotransferencia

Después de la terminación de la electroforesis, el gel se equilibra con la solución a ser utilizada en la transferencia.

Las proteínas desarrolladas sobre el gel de poliacrilamida se transfieren sobre una película de PVDF (difluoruro de polivinilideno) por medio de un aparato de

transferencia de tipo semiseco.

· Bloqueo/lavado

Después de que la película de PVDF se lava, se remoja en amortiguador de bloqueo (BSA al 5%) para realizar el bloqueo.

· Anticuerpo primario (Anticuerpo Fosfo-STAT3 (Ser 727) o Anticuerpo Fosfo-STAT3 (Tyr 705)

La película de PVDF bloqueada se hace reaccionar con el anticuerpo primario.

· Anticuerpo secundario (Anticuerpo enlazado con HRP anti-IgG de conejo)/lavado

Después de ser lavada, la película de PVDF se hace reaccionar con el anticuerpo etiquetado con HRP.

· Detección de emisión de Color por medio de la ECL

Después de que la película de PVDF se lava, se permite la emisión del color por medio del uso de Reactivos de Detección de Inmunotransferencia Western por medio de la ECL y la fluorescencia se detecta por medio de LAS-3000.

· De acuerdo con el método mencionado anteriormente, se mide el efecto del compuesto de prueba sobre la supresión de la fosforilación del STAT3.

[Ejemplo 3]

Efecto del compuesto de prueba sobre la activación de STAT5 inducida con prolactina en las células 22Rv1

1) Cultivo

Después de que las células 22Rv1 crioconservadas se subcultivan por lo menos dos veces, se someten a una prueba. Después de cultivarse hasta la subconfluencia, las células se lavan con D-PBS (-). Después de eso, se separan utilizando una solución de tripsina/EDTA y se suspenden en un medio (medio RPMI-1640 (FBS al 10% + antibióticos (100 U/mL de penicilina + 100 µg/mL de estreptomicina)). La solución de suspensión de células se centrifuga a 150 x g, durante 5 minutos de 20 a 25°C. El sobrenadante se retira y la pelotilla se resuspende en el medio. Se toma una alícuota de la solución de suspensión de células y las células muertas se tiñen con azul de tripano. El número de células viables se cuenta por medio de un hemocitómetro. Se prepara una solución de suspensión de células que contiene $2 \times 10^5$ células/mL y las células se siembran en una placa de 12 pocillos a una densidad de $2 \times 10^5$ células/mL por pocillo. Las células se cultivan en una incubadora de $CO_2$ ($CO_2$ al 5%, 37°C).

2) Adicion del compuesto de prueba

Dos días después de la siembra, se agrega un compuesto de prueba para obtener concentraciones de 0 y 1000 nM.

Tres horas después de la adicion del compuesto de prueba, se agrega prolactina humana recombinante (rhPRL, R&D systems Inc.) para obtener una concentración de 0 o 250 ng/mL.

3) Extracción de la fracción citoplásmica

Quince minutos después de la adición de la prolactina, la extracción se realiza por medio de un Kit de Extracto Nuclear (Código No. 40410 manufacturado por Active Motif Inc.). En 15 minutos después de la adición de la prolactina, el sobrenadante se retira y la estimulación con prolactina se detiene inmediatamente al agregar 1 ml de inhibidor helado de PBS/fosfatasa. Después de la aspiración de 1 mL de inhibidor helado de PBS/fosfatasa, se agregan 0.6 mL de inhibidor helado de PBS/fosfatasa y se centrifugan a 200 x g, durante 5 minutos a 4°C.

Después de que el sobrenadante se retira, se agregan y se suspenden 0.2 mL de amortiguador hipotónico. Después de que la suspensión se mantiene sobre hielo durante 15 minutos, se agregan 10 µL de un detergente. Después de que la solución se agita adicionalmente, se centrifuga a 14,000 x g, durante un minuto a 4°C. El sobrenadante resultante (fracción citoplásmica) se divide en tres placas heladas de 96 pocillos y se almacenan en un congelador de -80°C.

4) Medición del STAT5 activado

La medición se realiza por medio del uso de reactivos unidos a un kit doméstico TransAM STAT$^{MR}$. Para describir más específicamente, a cada uno de los pocillos de una placa de ELISA del kit doméstico TransAM STAT$^{MR}$, se agregan 30 µL de Amortiguador de Unión Completo y después de

esto, se agregan 20 µL de la fracción citoplásmica. Como una muestra para la curva de calibración, 12 µL de una muestra de referencia de fracción nuclear celular (fracción nuclear Nb2 (estimulada con prolactina, 2.5 µg/µL)) unida al kit doméstico TransAM STAT$^{MP}$ se diluyen con 48 µL de Amortiguador de Lisis Completo (a 10 µg/20 µL) y se diluyen en serie adicionalmente a la mitad para preparar soluciones diluidas de 5, 2.5, 1.25, 0.625, 0.313 y 0.156 µg/20 µL. 20 µL de cada solución de dilución se agregan al pocillo. Como un pocillo vacío, se agregan 20 µL de Amortiguador de Lisis Completo. Después de la adición de una muestra, la placa se sella y se agita suavemente a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de eso, la placa se lava con 200 µL de amortiguador de lavado tres veces. Enseguida, se agregan 100 µL de anticuerpo de STAT5B, se sellan y se incuba a temperatura ambiente sin agitación. Una hora después, la placa se lava con 200 µL de amortiguador de lavado tres veces. Se agregan 100 µL de un anticuerpo conjugado con Peroxidasa de Rábano Picante (HRP), se sella y se incuba a temperatura ambiente sin agitación. Una hora después, la placa se lava con 200 µL de amortiguador de lavado cuatro veces y se agregan 100 µL de una solución de desarrollo. La placa se incuba durante 2 a 10 minutos protegida de la luz. Después de que se confirma el desarrollo de color, se agregan 100 µL de una solución de detención. Inmediatamente después, la absorbancia a 450 nm

(longitud de onda de medición) y 630 nm (longitud de onda de referencia) se determina utilizando un lector de placas.

La cantidad de dímero de STAT5B fosforilado se valora con base en una curva de calibración. Además, se calcula una relación (T/C%) de la cantidad del dímero de STAT5B fosforilado en presencia de cada fármaco medicinal relativa a aquella en ausencia de un fármaco medicinal. Los resultados de los compuestos de prueba listados en la Tabla 1 se muestran en la Tabla 3.

[Tabla 3]

| Compuesto de prueba No. | | T/C% |
|---|---|---|
| Objetivo (DMSO) | 0 | 100 |
| 1 | 1000 nM | <30 |
| 2 | 1000 nM | <30 |
| 3 | 1000 nM | <30 |
| 4 | 1000 nM | <30 |
| 5 | 1000 nM | <30 |
| 6 | 1000 nM | <30 |
| 7 | 1000 nM | <30 |
| 8 | 1000 nM | <30 |

[Ejemplo 4]

Efecto del compuesto de prueba sobre un modelo de colitis inducida por dextran-sulfato de sodio (DSS)

1. Inducción de colitis por DSS

Después de que los ratones hembra C57BL/6J Jms Slc se desarrollan preliminarmente durante una semana, los ratones se agrupan con base en el peso corporal (BW) de los ratones en el día de agrupamiento y de acuerdo con el muestreo aleatorio, estratificado.

El DSS (Lote No. 4556J, MP Biomedicals) se disuelve en agua destilada de Otsuka para preparar una solución de DSS al 4%. A los ratones se les permite beber la solución de DSS al 4% libremente durante 7 días a partir del siguiente día (Día 2) después del comienzo de la administración para inducir la colitis.

2. Administración del compuesto de prueba y solvente

Con base en el peso corporal antes de la administración de la solución de DSS (Día 1) y el peso corporal más reciente después de la administración de la solución de DSS, cada solución de administración se suministra por la vía oral en una dosis de 10 ml/kg una vez al día.

La dosis del compuesto de prueba es de 300 mg/kg.

Una solución de administración se prepara al suspender un compuesto de prueba en una solución de goma arábiga al 5% para contener el compuesto de prueba en una concentración de 30 mg/mL.

3. Autopsia

La autopsia se realiza en el Día 8.

4. Recolección de sangre

Después de que la sangre se recolecta de la vena cava posterior abdominal bajo anestesia con éter dietílico, se transfiere inmediatamente a un dispositivo BD Microtainer$^{MR}$ (Nippon Becton, Dickinson and Company), se mezcla al voltear la Micro-Tina y se deja inmóvil en hielo. La Micro-Tina se centrifuga por medio del uso de una centrifuga refrigerada (rotor HITACHI CF9XR, T3S51) a 4°C y 2,150 x g durante 20 minutos para obtener el plasma con heparina. El plasma dispensado se crioconserva en un congelador (-80°C) hasta el uso en la medición.

5. Recolección de órganos

Después de que la vena cava posterior abdominal se corta bajo anestesia con éter dietílico para sacrificar a un ratón al dejarlo desangrarse, el bazo se esciende. El peso del bazo se mide por medio de una báscula de fuerza electrónica. Y, el intestino grueso se retira inmediatamente para la medición de la longitud intestinal y la evaluación del encogimiento intestinal.

6. Unidades de medición

· Peso corporal

El peso corporal se mide en el Día 1 (día del agrupamiento), 3, 5, 7 y 8 (día de la autopsia) por medio de una báscula de fuerza electrónica.

Con base en el peso corporal del Día 1 (día del agrupamiento) y Día 8 (día de la autopsia) se calcula un cambio en el peso corporal.

