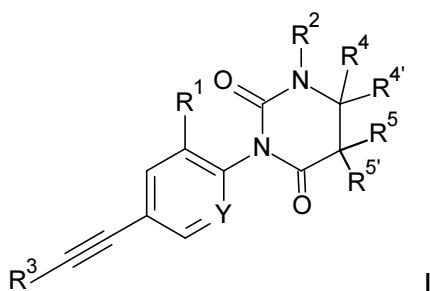


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



I

en el que

Y es N o C-R^{1'};

R^{1'} es hidrógeno o F;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₇ sustituido con halógeno;

R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o R² forma junto con R⁴ un anillo heterocíclico de 6 miembros que contiene

—CH₂—CH₂—O—CH₂— o —CH₂—CH₂—NR—C(O)—;

R es hidrógeno, alquilo C₁₋₇, fenilo o bencilo;

R³ es fenilo o piridinilo, en el que el átomo de N en el grupo de piridinilo puede estar en diferentes posiciones;

R^{4'} es hidrógeno, alquilo C₁₋₇ o alcoialquilo C₁₋₇;

R⁴ es hidrógeno, alquilo C₁₋₇, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno o alcoxi C₁₋₇, o es cicloalquilo, o es piridinilo opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₇, alcoxi C₁₋₇ o =O, o es pirimidinilo opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₇, alcoxi C₁₋₇ o =O, o es 1- alquilo C₁₋₇-piridinilo, o es pirazinilo, o es piridazinilo opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₇, alcoxi C₁₋₇ o =O, o es 1-metilpirrolo[2,3-b]piridin-5-il, o es 6-imidazo[1,2-b]piridazin-6-il;

o R⁴ forma junto con R^{4'} un anillo heterocíclico de 4, 5 o 6 miembros que contiene

—(CH₂)₅—, —CH₂—CH₂—O—CH₂—CH₂—, —CH₂—CH₂—CH₂—, —CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—,

—CH₂—O—CH₂—CH₂— or CH₂—CH₂—CH₂—O—CH₂—;

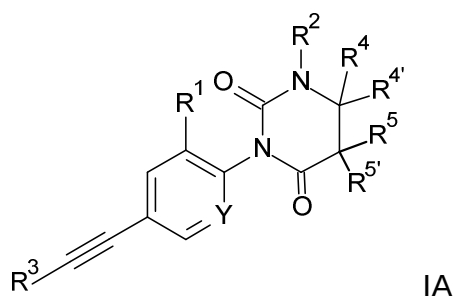
R⁵ y R^{5'} son hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o R⁴ forma junto con R⁵ un anillo saturado de 5 miembros que contiene



o una sal farmacéuticamente aceptable o sal de adición de ácido, una mezcla racémica, o su correspondiente enantiómero y/o isómero óptico y/o estereoisómero del mismo.

2. Un compuesto de fórmula IA de acuerdo con la reivindicación 1,



en los que

Y es N o C-R^{1'};

R^{1'} es hidrógeno o F;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₇ sustituido con halógeno;

R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

R³ es fenilo o piridinilo, en el que el átomo de N en el grupo de piridinilo puede estar en diferentes posiciones;

R^{4'} es hidrógeno, alquilo C₁₋₇ o alcoialquilo C₁₋₇;

R⁴ es hidrógeno, alquilo C₁₋₇, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno o alcoxí C₁₋₇, o es cicloalquilo, o es piridinilo opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₇, alcoxí C₁₋₇ o =O, o es pirimidinilo opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₇, alcoxí C₁₋₇ o =O, o es 1-alquilo C₁₋₇-piridinilo, o es pirazinilo, o es piridazinilo opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₇, alcoxí C₁₋₇ o =O, o es 1-metilpirrolo[2,3-b]piridin-5-il, o es 6-imidazo[1,2-b]piridazin-6-il;

R⁵ y R^{5'} son hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o una sal farmacéuticamente aceptable o sal de adición de ácido, una mezcla racémica, o su correspondiente enantiómero y/o isómero óptico y/o estereoisómero del mismo.

