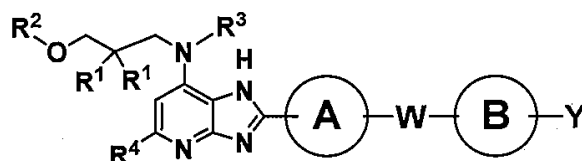


REIVINDICACIONES

Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes reivindicaciones:

1. Un agente terapéutico o agente profiláctico para un trastorno gastrointestinal funcional, que comprende un compuesto de azabencimidazol, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o un solvato del mismo, como un ingrediente activo, caracterizado porque el compuesto de azabencimidazol es un compuesto de la fórmula [1]:



[1]

en donde:

R^1 es un átomo de hidrógeno o alquilo, o los dos R^1 se combinan con el átomo de carbono adyacente para formar un cicloalquilo de 3 a 7 miembros o un heterociclo no aromático que contiene oxígeno;

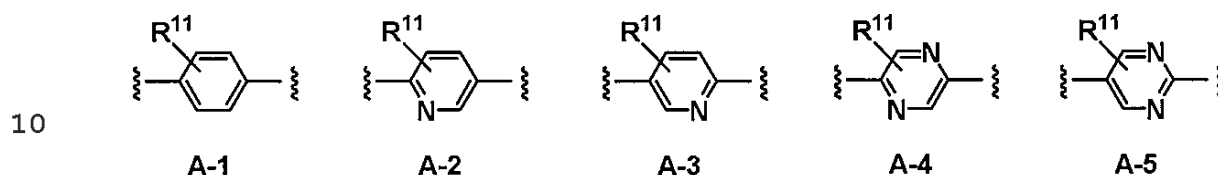
R^2 es un átomo de hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, alquilo sustituido con cicloalquilo o alcoxialquilo;

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo;

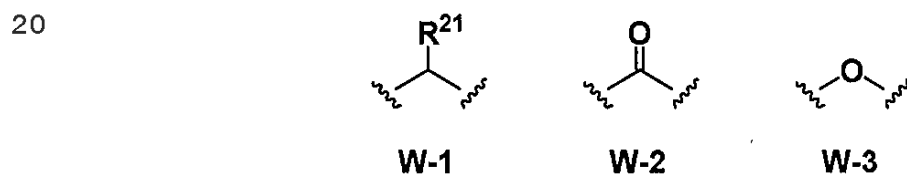
R^4 es piridilo opcionalmente sustituido con uno o dos

grupos seleccionados del grupo que consiste de alquilo, trihaloalquilo, alcoxi, ciano y cicloalquilo, o fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de trihaloalquilo, halógeno, alcoxi y cicloalquilo;

A es un grupo de la fórmula A-1, A-2, A-3, A-4 o A-5:

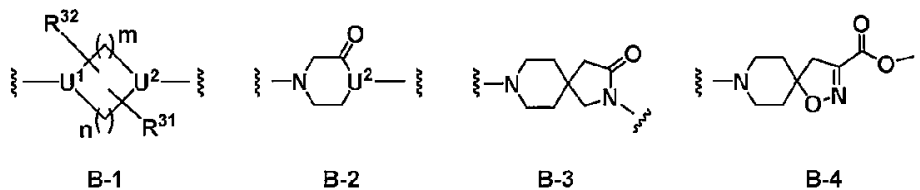


15 en donde el enlace en el lado izquierdo de cada grupo se une a la posición 2 del azabencimidazol en la fórmula [1], el enlace en el lado derecho se une a W en la fórmula [1], y R¹¹ es un grupo seleccionado de un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi y nitro; W es un enlace o un grupo de la fórmula W-1, W-2 o W-3:



en donde R²¹ es un átomo de hidrógeno o alquilo;