· Peso del bazo

El peso en húmedo del bazo se mide por medio de una báscula de fuerza electrónica.

Además, a partir de los resultados de medición del peso del bazo, se calcula una relación (T/C%) del peso del bazo relativa a una relación de peso del bazo promedio de un grupo de control y una inhibición del aumento de peso del bazo (IR%).

· Longitud intestinal

La longitud del intestino grueso se mide por medio de una regla.

Además, a partir de los resultados de medición de la longitud intestinal, se calcula una relación (T/C%) de la longitud intestinal relativa a una relación de longitud intestinal promedio de un grupo de control y una inhibición de encogimiento intestinal (IR%).

Los resultados de los compuestos de prueba se muestran en la Tabla 4.

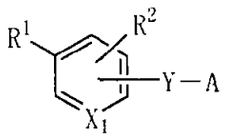
[Tabla 4]

| Compuesto de prueba No. | Relación de inhibición del aumento de peso del bazo IR (%) |
|---|---|
| 9 (Ejemplo 305 del documento WO2006/014012) | >40 |
| 10 (Ejemplo 1105 del documento WO2006/014012) | >40 |
| 11 (Ejemplo 1503 del documento WO2006/014012) | >40 |

**REIVINDICACIONES**

1. Un inhibidor de la activación de STAT3/5, caracterizado porque comprende un compuesto aromático representado por la fórmula general o una sal del mismo como un ingrediente activo:

[Fórmula 1]



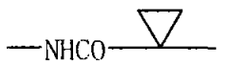
(1)

en donde $X_1$ representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CH=,

$R_1$ representa un grupo $-Z-R^6$,

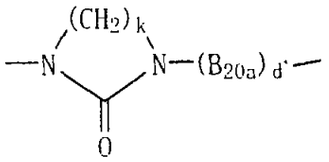
Z representa un grupo $-N(R^8)-B-$, un grupo $-B-N(R^8)-$, un grupo $-B_0-O-$, un grupo

[Fórmula 2]



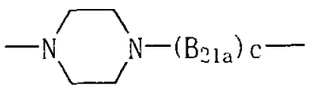
un grupo -CO-, un grupo-CH(OH)-, un grupo $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$, un grupo -N=CH-, un grupo $-N(R^{10a})-SO_2-(B_{22a})e-$, un grupo alquenileno inferior, un grupo $-NHCO-B_1-$, un grupo $-NHCO-B_2-(W)u-$, un grupo $-B_0-O-B_{19a}-$, un grupo

[Fórmula 3]



, un grupo

[Fórmula 4]



, un grupo $-SO_2-N(R^{10b})-$, un grupo $-S-$, un grupo alquinileno inferior, un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{8d})-$ o un grupo $-CO-NH-B_{18a}-$,

$R^8$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo alcoxi inferior como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo alquilsulfonilo inferior o un grupo fenil-alquilo inferior,

B representa un grupo $-CO-$ o un grupo alquileno inferior,

$B_0$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_1$ representa un grupo alquenileno inferior que puede tener un grupo fenilo como un sustituyente,

$B_2$ representa un grupo alquileno inferior que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un grupo fenilo,

$R^{9a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{9b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo

inferior,

$R^{10a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{22a}$ representa un grupo alquileno inferior o un grupo alquenileno inferior,

e representa 0 o 1,

$B_{18a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{20a}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{21a}$ representa un grupo alquileno inferior,

k representa 2 o 3,

c representa 0 o 1,

d' representa 0 o 1,

$R^{10b}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$R^{8d}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

W representa un átomo de oxígeno, un grupo -NH- o un átomo de azufre,

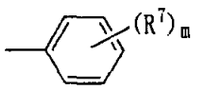
u representa 0 o 1,

$R^6$ representa un grupo heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico, dicíclico o tricíclico de 5 a 15 miembros que tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo oxo;

un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo alquilsulfonilo inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido por un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno en el anillo de fenilo; un grupo alquiltio inferior, un grupo pirrolilo, un grupo benzoilo; un grupo alcanoilo inferior; grupo alcoxicarbonilo inferior; y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo heterocíclico), un grupo adamantilo, un grupo naftilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un átomo de halógeno y un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, en el anillo de naftaleno), un grupo alquilo que puede tener un grupo alcoxi inferior como un sustituyente, un grupo cicloalquilo que puede ser sustituido por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, en el anillo de cicloalquilo, un grupo alquenilo inferior que puede tener un

átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno y átomo de halógeno, como un sustituyente, en el anillo de fenilo), un grupo alquilo inferior sustituido por un átomo de halógeno, grupo cicloalquil-alquilo inferior o un grupo

[Fórmula 5]



$R^7$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo fenilo, un grupo carboxi, un grupo hidroxilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenoxi, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquilendioxi inferior, un grupo amino que puede tener, como un sustituyente, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo cicloalquilo, un grupo ciano, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquilsulfonilo inferior, un grupo aminosulfonilo, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo alcanoiloxi inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior o un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros saturado o

insaturado que tienen de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre (que puede tener un grupo oxo en el anillo heterocíclico),

m representa un número entero de 1 a 5 (cuando m representa 2 a 5, dos a cinco $R^7$s pueden ser idénticos o diferentes) y

$R^2$ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo inferior,

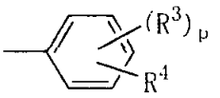
Y representa un grupo -O-, un grupo $-N(R^5)-$, un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)-, un grupo alquileno inferior, un grupo -S(O)n- o un grupo -C(=N-OH)-,

$R^5$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo alcanoilo inferior, un grupo benzoilo, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo,

n representa 0, 1 o 2,

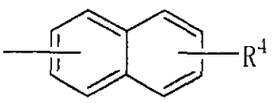
A representa un grupo

[Fórmula 6]



o un grupo

[Fórmula 7]



p representa 1 o 2,

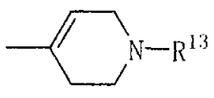
$R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que

puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo -$CONR^{11}R^{12}$ o un grupo ciano,

en donde $R^{11}$ y $R^{12}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo o un grupo fenilo y $R^{11}$ y $R^{12}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterociclico saturado de 5 a 7 miembros,

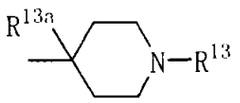
$R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,3-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior, un grupo pirazolil-alquilo inferior, un grupo pirimidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-iliden-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de 1,2,4-oxadiazol, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo

[Fórmula 8]



, un grupo

[Fórmula 9]



o un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$,

$R^{13}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, un grupo carboxi-alquilo inferior, un grupo benzoilo, un grupo alcanoilo inferior sustituido por morfolino, un grupo piperazinil-carbonil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo alquilo inferior sustituido por morfolinocarbonilo o un

grupo imidazolil-alcanoilo inferior,

$R^{13a}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo hidroxilo,

T representa un grupo alquileno inferior, un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$, un grupo $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$, un grupo $-B_4-CO-$, un grupo $-Q-B_5-CO-$, un grupo $-B_6-N(R^{19})-B_7-CO-$, un grupo $-CO-B_8-$, un grupo $-CH(OH)-B_9-$, un grupo $-CO-B_{10}-CO-$, un grupo $-CH(OH)-B_{11}-CO-$, un grupo $-CO-$, un grupo $-SO_2-$ o un grupo $-B_{23a}-CO-CO-$,

en donde $R^{17}$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilcarbonilo, un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alquenilo inferior, un grupo alcanoilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente o un grupo alquilsulfonilo inferior,

$B_3$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{19}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{18}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_4$ representa un grupo alquenileno inferior o un grupo alquileno inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

Q representa un átomo de oxígeno o un grupo $-S(O)n-$ (en donde n es igual al descrito anteriormente),

$B_5$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_6$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{13}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcanoilo inferior,

$B_7$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_8$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_9$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{10}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{11}$ representa un grupo alquileno inferior,

$B_{13a}$ representa un grupo alquileno inferior,

l representa 0 o 1,

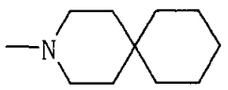
$R^{14}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente,

$R^{15}$ representa (2) un grupo alquilo sustituido por un grupo hidroxilo, (3) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (4) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (5) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior; un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un átomo de halógeno; un grupo amino-alcoxi inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo hidroxilo; un grupo fenil-alquilo inferior; un grupo alquinilo inferior; un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un

sustituyente; un grupo alquiltio inferior; un grupo cicloalquilo; un grupo feniltio; un grupo adamantilo; un grupo anilino que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo piperazinilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperazina; un grupo pirrolidinilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alcanoilamino inferior; un grupo ciano; y un grupo fenoxi, (6) un grupo fenoxi, (7) un grupo fenil-alquilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior, (8) un grupo fenil-alquilo inferior que tiene un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (10) un grupo alquilo inferior sustituido por alcoxicarbonilo inferior, (11) un grupo alquilo inferior sustituido por carboxi, (12) un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (13) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo oxo, un grupo alcoxi inferior y un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrahidroquinolina, (14) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (15) un grupo

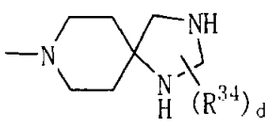
piperazinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de piperazina, por un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (16) un grupo piridil-alquilo inferior, (17) un grupo alquilo inferior sustituido por un grupo amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, (18) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, (19) un grupo imidazolilo, (20) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (21) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolilcarbonilo, (22) un grupo piperidinilcarbonilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior y un grupo furil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (23) un grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, (24) un grupo piperidinilo que puede ser sustituido, en el anillo de piperidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo y un grupo furil-alquilo inferior, (25) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 10]