3. Un compuesto de fórmula IA de acuerdo con la reivindicación 2, en el que los compuestos son

3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6,6-trimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

3-[2-cloro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6,6-trimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(5RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,5,6,6-tetrametil-hexahidropirimidina-2,4-

diona

3-[2-cloro-6-fluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1,6,6-trimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

3-[2-cloro-6-fluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1-etil-6,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1-etil-6-metil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-6-etil-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6R)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-6,6-dietil-hexahidropirimidina-2,4-diona

3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-6,6-dietil-1-metil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-1,6-dimetil-6-fenil-3-[5-(2-feniletinitil)-2-piridil]hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-1,6-dimetil-6-fenil-3-[4-(2-feniletinitil)fenil]hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-6-isopropil-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-(2-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-(4-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-1,6-dimetil-6-(3-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinitil)fenil]-6-(metoximetil)-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-6-ciclohexil-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[3-cloro-5-(2-feniletinitil)-2-piridil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2-cloro-6-fluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1,6-dimetil-6-(3-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6RS)-3-[2-cloro-6-fluoro-4-[2-(3-piridil)etinitil]fenil]-1,6-dimetil-6-fenil-

hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-6-(3-clorofenil)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-6-(2-clorofenil)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-6-(4-clorofenil)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-6-(3-metoxifenil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-6-tert-butil-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-6-metil-hexahidropirimidina-
 2,4-diona
 (6RS)-6-tert-butil-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-3-[3-fluoro-5-(2-feniletinin)-2-piridil]-1,6-dimetil-6-fenil-hexahidropirimidina-
 2,4-diona
 (6RS)-1,6-dimetil-6-fenil-3-[5-(2-feniletinin)-3-(trifluorometil)-2-
 piridil]hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-3-[2-Cloro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-(3-piridil)hexahidropirimidina-
 2,4-diona
 (6RS)-3-[2,6-Difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-6-etil-1-metil-6-fenil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-(3-piridil)hexahidropirimidina-
 2,4-diona
 (6S)-3-[3-Fluoro-5-(2-feniletinin)-2-piridil]-1,6-dimetil-6-(3-piridil)hexahidropirimidina-
 2,4-diona
 (6RS)-6-(6-Cloro-3-piridil)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1-etil-6-metil-6-(3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-[2-(3-piridil)etinin]fenil]-1,6-dimetil-6-(3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-(6-metil-3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-pirimidin-4-il-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-pirimidin-5-il-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinin)fenil]-1,6-dimetil-6-pyrazin-2-il-

hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-piridazin-3-il-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(5-fluoro-3-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-6-(2-Cloro-4-piridil)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-piridazin-4-il-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(2-metil-4-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(6-metoksi-3-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-6-(2-Cloro-4-piridil)-3-[2,6-difluoro-4-[2-(3-piridil)etinil]fenil]-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(6-oxo-1H-piridin-3-
 il)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(1-metil-6-oxo-3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(1-etil-6-oxo-3-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(1-isopropyl-6-oxo-3-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(6-isopropoxy-3-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-isopropyl-6-metil-6-(3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2-Cloro-6-fluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(3-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6RS)-3-[2,6-Difluoro-4-[2-(3-piridil)etinil]fenil]-1-metil-6-fenil-6-
 (trifluorometil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(2-metoksi-4-piridil)-1,6-dimetil-
 hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(2-oxo-1H-piridin-4-
 il)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(1-metil-2-oxo-4-
 piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona
 (6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(2-metilpirimidin-4-

il)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-etil-6-metil-6-(2-metil-4-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(4-piridil)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(2-metoxipirimidin-5-il)-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(2-oxo-1H-pirimidin-5-il)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-(6-metoxipiridazin-3-il)-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona

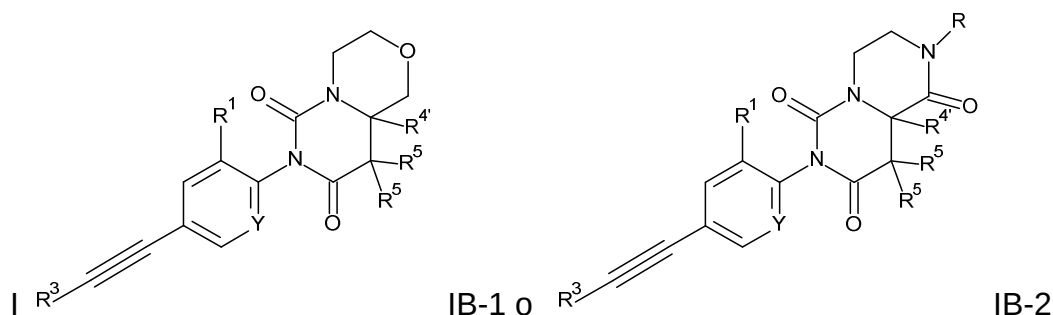
(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(6-oxo-1H-piridazin-3-il)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(1-metil-6-oxo-piridazin-3-il)hexahidropirimidina-2,4-diona

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,6-dimetil-6-(1-metilpirrolo[2,3-b]piridin-5-il)hexahidropirimidina-2,4-diona o

(6S)-3-[2,6-Difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-imidazo[1,2-b]piridazin-6-il-1,6-dimetil-hexahidropirimidina-2,4-diona.

