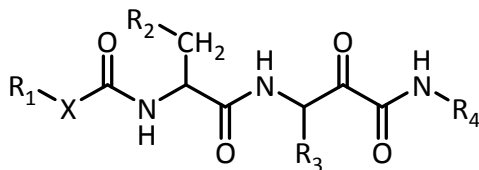


REIVINDICACIONES

1. Compuesto de fórmula (I):



5

en la que

X se selecciona del grupo que consiste en un enlace sencillo, un átomo de oxígeno y un grupo -NH-;

cuando X es O, R₁ se selecciona del grupo que consiste en

10

a) alquilo C₁₋₈, opcionalmente sustituido con un grupo alcoxilo C₁₋₈, b) (aril C₆₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ y c) (heteroaril C₅₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ en el que el resto heteroarilo C₅₋₁₀ comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre,

15

cuando X es un enlace sencillo o un grupo -NH-, R₁ se selecciona del grupo que consiste en d) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado; alcoxilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; e) naftilo

20

opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, alcoxilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; f) (heterociclil C₅₋₁₀)-alquilo C₀₋₂ en el que el resto heterociclilo está

25

saturado o insaturado y comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; g) alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con un grupo alcoxilo C₁₋₈ y h) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido

30

con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH₂, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno;

5 R₂ se selecciona del grupo que consiste en i) alquilo C₁₋₈ opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 átomos de flúor, j) (alcoxi C₁₋₈)-O-alquilo C₁₋₈ y k) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ en el que el anillo de cicloalquilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 átomos de flúor;

10 R₃ se selecciona del grupo que consiste en l) alquilo C₁₋₈ y m) bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁₋₄, MeO, CN y átomos de halógeno;

15 R₄ se selecciona del grupo que consiste en n) alquilo C₁₋₈, o) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₄ y p) alcoxilo C₁₋₈; y

R₅ y R₆ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en átomos de hidrógeno y grupos alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado;

20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para su uso en el tratamiento y/o la prevención de un estado relacionado con la obesidad seleccionado del grupo que consiste en obesidad, lipidosis e hiperlipidemia.

2. Compuesto de fórmula (I) para su uso según la reivindicación 1, en el que:

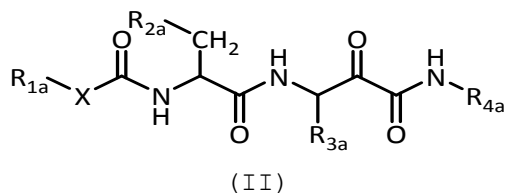
25 X se selecciona del grupo que consiste en un enlace sencillo, un átomo de oxígeno y un grupo -NH-, cuando X es O, R₁ se selecciona del grupo que consiste en a) alquilo C₁₋₈, b) (aril C₆₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ y c) (heteroaril C₅₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ en el que el resto heteroarilo C₅₋₁₀ comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre,

30 cuando X es un enlace sencillo o un grupo -NH-, R₁ se selecciona del grupo que consiste en d) fenilo
35 opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes

- seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado; alcoxilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; e) naftilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado, alcoxilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; f) (heterociclilo C_{5-10})-alquilo C_{0-2} en el que el resto heterociclilo está saturado o insaturado y comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; g) alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y h) (cicloalquil C_{3-6})-alquilo C_{0-2} opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno;
- R_2 se selecciona del grupo que consiste en i) alquilo C_{1-8} , j) (alcoxi C_{1-8})-O-alquilo C_{1-8} y k) (cicloalquil C_{3-6})-alquilo C_{0-2} ;
- R_3 se selecciona del grupo que consiste en l) alquilo C_{1-8} y m) bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_{1-4} , MeO, CN y átomos de halógeno;
- R_4 se selecciona del grupo que consiste en n) alquilo C_{1-8} y o) (cicloalquil C_{3-6})-alquilo C_{0-2} opcionalmente sustituido con alquilo C_{1-4} ; y
- R_5 y R_6 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en átomos de hidrógeno y grupos alquilo C_{1-6} lineal o ramificado;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
3. Compuesto de fórmula (I) para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que X es un enlace sencillo.