, (26) un grupo carbonil-alquilo inferior sustituido por un grupo

[Fórmula 11]



(27) un grupo $-CO-B_{20}-N(R^{36})R^{37}$, (26a) un grupo pirrolidinil-alquilo inferior, (27a) un grupo morfolino-alquilo inferior, (28a) un grupo fenil-alquenilo inferior, (29a) un grupo anilinocarbonil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (30a) un grupo indolilo, (31a) un grupo piperazinil-alquilo inferior que puede tener, como un sustituyente en el anillo de piperazina, un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (32a) un grupo amidino-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente, (33a) un grupo fluorenilo, (34a) un grupo carbazolilo que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de carbazol, (35a) un grupo amidino que puede tener un grupo alquilo inferior

como un sustituyente, (36a) un grupo oxalilo sustituido por piperazinilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo fenil-alquilo inferior (que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilendioxi inferior y un grupo alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo) y un grupo piridil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de piperazina o (37a) un grupo alquilo inferior sustituido por ciano,

$R^{34}$ representa un grupo oxo o un grupo fenilo,

d representa un número entero de 0 a 3,

$B_{-0}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{36}$ y $R^{37}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior en el anillo de fenilo, pueden estar presentes como un sustituyente(s),

$R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado; o un grupo

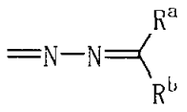
[Fórmula 12]



en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes los cuales se seleccionan del grupo que consiste de (28) un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo, el cual tiene de 1 a 2 grupos fenilo que pueden ser sustituidos por 1 a 3 grupos en el anillo de fenilo, seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino que puede tener un grupo alcanoilo inferior como un sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior y que puede tener un grupo piridilo en el grupo alquilo inferior, (29) un grupo carbamoïlo, (30) un grupo piridil-alquilo inferior que puede tener, como un sustituyente(s) en el anillo de piridina, de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo hidroxilo y un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (31) un grupo pirrolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de pirrol, (32)

un grupo benzoxazolil-alquilo inferior, (33) un grupo benzotiazolil-alquilo inferior, (34) un grupo furil-alquilo inferior, (35) un grupo benzoilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo amino que puede tener un grupo alquilsulfonilo inferior como un sustituyente, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi inferior, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo tiazolidiniliden-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina y un grupo alquilendioxi inferior, (36) un grupo pirimidinilo, (37) un grupo pirazinilo, (38) un grupo piridilo, (39) un grupo alcoxicarbonilo inferior, (40) un grupo tiazolidinil-alcanoilo inferior que puede ser sustituido, en el anillo de tiazolidina, por un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo oxo y un grupo

[Fórmula 13]



(en donde $R^a$ y $R^b$ cada uno representa un grupo alquilo inferior), (41) un grupo alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo

hidroxilo y un átomo de halógeno como un sustituyente, (42) un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (43) un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo carbamoilo que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior y un grupo alquilo inferior, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo carboxi, un grupo ciano, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo benzoilo que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente en el anillo de fenilo y un grupo hidroxilo, (44) un grupo fenilo que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, (45) un grupo naftil-alquilo inferior, (46) un grupo fenoxi que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo ciano, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (47) un grupo fenoxi-alquilo inferior, (48) un grupo fenil-alcoxi

inferior que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, (49) un grupo $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$, (50) un grupo $-(CO)o-B_{13}-N(R^{22})R^{23}$, (51) un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede ser sustituido, en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno, por 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (52) un grupo cicloalquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, (53) un grupo piperidinilo que puede ser sustituido, en el anillo de piperidina, por 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s), (54) un grupo quinolil-alquilo inferior, (55) un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de tetrazol, (56) un grupo tiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo fenilo como un sustituyente en el anillo de tiazol, (57) un grupo benzoil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior y un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, (58) un grupo piperidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo

inferior como un sustituyente en el anillo de piperidina, (59) un grupo imidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos fenilo como un sustituyente(s) en el anillo de imidazol, (60) un grupo bencimidazolilo que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de bencimidazol, (61) un grupo piridil-alcoxi inferior, (62) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (63) un grupo 1,3,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de 1,3,4-oxadiazol, (64) un grupo cicloalquil-alquilo inferior, (65) un grupo tetrahidropiranilo, (66) un grupo tienil-alquilo inferior, (67) un grupo pirimidinilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, (68) un grupo hidroxilo, (69) un grupo carboxi, (70) un grupo alcoxi inferior-alquilo inferior, (71) un grupo alcoxi inferior-alcoxi inferior, (72) un grupo benzoiloxi, (73) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alcoxi inferior, (74) un grupo carboxi-alcoxi inferior, (75) un grupo fenoxi-alcanoilo inferior, (76) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilcarbonilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina, (77) un grupo fenilsulfonilo, (78) un grupo imidazolil-alcanoilo inferior, (79) un grupo imidazolil-alquilo inferior, (80) un grupo piridilcarbonilo,

(81) un grupo imidazolilcarbonilo, (82) un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior, (83) un grupo carboxi-alquilo inferior, (84) un grupo $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$, (85) un grupo $-N(R^{28})-CO-B_{16}-N(R^{29})R^{30}$, (86) un grupo $-N(R^{31})-B_{17}-CO-N(R^{32})R^{33}$, (87) un grupo benzoxazolilo, (88a) un grupo benzotienilo, (89a) un grupo oxo y (90a) un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolilo que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tetrahidroquinolina,

$B_{12}$ representa un grupo alquileno inferior,

t representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{31}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo amino que puede tener un grupo alcoxicarbonilo inferior como un sustituyente; un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo alquilo inferior; un grupo alquilo inferior que tiene de 1 a 2 grupos fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquiltio inferior; un grupo fenilo que puede ser sustituido, en el anillo de fenilo, por 1 a 3 grupos

seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcoxi inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo alcoxicarbonilo inferior; un grupo cicloalquil-alquilo inferior; un grupo pirrolidinil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos alquilo inferior que pueden tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el anillo de pirrolidina; un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo seleccionado del grupo que consiste de un grupo fenilo y un grupo alquilo inferior como un sustituyente; un grupo alquilo inferior sustituido por 1,2,3,4-tetrahidronaftilo que puede tener de 1 a 5 grupos alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno; un grupo naftil-alquilo inferior; un grupo piridil-alquilo inferior; un grupo quinolil-alquilo inferior; un grupo 1,2,3,4-tetrazolil-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior como un sustituyente(s) en el anillo de tetrazol; un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior; un grupo tetrahidrofuril-alquilo inferior que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente en el grupo alquilo inferior; un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener de 1 a 3 grupos

seleccionados del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo nitro como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo; un grupo fenil-alcanoilo inferior; un grupo alcanoilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente; un grupo imidazolil-alcanoilo inferior; un grupo alcoxicarbonilo inferior-alquilo inferior; un grupo piridilo; o un grupo carboxi-alquilo inferior o un grupo cicloalquilo; y $R^{20}$ y $R^{21}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo que puede tener de 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de un átomo de halógeno y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

o representa 0 o 1,

$B_{13}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{22}$ y $R^{23}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo benzoilo que puede tener de 1 a 3 grupos alcoxi

inferior como un sustituyente(s) en el anillo de fenilo, un grupo fenoxi-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo fenilo o $R^{22}$ y $R^{23}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por via de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo),

$B_{15}$ representa un grupo alquileno inferior,

s representa 0 o 1,

$R^{26}$ y $R^{27}$ pueden ser idénticos o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior, un grupo fenil-alquilo inferior o un grupo imidazolil-alquilo inferior y $R^{26}$ y $R^{27}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un atomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos fenil-alquilo inferior que pueden tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente, pueden estar

presentes en el anillo de fenilo, como un sustituyente(s)),

$R^{28}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{16}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{29}$ y $R^{30}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo,

$R^{31}$ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo inferior,

$B_{17}$ representa un grupo alquileno inferior,

$R^{32}$ y $R^{33}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un grupo heterocíclico saturado de 5 a 7 miembros, (en donde, en el anillo heterocíclico, pueden estar presentes de 1 a 3 sustituyentes, los cuales se seleccionan del grupo

que consiste de un grupo alquilo inferior, un grupo fenilo y un grupo fenil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilendioxi inferior como un sustituyente en el anillo de fenilo), con la condición que el compuesto mencionado anteriormente o una sal del mismo satisface los siguientes requerimientos (i) a (v):

(i) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, entonces $R_3$ representa un átomo de hidrógeno;

(ii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1, T representa -CO- y $R^{14}$ representa un atomo de hidrógeno o un grupo alquilo que puede tener un grupo hidroxilo como un sustituyente, $R^{15}$ representa el grupo (24);

(iii) cuando $X_1$ representa un grupo -CH=, l representa 1 y T representa $-N(R^{17})-B_3-CO-$, $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico de 5 a 10 miembros saturado o insaturado, en donde, en el anillo heterocíclico, de 1 a 3 grupos de (28) están presentes como un sustituyente(s);

(iv) cuando $X_1$ representa un átomo de nitrogeno y l representa 0 o cuando $X_1$ representa un

átomo de nitrógeno, l representa 1 y T representa -CO- o $-SO_2$, $R^{15}$ no es un grupo (5), (7), (19) o (20); y

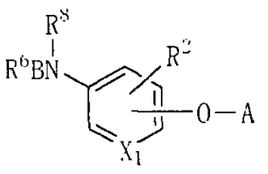
(v) cuando $R^5$ representa un grupo cicloalquilo que puede tener en el anillo de cicloalquilo, un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de un grupo alquilo inferior sustituido por amino que puede tener un grupo alquilo inferior y un grupo alquilo inferior que puede tener un átomo de halógeno como un sustituyente, $R^1$ representa un grupo $-(T)_l-N(R^{14})R^{15}$ (en donde T y l son iguales a los descritos anteriormente y $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el átomo de nitrógeno al cual se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre para formar un anillo heterocíclico saturado de 5 a 10 miembros; o $R^{14}$ y $R^{15}$ forman un grupo

[fórmula 14]

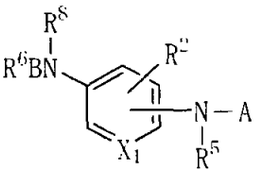


.