25 B es un grupo de la fórmula B-1, B-2, B-3 o B-4:

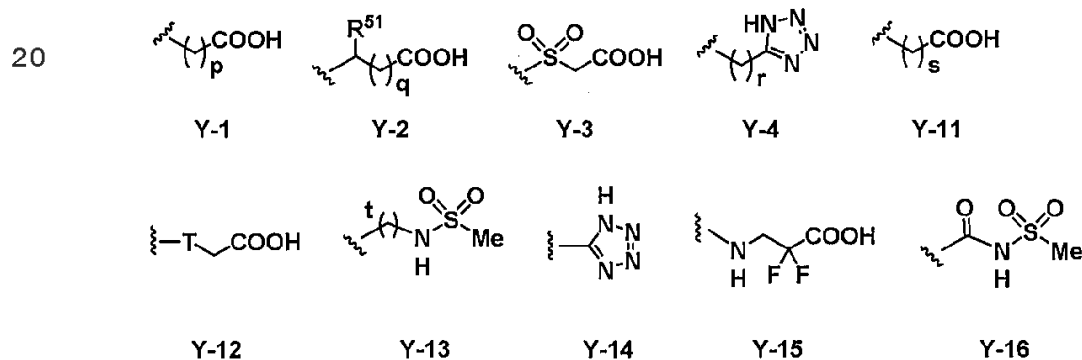


5

en donde el enlace en el lado izquierdo de cada grupo se une a W en la fórmula [1], el enlace en el lado derecho se une a Y en la fórmula [1], U^1 es un átomo de nitrógeno o CR^{41} , U^2 es un átomo de nitrógeno o CR^{42} , R^{41} y R^{42} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo, halógeno o un grupo hidroxilo, m y n son cada uno 1, 2 o 3, y R^{31} y R^{32} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo, halógeno o alcoxialquilo, o R^{31} y R^{32} se combinan con un átomo de carbono adyacente para formar un puente alquilenos, siempre que R^{31} y R^{32} se sustituyan en cualquier posición sustituible que no sea U^1 y U^2 ; y

15

Y es un átomo de hidrógeno o un grupo de cualquiera de las fórmulas Y-1 a Y-4, Y-11 a Y-16:



25

en donde R^{51} es alquilo, p es 1, 2 o 3, q es 0, 1 o 2, r es 1, 2 o 3, T es O, S, SO_2 o NR^{61} en donde R^{61} es un átomo de hidrógeno o alquilo, s es 0, 1, 2 o 3, y t es 0 o 1, con la condición de que se seleccione uno de los siguientes casos

5 (a) a (d):

(a) cuando W es un enlace,

si B es B-1 o B-2 y U^2 es un átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4,

10 si B es B-1 o B-2 y U^2 es CR^{42} en donde R^{42} es como se definió anteriormente, entonces U^1 es un átomo de nitrógeno e Y es Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16, y

si B es B-3 o B-4, entonces Y es un átomo de hidrógeno;

(b) cuando W es W-1,

15 si B es B-1, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2 es un átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4, y

si B es B-1, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2 es CR^{42} en donde R^{42} es como se definió anteriormente, entonces Y es Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16;

20 (c) cuando W es W-2,

si B es B-1 o B-2, U^1 es un átomo de nitrógeno y U^2 es un átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4,

25 si B es B-1 o B-2, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2 es CR^{42} en donde R^{42} es como se definió anteriormente, entonces Y es Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16, y

si B es B-3 o B-4, entonces Y es un átomo de hidrógeno; y

(d) cuando W es W-3,

5 si B es B-1, U¹ es CR⁴¹ en donde R⁴¹ es como se definió anteriormente, y U² es un átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4.

2. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque W es un enlace.

10 3. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque

(1) B es B-1 o B-2, U² es un átomo de nitrógeno e Y es Y-1, Y-2 o Y-3,

(2) B es B-1 o B-2, U² es CR⁴², e Y es Y-11, Y-12, o
15 Y-15, o

(3) B es B-4 e Y es un átomo de hidrógeno.

4. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque R⁴ es piridilo sustituido con trihaloalquilo y un grupo
20 seleccionado del grupo que consiste de alquilo, trihaloalquilo, alcoxi, ciano y cicloalquilo.

5. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 4, caracterizado porque A es A-4.