4. Un compuesto de fórmulas IB-1 o IB-2 de acuerdo con la reivindicación 1



en los que

Y es N o C-R^{1'};

R^{1'} es hidrógeno o F;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₇ sustituido con halógeno;

R es hidrógeno, alquilo C₁₋₇, fenilo o bencilo;

R³ es fenilo o piridinilo, en el que el átomo de N en el grupo de piridinilo puede estar en diferentes posiciones;

R^{4'} es hidrógeno, alquilo C₁₋₇ o alcoxialquilo C₁₋₇;

R⁵ y R^{5'} son hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o una sal farmacéuticamente aceptable o sal de adición de ácido, una mezcla racémica, o su correspondiente enantiómero y/o isómero óptico y/o

estereoisómero del mismo.

5. Un compuesto de fórmulas IB-1 o IB-2 de acuerdo con la reivindicación 4, en el que los compuestos son

(9aRS)-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-3,4,9,9a-tetrahidro-1H-pirimido[6,1-c][1,4]oxazina-6,8-diona

(9aRS)-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-9a-metil-2,3,4,9-tetrahidropirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona

(9aRS)-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-2,9a-dimetil-4,9-dihidro-3H-pirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona

(9aRS)-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-2-isopropil-9a-metil-4,9-dihidro-3H-pirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona

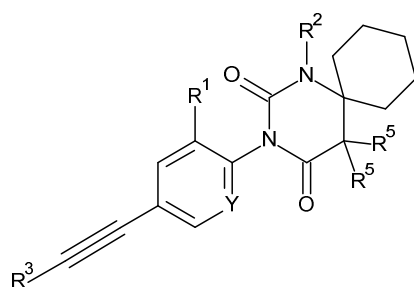
(9aRS)-2-bencil-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-9a-metil-4,9-dihidro-3H-pirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona

(9aRS)-7-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-9a-metil-2-fenil-4,9-dihidro-3H-pirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona

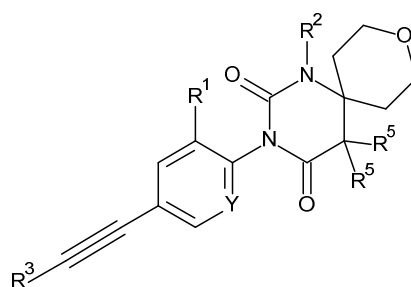
o

(9aRS)-7-[2-Cloro-6-fluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-9a-metil-2,3,4,9-tetrahidropirazino[1,2-c]pirimidina-1,6,8-triona.

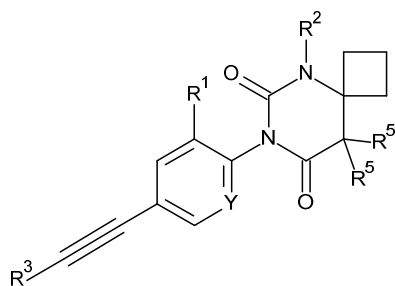
6. Un compuesto de fórmulas IC-1, IC-2, IC-3, IC-4, IC-5 e IC-6 de acuerdo con la reivindicación 1



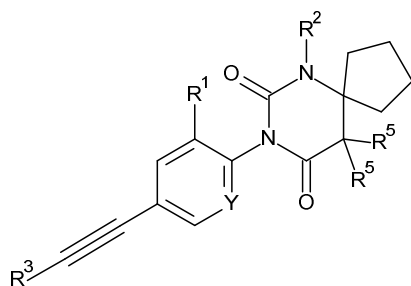
IC-1,



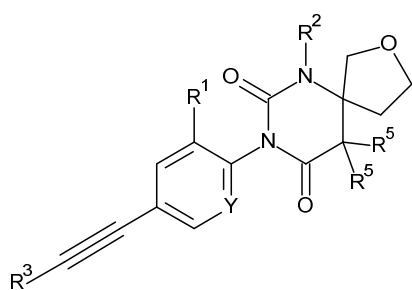
IC-2



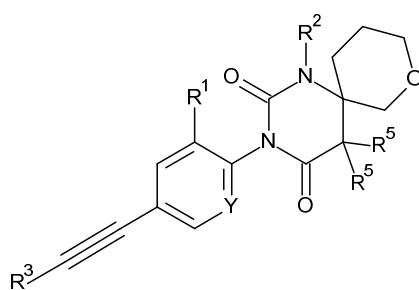
IC-3,



IC-4



IC-5,



IC-6

en los que

Y es N o C-R^{1'};

R^{1'} es hidrógeno o F;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₇ sustituido con halógeno;

R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

R³ es fenilo o piridinilo, en el que el átomo de N en el grupo de piridinilo puede estar en diferentes posiciones;

R⁵ y R^{5'} son hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o una sal farmacéuticamente aceptable o sal de adición de ácido, una mezcla racémica, o su correspondiente enantiómero y/o isómero óptico y/o estereoisómero del mismo.