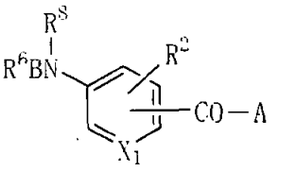
2. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-1) a (1-7) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



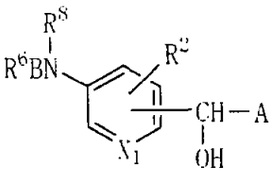
(1-1)



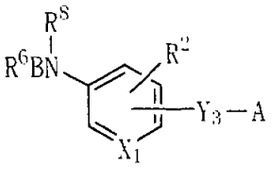
(1-2)



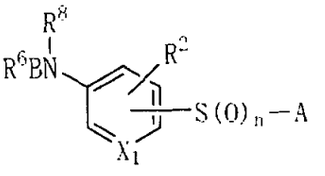
(1-3)



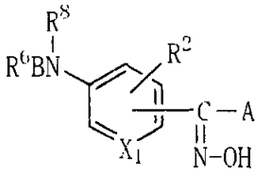
(1-4)



(1-5)



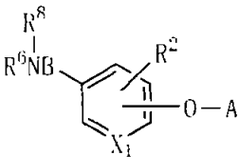
(1-6)



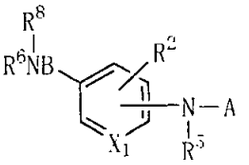
(1-7)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

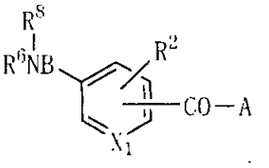
3. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-8) a (1-14) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



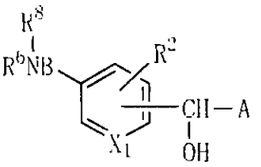
(1-8)



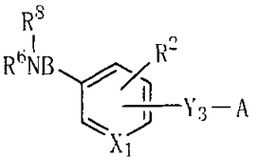
(1-9)



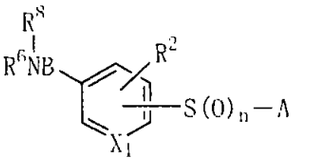
(1-10)



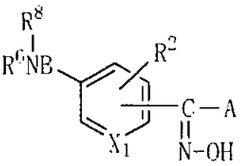
(1-11)



(1-12)



(1-13)

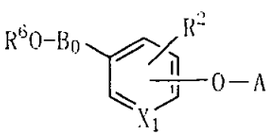


(1-14)

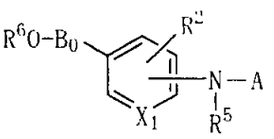
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

4. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-15) a (1-21) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:

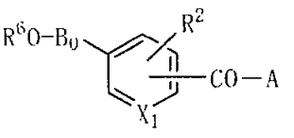
7



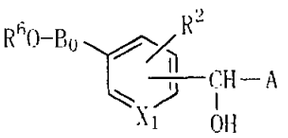
(1-15)



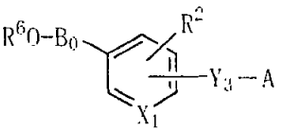
(1-16)



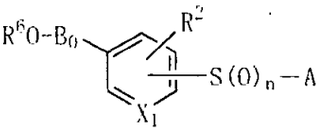
(1-17)



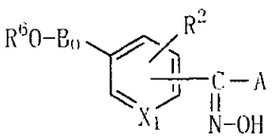
(1-18)



(1-19)



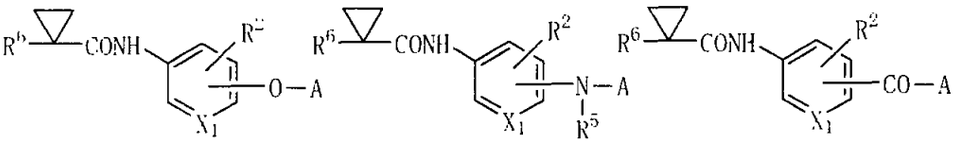
(1-20)



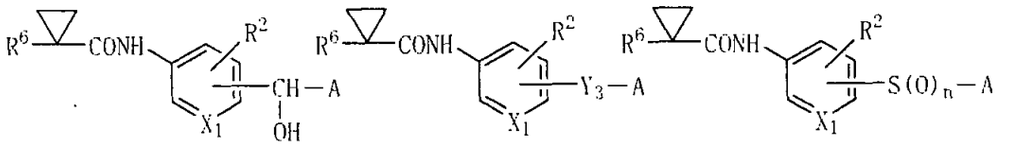
(1-21)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

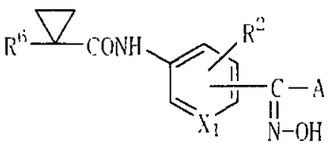
5. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-22) a (1-28) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-22) (1-23) (1-24)



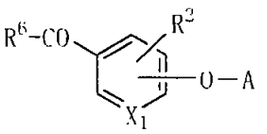
(1-25) (1-26) (1-27)



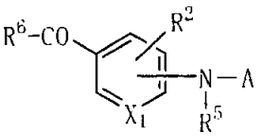
(1-28)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

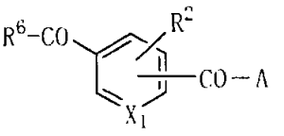
6. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-29) a (1-35) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



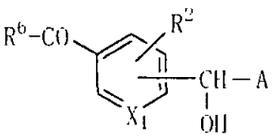
(1-29)



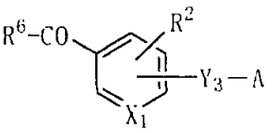
(1-30)



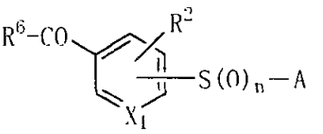
(1-31)



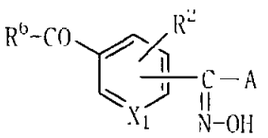
(1-32)



(1-33)



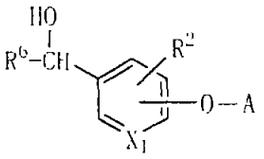
(1-34)



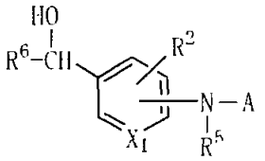
(1-35)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

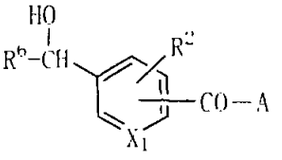
7. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-36) a (1-42) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



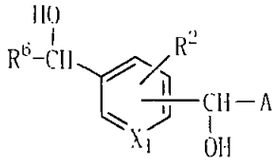
(1-36)



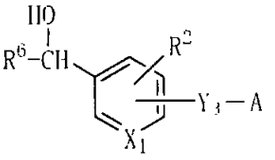
(1-37)



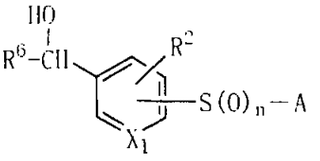
(1-38)



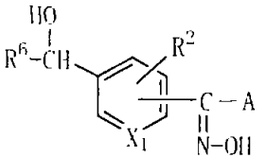
(1-39)



(1-40)



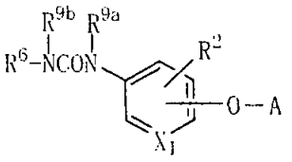
(1-41)



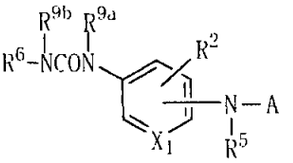
(1-42)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

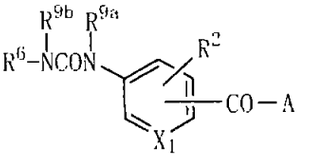
8. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-43) a (1-49) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



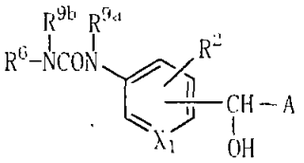
(1-43)



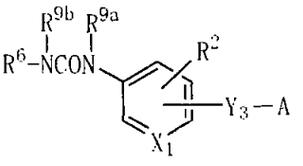
(1-44)



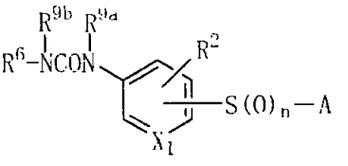
(1-45)



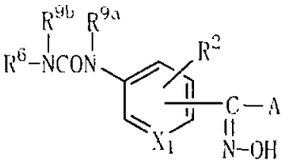
(1-46)



(1-47)



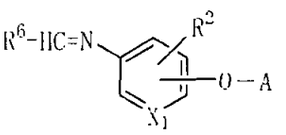
(1-48)