4. Compuesto de fórmula (I) para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R_1 se selecciona del grupo que consiste en d) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado, alcoxilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; y f) (heterociclil C_{5-10})-alquilo C_{0-2} en el que el resto heterociclilo está saturado o insaturado y comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno.
5. Compuesto de fórmula (I) para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R_2 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_{2-5} lineal o ramificado y cicloalquilo C_{3-5} .
6. Compuesto de fórmula (I) para su uso según la reivindicación 5, en el que R_2 se selecciona del grupo que consiste en isopropilo, propilo y ciclopropilo, preferiblemente isopropilo.
7. Compuesto de fórmula (I) para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R_3 es bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_{1-4} , MeO, CN y átomos de halógeno.
8. Compuesto de fórmula (I) para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R_4 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_{2-5} lineal o ramificado y cicloalquilo C_{3-5} ambos opcionalmente sustituidos con alquilo C_{1-4} .
9. Compuesto de fórmula (I) para su uso según la reivindicación 8, en el que R_4 se selecciona del grupo que consiste en etilo, terc-butilo y ciclopropilo.

10. Uso de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para la fabricación de un medicamento para el tratamiento y/o la prevención de un estado relacionado con la obesidad seleccionado del grupo que consiste en obesidad, lipidosis e hiperlipidemia.
11. Método de tratamiento y/o prevención de un estado relacionado con la obesidad seleccionado del grupo que consiste en obesidad, lipidosis e hiperlipidemia en un sujeto que lo necesita, que comprende administrar a dicho sujeto una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
12. Uso no terapéutico de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para reducir la acumulación de grasa en un sujeto que no padece obesidad.
13. Uso según la reivindicación 12, en el que la reducción de acumulación de grasa va dirigida a mejorar el aspecto corporal de dicho sujeto.
14. Compuesto de fórmula (II)



en la que

X se selecciona del grupo que consiste en un enlace sencillo, un átomo de oxígeno y un grupo -NH-;

cuando X es O, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en a1) alquilo C₁₋₈, opcionalmente sustituido con un grupo alcoxilo C₁₋₈, b1) (aril C₆₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ y c1)

(heteroaril C₅₋₁₀)-alquilo C₁₋₄ en el que el resto heteroarilo C₅₋₁₀ comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre,

5 cuando X es un enlace sencillo, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en d1) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, alcoxilo C₁₋₆ lineal o ramificado y

10 átomos de halógeno; e1) naftilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, alcoxilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; f1) (heterociclil C₅₋₁₀)-alquilo C₀₋₂ en el que

15 el resto heterociclilo comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH₂, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y

20 átomos de halógeno; g1) alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con un grupo alcoxilo C₁₋₈ y h1) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o

25 ramificado y átomos de halógeno;

cuando X es un grupo -NH-, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en d2) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH₂, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o

30 ramificado y átomos de halógeno; e2) naftilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH₂, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; f2) (heterociclil C₅₋₁₀)-alquilo C₀₋₂ en el que el resto

35 heterociclilo comprende de 1 a 3 heteroátomos

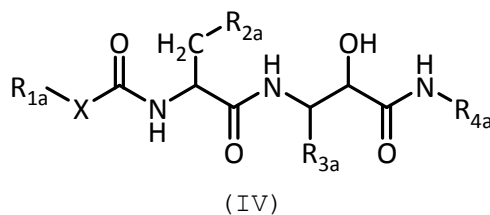
- seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; g2) alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado, opcionalmente sustituido con un grupo alcoxilo C₁₋₈ y h2) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno;
- R_{2a} se selecciona del grupo que consiste en i1) alquilo C₁₋₈ opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 átomos de flúor, j1) (alcoxi C₁₋₈)-alquilo C₁₋₈ y k1) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ en el que el anillo de cicloalquilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 átomos de flúor con la condición de que cuando X es O entonces R_{2a} no es un grupo isopropilo;
- R_{3a} se selecciona del grupo que consiste en l1) alquilo C₁₋₈ y m1) bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁₋₄, MeO, CN y átomos de halógeno con la condición de que cuando X es un enlace sencillo y R_{1a} es un grupo (heterociclil C₅₋₁₀)-alquilo C₀₋₂, R_{3a} no es un grupo etilo;
- R_{4a} se selecciona del grupo que consiste en n1) alquilo C₁₋₈, o1) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₄ y p1) alcoxilo C₁₋₈; y
- R₅ y R₆ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en átomos de hidrógeno y grupos alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
15. Compuesto de fórmula (II) según la reivindicación 14, en el que:
- X se selecciona del grupo que consiste en un enlace sencillo, un átomo de oxígeno y un grupo -NH-,