7. Un compuesto de fórmulas IC-1, IC-2, IC-3, IC-4, IC-5 e IC-6 de acuerdo con la reivindicación 6, en el que los compuestos son

3-[2-cloro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-metil-1,3-diazaespiro[5.5]undecano-2,4-diona

3-[2-cloro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-metil-9-oxa-1,3-diazaespiro[5.5]undecano-2,4-diona

7-[2-cloro-4-(2-feniletinil)fenil]-5-metil-5,7-diazaespiro[3.5]nonano-6,8-diona

8-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-metil-6,8-diazaespiro[4.5]decano-7,9-diona

(5RS)-8-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-6-metil-2-oxa-6,8-

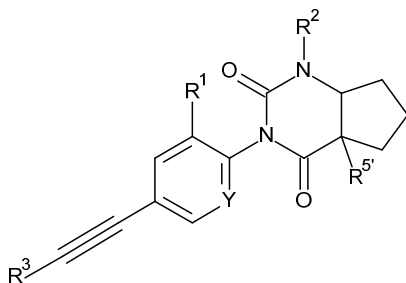
diazaespiro[4.5]decano-7,9-diona

o

(6RS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-metil-8-oxa-1,3-

diazaespiro[5.5]undecano-2,4-diona.

8. Un compuesto de fórmula ID de acuerdo con la reivindicación 1



ID

en los que

Y es N o C-R^{1'};

R^{1'} es hidrógeno o F;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₇ sustituido con halógeno;

R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

R³ es fenilo o piridinilo, en el que el átomo de N en el grupo de piridinilo puede estar en diferentes posiciones;

R^{5'} es hidrógeno o alquilo C₁₋₇;

o una sal farmacéuticamente aceptable o sal de adición de ácido, una mezcla racémica, o su correspondiente enantiómero y/o isómero óptico y/o estereoisómero del mismo.

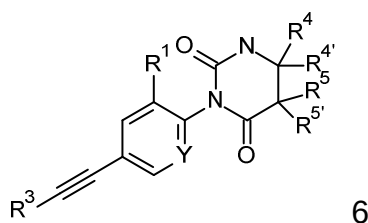
9. Un compuesto de fórmula ID de acuerdo con la reivindicación 8, en el que los compuestos son

(4aRS,7aSR)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1-metil-5,6,7,7a-tetrahidro-4aH-ciclopenta[d]pirimidina-2,4-diona o

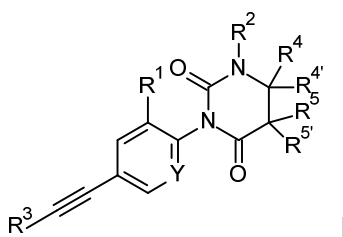
(4aRS,7aRS)-3-[2,6-difluoro-4-(2-feniletinil)fenil]-1,7a-dimetil-4a,5,6,7-tetrahidrociclopenta[d]pirimidina-2,4-diona.

10. Un proceso para la fabricación de un compuesto de fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, comprendiendo dicho método

a) alquilar un compuesto de fórmula



con R²-I en presencia de NaH o Cs₂CO₃ en DMF para dar un compuesto de fórmula



en el que los sustituyentes se describen en la reivindicación 1, o si se desea, convertir los compuestos obtenidos en sales de adición de ácido farmacéuticamente aceptables.

11. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 - 9 para su uso como sustancias terapéuticamente activas.

12. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1- 9 para su uso en el tratamiento de la enfermedad de Parkinson, ansiedad, emesis, trastorno obsesivo-compulsivo, autismo, neuroprotección, cáncer, depresión y diabetes de tipo 2.

13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula I según una cualquiera de las reivindicaciones 1 - 9 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

14. El uso de un compuesto de fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 - 9 para la preparación de un medicamento para el tratamiento de la enfermedad de Parkinson, ansiedad, emesis, trastorno obsesivo-compulsivo, autismo, neuroprotección, cáncer, depresión y diabetes de tipo 2.