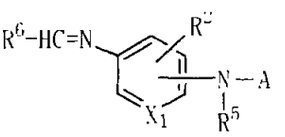
(1-49)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

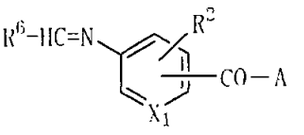
9. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-50) a (1-56) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



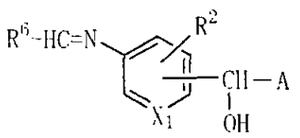
(1-50)



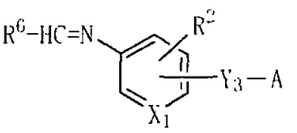
(1-51)



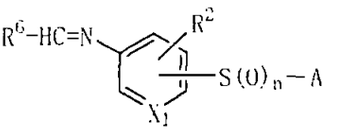
(1-52)



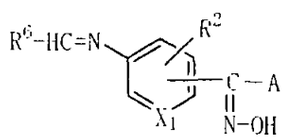
(1-53)



(1-54)



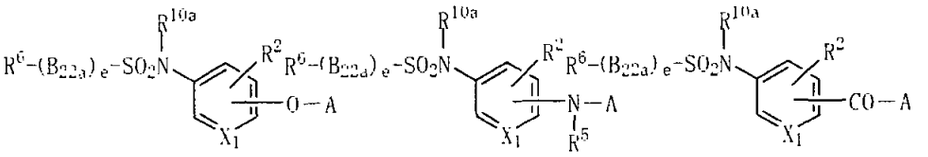
(1-55)



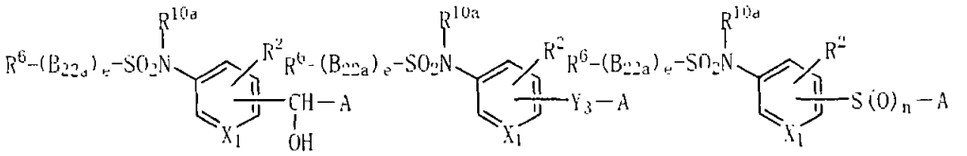
(1-56)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

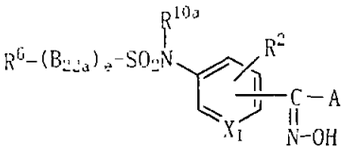
10. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-57) a (1-63) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-57) (1-58) (1-59)



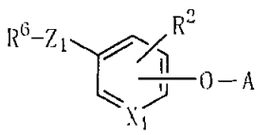
(1-60) (1-61) (1-62)



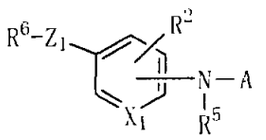
(1-63)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

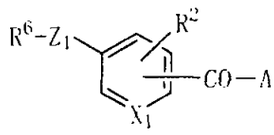
11. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-64) a (1-70) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



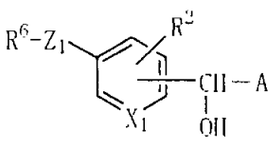
(1-64)



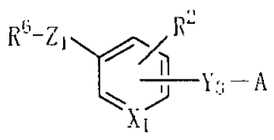
(1-65)



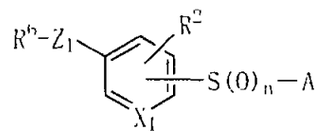
(1-66)



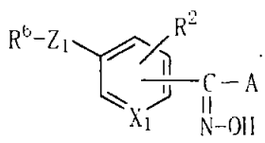
(1-67)



(1-68)



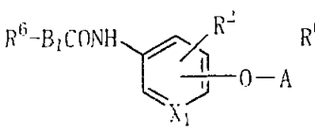
(1-69)



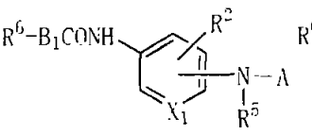
(1-70)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_1$ representa un grupo alquenileno inferior.

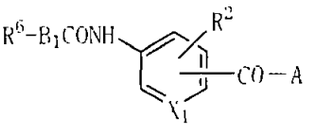
12. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-71) a (1-77) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



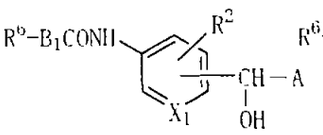
(1-71)



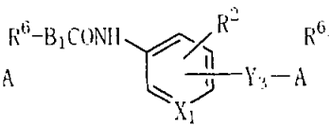
(1-72)



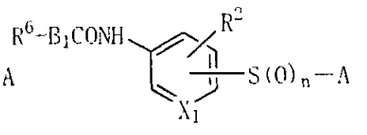
(1-73)



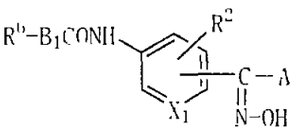
(1-74)



(1-75)



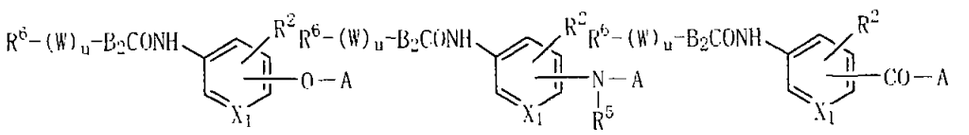
(1-76)



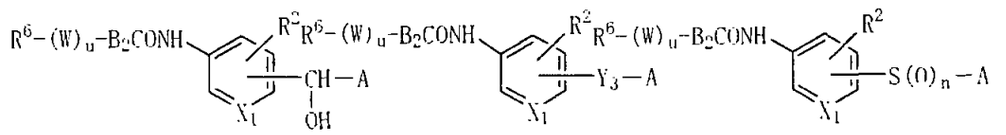
(1-77)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

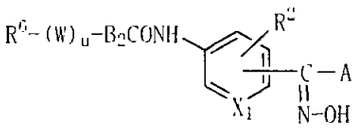
13. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-78) a (1-84) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-78) (1-79) (1-80)



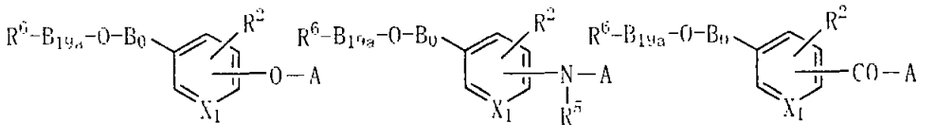
(1-81) (1-82) (1-83)



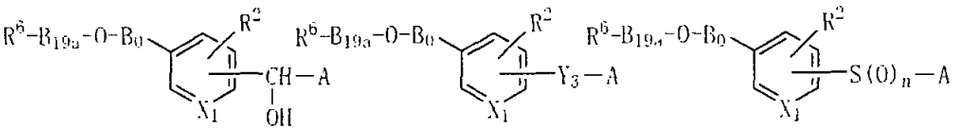
(1-84)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

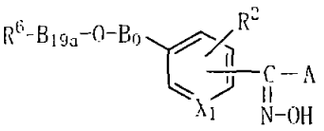
14. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-85) a (1-91) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-85) (1-86) (1-87)



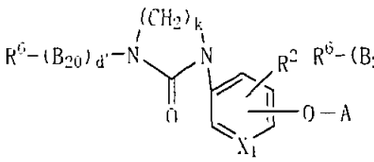
(1-88) (1-89) (1-90)



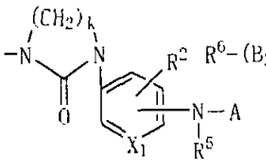
(1-91)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

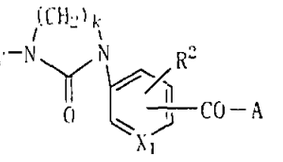
15. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-92) a (1-98) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



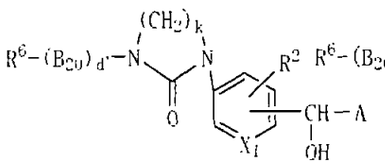
(1-92)



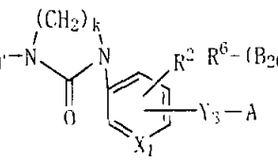
(1-93)



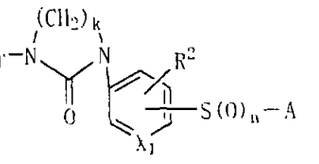
(1-94)



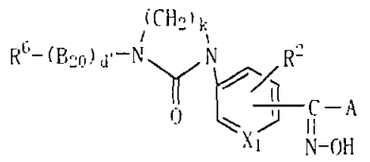
(1-95)



(1-96)



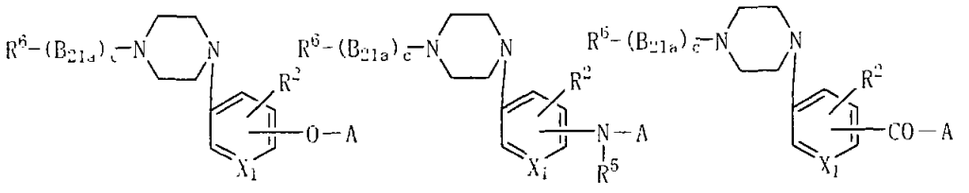
(1-97)