- cuando X es O, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en a1) alquilo C_{1-8} , b1) (aril C_{6-10})-alquilo C_{1-4} y c1) (heteroaril C_{5-10})-alquilo C_{1-4} en el que el resto heteroarilo C_{5-10} comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre,
- cuando X es un enlace sencillo, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en d1) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, $NR_{5a}R_{6a}$, CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado, alcoxilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; e1) naftilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, $NR_{5a}R_{6a}$, CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado, alcoxilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; f1) (heterociclil C_{5-10})-alquilo C_{0-2} en el que el resto heterociclilo comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_5R_6 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; g1) alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y h1) (cicloalquil C_{3-6})-alquilo C_{0-2} opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, $NR_{5a}R_{6a}$, CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno;
- cuando X es un grupo -NH-, R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en d2) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH_2 , CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; e2) naftilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, $NR_{5a}R_{6a}$, CN, CF_3 , alquilo C_{1-6} lineal o ramificado y átomos de halógeno; f2) (heterociclil C_{5-10})-alquilo C_{0-2} en el que

- el resto heterociclico comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR_{5a}R_{6a}, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno; g2) alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y h2) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NH₂, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y átomos de halógeno;
- R_{2a} se selecciona del grupo que consiste en i1) alquilo C₁₋₈, j1) (alcoxi C₁₋₈)-alquilo C₁₋₈ y k1) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ con la condición de que cuando X es O entonces R_{2a} no es un grupo isopropilo,
- R_{3a} se selecciona del grupo que consiste en l1) alquilo C₁₋₈ y m1) bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁₋₄, MeO, CN y átomos de halógeno con la condición de que cuando X es un enlace sencillo y R_{1a} es un grupo (heterociclico C₅₋₁₀)-alquilo C₀₋₂, R_{3a} no es un grupo etilo;
- R_{4a} se selecciona del grupo que consiste en n1) alquilo C₁₋₈ y o1) (cicloalquil C₃₋₆)-alquilo C₀₋₂ opcionalmente sustituido con alquilo C₁₋₄; y
- R_{5a} y R_{6a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en átomos de hidrógeno y grupos alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
16. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 15, en el que o bien (i) X se selecciona del grupo que consiste en O y NH y R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en a1) alquilo C₁₋₆ o bien ii) X es un enlace sencillo y el grupo R_{1a} se selecciona del grupo que consiste en d1) fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes

- seleccionados del grupo que consiste en CN, CF₃, alquilo C₁₋₃ lineal o ramificado; y átomos de halógeno y f1) heterociclilo C₅₋₁₀ en el que el resto heterociclilo es heteroaromático y comprende de 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre y está opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, NR₅R₆, CN, CF₃, alquilo C₁₋₆ lineal o ramificado y halógeno.
- 10 17. Compuesto de fórmula (II) según la reivindicación 16, en el que X es un enlace sencillo.
- 15 18. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 17, en el que el grupo R_{2a} se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₂₋₅ lineal o ramificado y cicloalquilo C₃₋₅ con la condición de que cuando X es O entonces R_{2a} no es un grupo isopropilo.
- 20 19. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 18, en el que el grupo R_{2a} se selecciona del grupo que consiste en isopropilo, propilo y ciclopropilo, preferiblemente isopropilo, con la condición de que cuando X es O entonces R_{2a} no es un grupo isopropilo.
- 25 20. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 19, en el que el grupo R_{3a} es bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁₋₄, MeO, CN y átomos de halógeno.
- 30 21. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 20, en el que el grupo R_{4a} se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₂₋₅ lineal o ramificado y cicloalquilo C₃₋₅ ambos opcionalmente sustituidos con alquilo C₁₋₄.
- 35 22. Compuesto de fórmula (II) según la reivindicación 21, en el que el grupo R_{4a} se selecciona del grupo que consiste en etilo, terc-butilo y ciclopropilo.

23. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 22, que comprende la reacción de un compuesto de fórmula (IV) con peryodinano de Dess-Martin



en la que X, R_{1a} , R_{2a} , R_{3a} y R_{4a} son según cualquiera de las reivindicaciones 14 a 22.

24. Composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 22 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.
25. Compuesto de fórmula (II) según una cualquiera de las reivindicaciones 14 a 22 para su uso como medicamento.