25 6. El agente terapéutico o agente profiláctico de

conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque el compuesto de azabencimidazol es cualquiera de los siguientes (1) a (15):

- (1) Ácido [4-(5-{5-[3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperazin-1-il]acético,
- (2) Ácido 4-fluoro-1-(5-{5-[3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,
- (3) Ácido 1-(5-{5-[6-etoxi-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,
- (4) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,
- (5) Ácido {[1-(5-{5-[2-ciclopropil-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidin-4-il]oxi}acético,
- (6) Ácido 1-(4-{5-[6-etoxi-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidin-4-il]oxi}acético,

(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}-3-fluorofenil)piperidina-4-carboxílico,

(7) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[(3-metoxi-2,2-dimetilpropil) (metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(8) Ácido 1-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(etoximetil)-ciclopentil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(9) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil) ciclopentilo]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(10) Ácido 3-[4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil) ciclohexil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperazin-1-il]propanoico,

(11) Ácido [4-(4-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}-3-fluorofenoxi)piperidin-1-il]acético,

(12) Ácido 3-[(2S)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil) ciclohexil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-

b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-2-(metoximetil)piperazin-1-il]propanoico,

(13) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(etoximetil)-ciclopentil]metil}-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico,

(14) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[2-ciclopropil-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclohexil]metil}-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico, y

(15) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil}-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico.

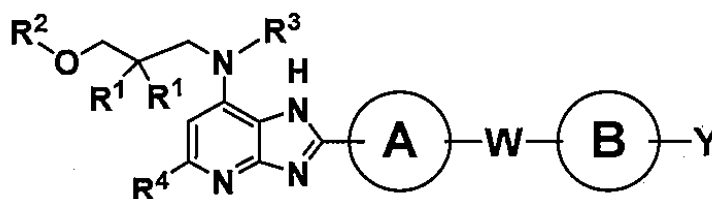
7. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque el trastorno gastrointestinal funcional es el síndrome del intestino irritable (IBS).

20 8. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque el trastorno gastrointestinal funcional es estreñimiento funcional.

25 9. Un agente terapéutico o agente profiláctico para xerostomía, que comprende un compuesto de azabencimidazol, o

una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o un solvato del mismo, como un ingrediente activo, caracterizado porque el compuesto de azabencimidazol es un compuesto de la fórmula [1]:

5



[1]

10

en donde:

R¹ es un átomo de hidrógeno o alquilo, o los dos R¹ se combinan con el átomo de carbono adyacente para formar un cicloalquilo de 3 a 7 miembros o un heterociclo no aromático que contiene oxígeno;

15

R² es un átomo de hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, alquilo sustituido con cicloalquilo o alcoxialquilo;

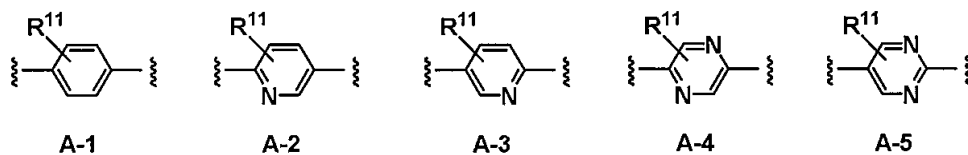
R³ es un átomo de hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo;

R⁴ es piridilo opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados del grupo que consiste de alquilo, trihaloalquilo, alcoxi, ciano y cicloalquilo, o fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados del grupo que consiste de trihaloalquilo, halógeno, alcoxi y cicloalquilo;

20

A es un grupo de la fórmula A-1, A-2, A-3, A-4 o A-5:

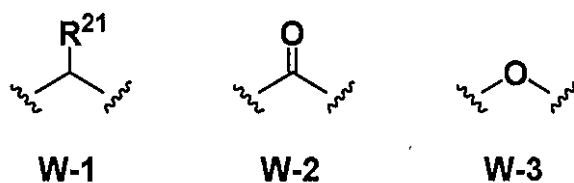
25



5

en donde el enlace en el lado izquierdo de cada grupo se une a la posición 2 del azabencimidazol en la fórmula [1], el enlace en el lado derecho se une a W en la fórmula [1], y R^{11} es un grupo seleccionado de un átomo de hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi y nitro; W es un enlace o un grupo de la fórmula W-1, W-2 o W-3:

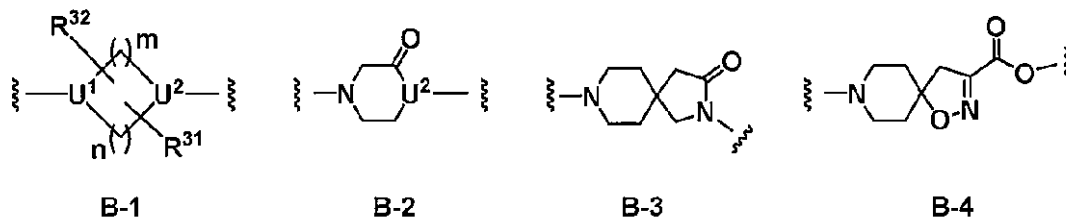
10



15

en donde R^{21} es un átomo de hidrógeno o alquilo;

B es un grupo de la fórmula B-1, B-2, B-3 o B-4:



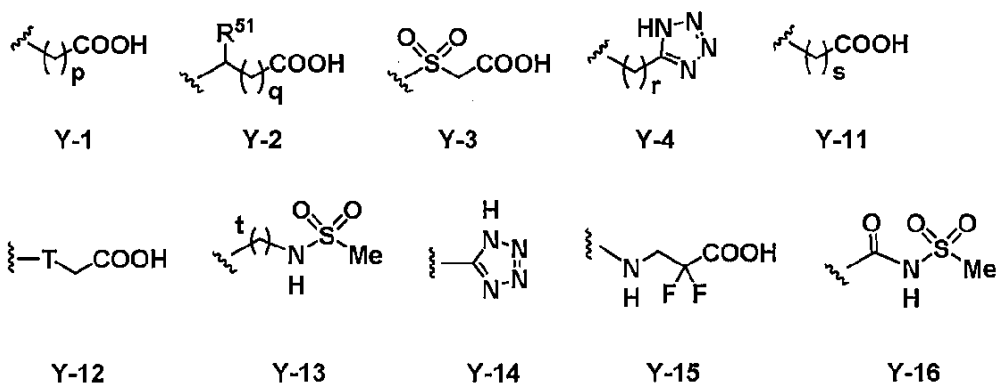
20

en donde el enlace en el lado izquierdo de cada grupo se une a W en la fórmula [1], el enlace en el lado derecho se

25

une a Y en la fórmula [1], U^1 es un átomo de nitrógeno o CR^{41} , U^2 es un átomo de nitrógeno o CR^{42} , R^{41} y R^{42} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo, halógeno o un grupo hidroxilo, m y n son cada uno 1, 2 o 3, y R^{31} y R^{32} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo, halógeno o alcoxialquilo, o R^{31} y R^{32} se combinan con un átomo de carbono adyacente para formar un puente alquileno, siempre que R^{31} y R^{32} se sustituyan en cualquier posición sustituible que no sea U^1 y U^2 ; y

Y es un átomo de hidrógeno o un grupo de cualquiera de las fórmulas Y-1 a Y-4, Y-11 a Y-16:



en donde R^{51} es alquilo, p es 1, 2 o 3, q es 0, 1 o 2, r es 1, 2 o 3, T es O, S, SO_2 o NR^{61} en donde R^{61} es un átomo de hidrógeno o alquilo, s es 0, 1, 2 o 3, y t es 0 o 1, con la condición de que se seleccione uno de los siguientes casos (a) a (d):

(a) cuando W es un enlace,

si B es B-1 o B-2 y U^2 es un átomo de nitrógeno,
entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4,

si B es B-1 o B-2 y U^2 es CR^{42} en donde R^{42} es como se
definió anteriormente, entonces U^1 es un átomo de nitrógeno e
5 Y es Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16, y

si B es B-3 o B-4, entonces Y es un átomo de
hidrógeno;