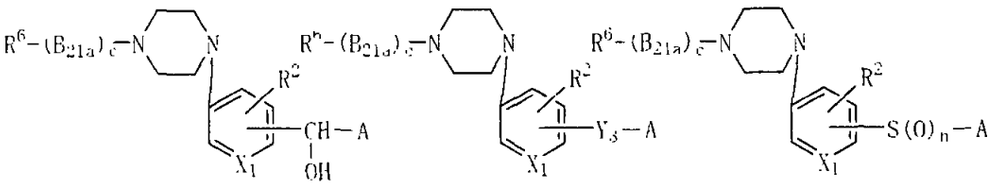
(1-98)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

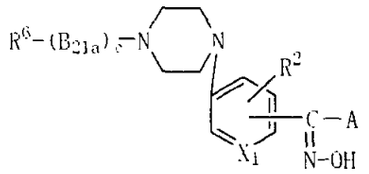
16. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-99) a (1-105) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-99) (1-100) (1-101)



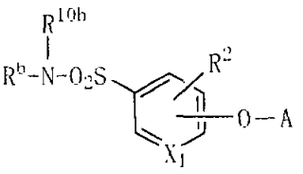
(1-102) (1-103) (1-104)



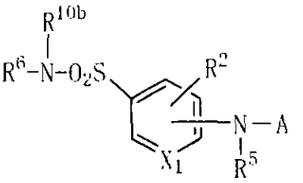
(1-105)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

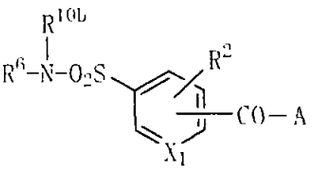
17. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-106) a (1-112) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



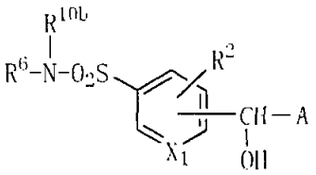
(1-106)



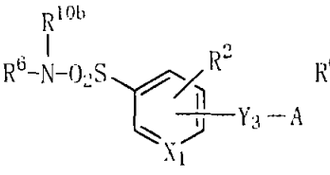
(1-107)



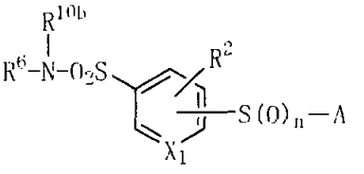
(1-108)



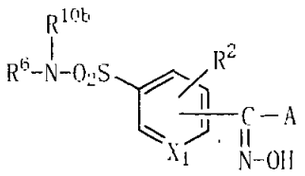
(1-109)



(1-110)



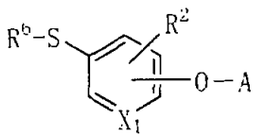
(1-111)



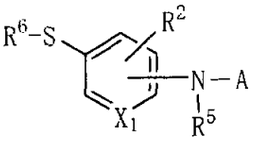
(1-112)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

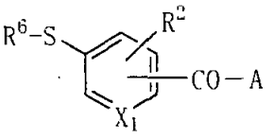
18. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-113) a (1-119) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



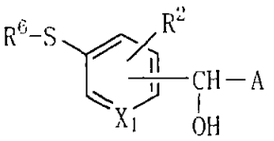
(1-113)



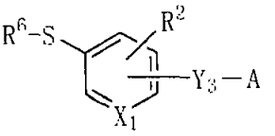
(1-114)



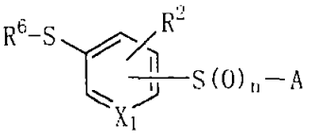
(1-115)



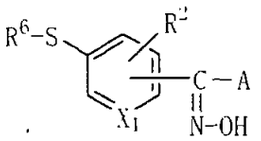
(1-116)



(1-117)



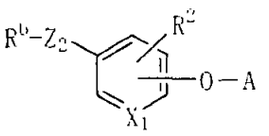
(1-118)



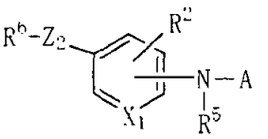
(1-119)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

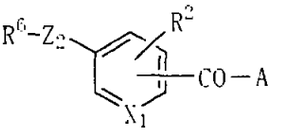
19. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-120) a (1-126) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



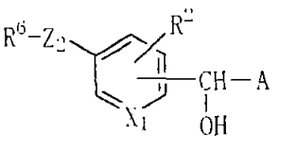
(1-120)



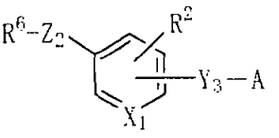
(1-121)



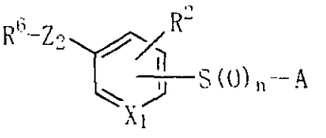
(1-122)



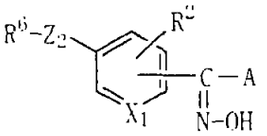
(1-123)



(1-124)



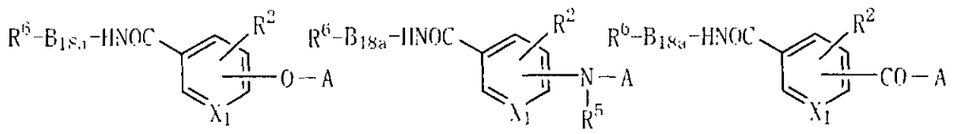
(1-125)



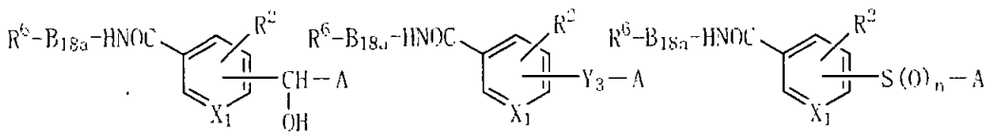
(1-126)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_2$ representa un grupo alquinileno inferior.

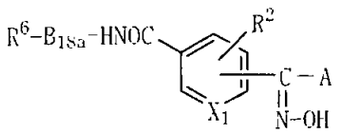
20. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-127) a (1-133) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



(1-127) (1-128) (1-129)



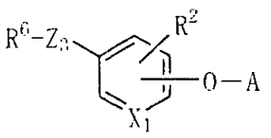
(1-130) (1-131) (1-132)



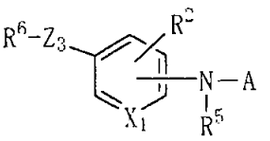
(1-133)

en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior.

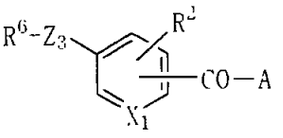
21. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-134) a (1-140) posteriores o una sal del mismo como un ingrediente activo:



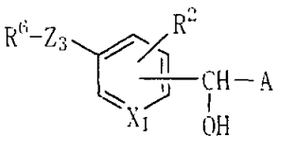
(1-134)



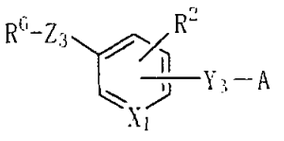
(1-135)



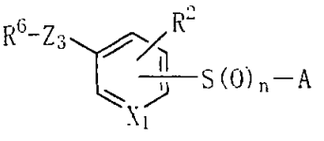
(1-136)



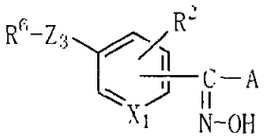
(1-137)



(1-138)



(1-139)



(1-140)

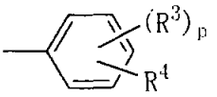
en donde $Y_3$ representa un grupo alquileno inferior y $Z_3$ representa un grupo alquileno inferior o un grupo $-N(R^{3d})-$.

22. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque Y es un grupo -O-.

23. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque Y es un grupo $-N(R^5)-$.

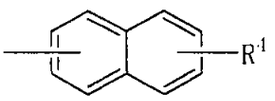
24. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque Y es un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)-, un grupo alquileno inferior, un grupo -S(O)n- o un grupo -C(=N-OH)-.

25. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque A es un grupo



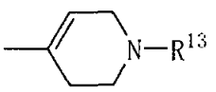
.

26. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque A es un grupo

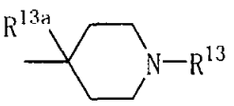


.

27. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,3-triazolil-alquilo inferior, un grupo 1,2,5-triazolil-alquilo inferior, un grupo pirazolil-alquilo inferior, un grupo pirimidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de pirimidina, un grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-iliden-alquilo inferior, un grupo 1,2,4-oxadiazolil-alquilo inferior que puede tener un grupo alquilo inferior como un sustituyente en el anillo de 1,2,4-oxadiazol, un grupo tiazolidinil-alquilo inferior que puede tener un grupo oxo como un sustituyente en el anillo de tiazolidina, un grupo



o un grupo



.

28. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque está representado por la fórmula general (1) en donde $R^4$ representa un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ (T, $R^{14}$ y $R^{15}$ son los mismos como se define anteriormente) y 1 representa 0.

29. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ y 1 es 1.

30. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-N(R^{17})-B_3-CO-$.

31. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$.

32. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_4-CO-$.

33. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-Q-B_5-CO-$.

34. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_6-N(R^{19})-B_7-$.

35. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CO-B_8-$.

36. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CH(OH)-B_9-$.

37. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CO-B_{10}-CO-$.

38. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CH(OH)-B_{11}-CO-$.

39. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-CO-$.

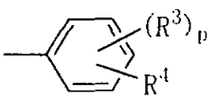
40. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-SO_2-$.

41. El inhibidor de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo $-B_{23a}-CO-CO-$.

42. El inhibidor de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque $R^4$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$, 1 es 1 y T es un grupo alquileno inferior.

43. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de los compuestos representados por las fórmulas generales (1-1), (1-2), (1-8), (1-9), (1-15), (1-16), (1-29), (1-30), (1-43), (1-44), (1-57), (1-58), (1-64) y (1-65) o una sal del mismo como un ingrediente activo, en donde Y es un grupo -O- o un grupo $-N(R^5)-$, A es un grupo



, y

$R^1$ es un grupo $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$.

44. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 43, caracterizado porque 1 es 1 y T es un grupo $-N(R^{17})-B_2-CO-$.

45. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 43, caracterizado porque 1 es 1 y T es un grupo $-B_1-CO-$.

46. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 43, caracterizado porque 1 es 1 y T es un grupo -CO-.

47. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 43, caracterizado porque 1 es 0.

48. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste de N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}fenoxi)-piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-3,4-diclorobencensulfonamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperazin-1-il}fenoxi)-piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)-piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[(4-{4-[2-(4-

piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenil)metilamino]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-{6-[4-(4-bencilpiperazin-1-carbonil)fenoxi]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[4-(4-bencilpiperazin-1-carbonil)fenoxi]piridin-3-il}-3,4-diclorobenzamida, N-[6-({4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenil}metilamino)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]etilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-fluorofenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}fenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, 1-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-3-(3,4-diclorofenil)-1-etilurea, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-il)-3-oxopropil]fenoxi}piridin-3-il)-4-trifluorometilbenzamida, N-

[6-{4-{[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-3,4-diclorobenzamida, N-(6-{4-[3-(4-piperonilpiperazin-1-carbonil)piperidin-1-il]fenoxi}piridin-3-il)-3,4-diclorobenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida, N-{6-[(4-{4-[2-(4-bencilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}fenil)metilamino]piridin-3-il}-4-trifluorometilbenzamida, N-(6-{4-[(2-{4-[4-(4-fluorobenzoil)fenil]piperazin-1-il}-2-oxoetil)metilamino]-2-metoxifenoxi}piridin-3-il)-4-trifluorometilbenzamida, 2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-N-{3-metil-4-[5-(4-trifluorometilfenoximetil)piridin-2-iloxi]fenil}-2-oxoacetamida, N-[6-(4-{[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]metilamino}-2-metilfenoxi)piridin-3-il]-2-fluoro-4-trifluorometilbenzamida, N-[6-(4-{4-[2-(4-piperonilpiperazin-1-il)-2-oxoetil]piperidin-1-il}-2-metoxifenoxi)piridin-3-il]-4-trifluorometilbenzamida y éster etílico del ácido 4-(3-{3-metil-4-[5-(4-trifluorometilbenzoilamino)piridin-2-iloxi]fenil}-2-oxohexahidropirimidin-1-il)benzoico, o una sal del mismo como un ingrediente activo.

49. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque en el compuesto aromático, $R^{14}$ y $R^{15}$, junto con el atomo de nitrógeno al cual

se unen, pueden unirse uno al otro, directamente o por vía de un átomo de nitrógeno para formar un grupo heterocíclico saturado de 6 miembros y en donde un grupo alquilo inferior sustituido por fenilo el cual puede ser sustituido en el anillo de fenilo por 1 a 2 grupos, como sustituyente(s), seleccionados del grupo que consiste de un grupo alcanoilo inferior, un grupo amino el cual puede tener un grupo alcanoilo inferior como sustituyente, un grupo alcoxicarbonilo inferior, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo alcoxi inferior el cual puede tener un átomo de halógeno como sustituyente, un grupo fenil-alcoxi inferior, un grupo hidroxilo y un grupo alquilendioxi inferior, está presente como un sustituyente en el grupo heterocíclico saturado.

50. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 49, caracterizado porque el grupo alquilo inferior sustituido por fenilo el cual es sustituido por un grupo alquilendioxi inferior está presente como sustituyente en un grupo piperadinilo el cual es el grupo heterocíclico saturado.

51. El inhibidor de conformidad con la reivindicacion 49 o 50, caracterizado porque $X_1$ es un átomo de nitrógeno e Y es un átomo de oxígeno.

52. El inhibidor de conformidad con la

reivindicación 1, caracterizado porque es para prevenir o tratar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT3.

53. El inhibidor de la activación de STAT3 de conformidad con la reivindicación 52, caracterizado porque el síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT3 es una enfermedad autoinmunitaria, diabetes, infección, enfermedad central, enfermedad asociada con el cáncer o psoriasis.

54. Un método, caracterizado porque es para prevenir o tratar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT3 al administrar, a un paciente, una cantidad efectiva de un compuesto aromático (1) o una sal del mismo de conformidad con la reivindicación 1.

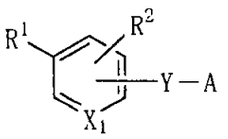
55. El inhibidor de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque es para prevenir o tatar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT5.

56. El inhibidor de conformidad con la reivindicacion 55, caracterizado porque el síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT5 es una enfermedad autoinmunitaria, alergia o hiperprolactinemia.

57. Un método, caracterizado porque es para prevenir o tratar un síntoma o enfermedad asociado con la activación de STAT5 al administrar, a un paciente, una cantidad efectiva de un compuesto aromático (1) o una sal del mismo de conformidad con la reivindicación 1.

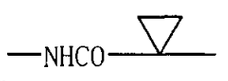
## RESUMEN DE LA INVENCION

Un objetivo de la presente invención es proporcionar un inhibidor de la activación de STAT3/5. La presente invención proporciona un inhibidor de la activación de STAT3/5 que contiene un compuesto aromático representado por la fórmula general o una sal del mismo como un ingrediente activo:

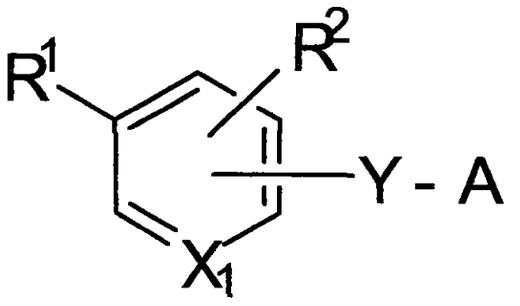


(1)

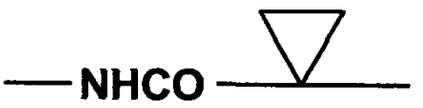
en donde $X_1$ representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CH=, $R_1$ representa un grupo -Z-$R^6$, en la cual Z representa un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)- o similares, $R^6$ representa un grupo heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico, dicíclico o tricíclico de 5 a 15 miembros que tiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, átomos de oxígeno o átomos de azufre, $R^2$ representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno, Y representa un grupo -O-, un grupo -CO-, un grupo -CH(OH)- o un grupo alquileno inferior y A representa un grupo

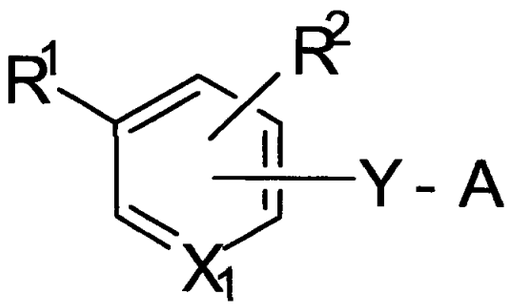


en donde $R^3$ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi inferior o similares, p representa 1 o 2, $R^4$ representa un grupo imidazolil-alquilo inferior o similares.

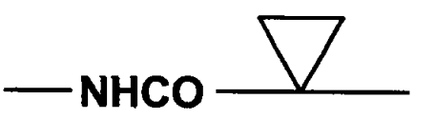



( 1 )






( 1 )



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/JP2007/069645

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D317/58 C07D405/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
EPO-Internal, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|---|---|---|
| X | US 3 182 085 A (PITCHFORTH JR LEHI L)<br>4 May 1965 (1965-05-04)<br>column 2; example 1 | 1 |
| X | WO 03/076406 A (MERCK PATENT GMBH [DE];<br>LARDY CLAUDE [FR]; FESTAL DIDIER [FR];<br>CAPUTO) 18 September 2003 (2003-09-18)<br>page 42; example 46a | 1 |
| X | FR 2 289 489 A (BAYER AG [DE])<br>28 May 1976 (1976-05-28)<br>page 12; example 17 | 1 |
| X | EP 1 211 235 A (ADCHEMCO CORP [JP] JFE<br>CHEMICAL CORP [JP])<br>5 June 2002 (2002-06-05)<br>page 8; example 8 | 1 |
| | -/-- | |

[X] Further documents are listed in the continuation of Box C.

[X] See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

| Date of the actual completion of the international search | Date of mailing of the international search report |
|---|---|
| 21 January 2008 | 28/01/2008 |

| Name and mailing address of the ISA/ | Authorized officer |
|---|---|
| European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2<br>NL – 2280 HV Rijswijk<br>Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,<br>Fax: (+31-70) 340-3016 | Jeanjean, Fabien |

2

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/JP2007/069645

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|---|---|---|
| X | US 4 978 672 A (BOWMAN ROBERT M [US] ET AL) 18 December 1990 (1990-12-18)<br>column 20, lines 3-5; example 3 | 1 |
| X | WO 2006/014012 A (OTSUKA PHARMA CO LTD [JP]; FUKUSHIMA TAE [JP]; MATSUMURA SHUJI [JP]; T) 9 February 2006 (2006-02-09)<br>cited in the application<br>page 675; example 582<br>page 726; example 1039<br>page 655; example 322<br>page 779; example 1049<br>page 716; example 940<br>page 864; example 2228<br>page 754; example 1202 | 1-57 |

2

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/JP2007/069645

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---|---|---|
| US 3182085 A | 04-05-1965 | BE 629102 A | |
| WO 03076406 A | 18-09-2003 | AU 2003205756 A1 | 22-09-2003 |
| | | BR 0308338 A | 01-02-2005 |
| | | CA 2478652 A1 | 18-09-2003 |
| | | CN 1639126 A | 13-07-2005 |
| | | EP 1483242 A1 | 08-12-2004 |
| | | FR 2836917 A1 | 12-09-2003 |
| | | JP 2005533002 T | 04-11-2005 |
| | | MX PA04008721 A | 06-12-2004 |
| | | US 2005154232 A1 | 14-07-2005 |
| | | UY 27716 A1 | 30-04-2003 |
| | | ZA 200408109 A | 20-10-2005 |
| FR 2289489 A | 28-05-1976 | BE 835036 A1 | 30-04-1976 |
| | | CH 618678 A5 | 15-08-1980 |
| | | DE 2452160 A1 | 06-05-1976 |
| | | GB 1494117 A | 07-12-1977 |
| | | JP 51125243 A | 01-11-1976 |
| | | NL 7512812 A | 04-05-1976 |
| EP 1211235 A | 05-06-2002 | NONE | |
| US 4978672 A | 18-12-1990 | NONE | |
| WO 2006014012 A | 09-02-2006 | AR 050448 A1 | 25-10-2006 |
| | | AU 2005268030 A1 | 09-02-2006 |
| | | BR PI0514150 A | 27-11-2007 |
| | | CA 2573223 A1 | 09-02-2006 |
| | | EP 1773797 A2 | 18-04-2007 |
| | | KR 20070103351 A | 23-10-2007 |
| | | US 2007270422 A1 | 22-11-2007 |

# REPORTE DE BUSQUEDA INTERNACIONAL

No. de solicitud internacional
PCT/JP2007/069645

**A. CLASIFICACION DEL TEMA**
INV. C07D317/58 C07D405/12

De acuerdo a la Clasificación de Patentes Internacional (IPC) o a tanto la clasificación nacional como la IPC

**B. CAMPOS BUSCADOS**

Documentación mínima buscada (sistema de clasificacion seguido por los símbolos de clasificación)
C07D

Documentacion buscada diferente a la documentación mínima, al grado que tales documentos están incluidos en los campos buscados:

Base de datos electrónica consultada durante la busqueda internacional (nombre de la base de datos y, en donde sea práctico, términos de busqueda utilizados):
EPO-Internal, Datos BEILSTEIN

**C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS QUE SON RELEVANTES**

| Categoría* | Cita del documento, con indicación, en donde sea apropiado, de los pasajes relevantes | Pertinente para la reivindicación No. |
|---|---|---|
| X | US 3 182 085 A (PITCHFORTH JR LEHI L)<br>4 de Mayo de 1965 (04-05-1965)<br>columna 2; ejemplo 1 | 1 |
| X | WO 03/076406 A (MERCK PATENT GMBH [DE]; LARDY CLAUDE [FR]; FESTAL DIDIER [FR]; CAPUTO) 18 de Septiembre de 2003 (18-09-2003)<br>página 42; ejemplo 46a | 1 |
| X | FR 2 289 489 A (BAYER AG [DE])<br>28 de Mayo de 1976 (28-05-1976)<br>página 12; ejemplo 17 | 1 |
| X | EP 1 211 235 A (ADCHEMCO CORP [JP] JFE CHEMICAL CORP [JP])<br>5 de Junio de 2002 (05-06-2002)<br>página 8; ejemplo 8 | 1 |

-/--

☒ Los documentos adicionales se listan en la continuación del cuadro C. ☒ Los miembros de la familia de patentes se listan en el anexo

*categorías especiales de los documentos citados:

"A" documento que define el estado general de la técnica, el cual no se considera que es de particular relevancia.

"E" primer documento publicado en o después de la fecha de presentación internacional.

"L" documento el cual puede arrojar dudas sobre la(s) reivindicación(es) de prioridad o el cual se cita para establecer la fecha de publicación de otra cita u otra razón especial (como se especifica)

"O" documento que se refiere a una descripción oral, uso, exhibición u otro medio

"P" documento publicado antes de la fecha de representación internacional pero después de la fecha de prioridad reivindicada.

"T" documento posterior publicado después de la fecha de presentación internacional o la fecha de prioridad y no en conflicto con la solicitud, pero citado para entender el principio o teoria fundamental de la invención.

"X" documento de relevancia particular; la invención reclamada no puede ser considerada nueva o no se puede considerar que involucra una paso inventivo cuando el documento se toma solo

"Y" documento de particular relevancia; no se puede considerar que la invención reclamada involucra un paso inventivo cuando el documento es combinado con uno o más de tales documentos, tal combinación que es obvia para una persona experimentada en la técnica.

"&" documento miembro de la misma familia de patentes.

| Fecha de la terminación actual de la búsqueda internacional | Fecha de envio del reporte de búsqueda internacional |
|---|---|
| 21 de Enero de 2008 | 28/01/2008 |
| **Nombre y dirección de correo de la ISA/** | **Funcionario autorizado** |
| Oficina Europea de Patentes, P.B. 5818 Patentlaan 2<br>NL- 2280 HV Rijswijk<br>Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.<br>Fax (+31-70) 340-3016 | *Jeanjean, Fabien* |

Forma PCT/ISA/210 (segunda hoja) (Abril de 2005)



REPORTE DE BUSQUEDA INTERNACIONAL

No. de solicitud internacional
PCT/JP2007/069645

| C (Continuación) DOCUMENTOS QUE SE CONSIDERAN PERTINENTES | | |
|---|---|---|
| Categoría* | Citación del documento, con indicación, donde es apropiado, de los pasajes pertinentes | Pertinente para la reivindicación No. |
| X | US 4 978 672 A (BOWMAN ROBERT M [US] Y COLABORADORES) 18 de Diciembre de 1990 (18-12-1990) columna 20, líneas 3-5; ejemplo 3 | 1 |
| X | WO 2006/014012 A (OTSUKA PHARMA CO LTD [JP]; FUKUSHIMA TAE [JP]; MATSUMURA SHUJI [JP]; T) 9 de Febrero de 2006 (09-02-2006) *citado en la solicitud* página 675; ejemplo 582 página 726; ejemplo 1039 página 655; ejemplo 322 página 779; ejemplo 1049 página 716; ejemplo 940 página 864; ejemplo 2228 página 754; ejemplo 1202 | 1-57 |

# REPORTE DE BUSQUEDA INTERNACIONAL

Información de miembros de familia de la patente

No. de Solicitud Internacional
PCT/JP2007/069645

| Documento de patente citado en el reporte de búsqueda | | Fecha de publicación | Miembro(s) de Familia de patentes | | Fecha de publicación |
|---|---|---|---|---|---|
| US 3182085 | A | 04-05-1965 | BE | 629102 A | |
| WO 03076406 | A | 18-09-2003 | AU | 2003205756 A1 | 22-09-2003 |
| | | | BR | 0308338 A | 01-02-2005 |
| | | | CA | 2478652 A1 | 18-09-2003 |
| | | | CN | 1639126 A | 13-07-2005 |
| | | | EP | 1483242 A1 | 08-12-2004 |
| | | | FR | 2836917 A1 | 12-09-2003 |
| | | | JP | 2005533002 T | 04-11-2005 |
| | | | MX | PA04008721 A | 06-12-2004 |
| | | | US | 2005154232 A1 | 14-07-2005 |
| | | | UY | 27716 A1 | 30-04-2003 |
| | | | ZA | 200408109 A | 20-10-2005 |
| FR 2289489 | A | 28-05-1976 | BE | 835036 A1 | 30-04-1976 |
| | | | CH | 618678 A5 | 15-08-1980 |
| | | | DE | 2452160 A1 | 06-05-1976 |
| | | | GB | 1494117 A | 07-12-1977 |
| | | | JP | 51125243 A | 01-11-1976 |
| | | | NL | 7512812 A | 04-05-1976 |
| EP 1211235 | A | 05-06-2002 | NINGUNO | | |
| US 4978672 | A | 18-12-1990 | NINGUNO | | |
| WO 2006014012 | A | 09-02-2006 | AR | 050448 A1 | 25-10-2006 |
| | | | AU | 2005268030 A1 | 09-02-2006 |
| | | | BR | PI0514150 A | 27-11-2007 |
| | | | CA | 2573223 A1 | 09-02-2006 |
| | | | EP | 1773797 A2 | 18-04-2007 |
| | | | KR | 20070103351 A | 23-10-2007 |
| | | | US | 2007270422 A1 | 22-11-2007 |

316

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

# REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
## PCT

PATENTE DE INVENCION [X] MODELO DE UTILIDAD [ ]

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [✓]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [✓]
- Descripción de la invención [✓]
- Dibujos de ser estos pertinentes [✓]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas [✓]

COMPLETA [✓] INCOMPLETA [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial [ ]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [ ]
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño [ ]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas [ ]

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

ESQUEMA DE TRAZADO [ ]

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado [ ]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [ ]
- Representación gráfica del esquema trazado [ ]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas [ ]

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

Firma Responsable

Fecha

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-032181- -00000-0000
Fecha: 2009-03-30 10:58:03 Dep: 2020 NUEGREACION
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act: 411 PRESENTACION Folios: 315

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogota, D.C., Colombia