(b) cuando W es W-1,

si B es B-1, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2 es un
10 átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4, y

si B es B-1, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2 es CR^{42}
en donde R^{42} es como se definió anteriormente, entonces Y es
Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16;

(c) cuando W es W-2,

15 si B es B-1 o B-2, U^1 es un átomo de nitrógeno y U^2 es
un átomo de nitrógeno, entonces Y es Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4,

si B es B-1 o B-2, U^1 es un átomo de nitrógeno, y U^2
es CR^{42} en donde R^{42} es como se definió anteriormente,
entonces Y es Y-11, Y-12, Y-13, Y-14, Y-15 o Y-16, y

20 si B es B-3 o B-4, entonces Y es un átomo de
hidrógeno; y

(d) cuando W es W-3,

si B es B-1, U^1 es CR^{41} en donde R^{41} es como se definió
anteriormente, y U^2 es un átomo de nitrógeno, entonces Y es
25 Y-1, Y-2, Y-3 o Y-4.

10. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque W es un enlace.

5 11. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 9 o 10, caracterizado porque

(1) B es B-1 o B-2, U^2 es un átomo de nitrógeno e Y es Y-1, Y-2 o Y-3,

10 (2) B es B-1 o B-2, U^2 es CR^{42} , e Y es Y-11, Y-12, o Y-15, o

(3) B es B-4 e Y es un átomo de hidrógeno.

12. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque R^4 es piridilo sustituido con trihaloalquilo y un grupo
15 seleccionado del grupo que consiste de alquilo, trihaloalquilo, alcoxi, ciano y cicloalquilo.

13. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque A es A-4.

20 14. El agente terapéutico o agente profiláctico de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 9 a 13, caracterizado porque el compuesto de azabencimidazol es cualquiera de los siguientes (1) a (15):

(1) Ácido [4-(5-{5-[3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]-

25

(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperazin-1-il]acético,

(2) Ácido 4-fluoro-1-(5-{5-[3-fluoro-5-(trifluorometil) fenil]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(3) Ácido 1-(5-{5-[6-etoxi-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(4) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclobutil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-carboxílico,

(5) Ácido {[1-(5-{5-[2-ciclopropil-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidin-4-il]oxi}acético,

(6) Ácido 1-(4-{5-[6-etoxi-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil]}-(metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}-3-fluorofenil)piperidina-4-carboxílico,

(7) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[(3-metoxi-2,2-dimetilpropil) (metil) amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperidina-4-

carboxílico,

(8) Ácido 1-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-
piridin-3-il]-7-[[1-(etoximetil)-ciclopentil]metil]-
(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-
5 il)piperidina-4-carboxílico,

(9) Ácido 1-(5-{5-[2-etoxi-6-(trifluorometil)-
piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil) ciclopentilo]metil]-
(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-
il)piperidina-4-carboxílico,

10 (10) Ácido 3-[4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-
(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-
(metoximetil)ciclohexil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-
b]piridin-2-il}pirazin-2-il)piperazin-1-il]propanoico,

(11) Ácido [4-(4-{5-[6-ciclopropil-5-
15 (trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-
ciclopentil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-
il} -3-fluorofenoxi)piperidin-1-il]acético,

(12) Ácido 3-[(2S)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-
(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-
20 (metoximetil)ciclohexil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-
b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-2-(metoximetil)piperazin-1-
il]propanoico,

(13) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-
(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(etoximetil)-
25 ciclopentil]metil]-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-

il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico,

(14) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[2-ciclopropil-6-(trifluorometil)-piridin-4-il]-7-[[1-(metoximetil)ciclohexil]metil}-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico, y

(15) Ácido 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-ciclopropil-5-(trifluorometil)-piridin-3-il]-7-[[1-(metoximetil)-ciclopentil]metil}-(metil)amino]-1H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il}pirazin-2-il)-3-metilpiperazin-1-il]propanoico.

15

20

25