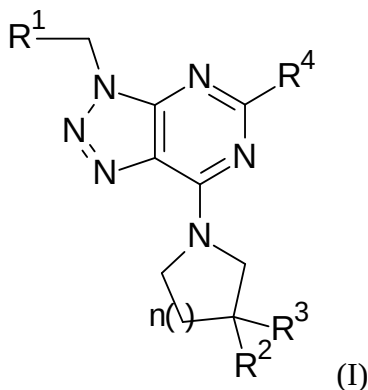


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



en donde:

R¹ es un anillo seleccionado de entre fenilo y [1,2,5]oxadiazolilo, en donde dicho anillo se sustituye con un sustituyente seleccionado de entre halosulfonilo, halosulfonilalquilo, isotiocianatoalquilo, isotiocianato, aminoalquildisulfanilalquilo, hidroxialquildisulfanilalquilo, hidroxialquildisulfanilo, aminoalquildisulfanilo, halógeno, alquilo, piridinildisulfanilalquilo, benzotriazolilsulfonilalquilo, dihidroxialquildisulfanilalquilo y piridinildisulfanilo y opcionalmente sustituido adicionalmente con ciano,

R² y R³ se seleccionan independientemente de entre hidrógeno, hidroxilo, halógeno, tihidroxilo, tihidroxiazetidino, azido, isotiocianato y alquildisulfanilo, con la condición de que por lo menos uno de entre R¹, R² y R³ sea un grupo que comprende sulfonilo, isotiocianato, disulfanilo, tihidroxilo o azido,

R⁴ es alquilo o fenilhaloalquilo, y

n es 0 o 1,

o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde R¹ es un anillo seleccionado de entre fenilo y [1,2,5]oxadiazolilo, en el que dicho anillo se sustituye con un

sustituyente seleccionado de entre halosulfonilo, halosulfonilalquilo, isotiocianatoalquilo, isotiocianato, halógeno, alquilo, hidroxialquildisulfanilalquilo, piridinildisulfanilalquilo, dihidroxialquildisulfanilalquilo y opcionalmente se sustituyen adicionalmente con ciano.

5

3. Un compuesto según la reivindicación 1 o 2, en donde R^1 es un anillo seleccionado de entre fenilo y [1,2,5]oxadiazolilo, en el que dicho anillo se sustituye con un sustituyente seleccionado de entre fluorosulfonilo, fluorosulfonilmetilo, isotiocianatometilo, isotiocianato, cloro, metilo, hidroxietildisulfaniletilo, fluorosulfoniletilo, piridinildisulfaniletilo, dihidroxietildisulfaniletilo y opcionalmente se sustituye adicionalmente con ciano.

10

4. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^1 es fluorosulfonilfenilo, fluorosulfonilmetilfenilo, isotiocianatometilfenilo, isotiocianatofenilo, clorofenilo, metil[1,2,5]oxadiazolilo, hidroxietildisulfaniletilfenilo, fluorosulfoniletilfenilo, piridinildisulfaniletilfenilo, dihidroxietildisulfaniletilfenilo o (fluorosulfonil)(ciano)fenilo.

15

5. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde R^2 es hidrógeno y R^3 es hidroxilo, tihidroxilo, azido, isotiocianato o metildisulfanilo, o R^2 y R^3 son ambos flúor simultáneamente.

20

6. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde R^4 es terc-butilo o fenildifluorometilo.

25

7. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde n es 1.

8. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, seleccionado de entre fluoruro de 2-({5-terc-butil-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)benceno-1-sulfonilo,

30

fluoruro de (2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)metanosulfonilo,

fluoruro de [2-({5-terc-butil-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)fenil]metanosulfonilo,

5 5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

(3S)-1-(5-terc-butil-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il)pirrolidín-3-ol,

10 5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[(2-isotiocianatofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

fluoruro de 2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}benceno-1-sulfonilo,

15 2-{[(2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)metil]disulfanil}etan-1-amina,

20 2-{[(2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)metil]disulfanil}etan-1-ol;

2-[(2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)disulfanil]etan-1-ol;

25 2-[(2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)disulfanil]etan-1-amina,

2-{[2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)fenil]disulfanil}etan-1-amina,

30 2-({[2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)fenil]metil}disulfanil)etan-1-amina,

fluoruro de 2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)benceno-1-sulfonilo,

5 fluoruro de 2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)benceno-1-sulfonilo,

fluoruro de [2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)fenil]metanosulfonilo,

10 fluoruro de [2-({5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)fenil]metanosulfonilo,

(3S)-1-(5-[difluoro(fenil)metil]-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il)pirrolidín-3-ol,

15

5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[(2-isotiocianatofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

20

1-{5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

25 1-{5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}azetidín-3-tiol,

(3S)-1-{5-terc-butil-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

30

(3R)-1-{5-terc-butil-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

(3S)-1-{5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

5 (3R)-1-{5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

7-(3-azidopirrolidín-1-il)-5-terc-butil-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

10 5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(3-isotiocianatopirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

5-terc-butil-7-(3-isotiocianatopirrolidín-1-il)-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

15 7-(3-azidopirrolidín-1-il)-5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

20 5-[difluoro(fenil)metil]-7-[3-(metildisulfanil)pirrolidín-1-il]-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

3-[(2-clorofenil)metil]-5-[difluoro(fenil)metil]-7-[3-(metildisulfanil)pirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

25 7-(3-azidopirrolidín-1-il)-5-[difluoro(fenil)metil]-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

7-(3-azidopirrolidín-1-il)-3-[(2-clorofenil)metil]-5-[difluoro(fenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

30 3-[(2-clorofenil)metil]-5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3-isotiocianatopirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3-isotiocianatopirrolidín-1-il)-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

5 fluoruro de 2-[[5-[difluoro(fenil)metil]-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]bencenosulfonilo,

2-[[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]metildisulfanil]etanol;

10 fluoruro de 2-[[5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]bencenosulfonilo,

15 5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[[2-[2-(piridín-2-ildisulfanil)etil]fenil]metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,

2-[2-[2-[[5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]etanol,

20 2-[2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]etanol,

3-[[2-[2-(benzotriazol-1-ilsulfonil)etil]fenil]metil]-5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,

25 fluoruro de 2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etanosulfonilo,

5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[[2-[2-(piridín-2-ildisulfanil)etil]fenil]metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,

30 2-[2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]etanamina,

2-[2-[2-[[5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]etanamina,

3-[2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]propane-1,2-diol,

2-[[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]disulfanil]etanol,

5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[[2-(piridín-2-ildisulfanil)fenil]metil]triazolo[4,5-d]pirimidina y

fluoruro de 2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-3-etinilbencenosulfonilo.

9. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, seleccionado de entre:
fluoruro de 2-({5-terc-butil-7-[(3S)-3-hidroxipirrolidín-1-il]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il}metil)benceno-1-sulfonilo,

fluoruro de (2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}fenil)metanosulfonilo,

5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

(3S)-1-(5-terc-butil-3-{[2-(isotiocianatometil)fenil]metil}-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il)pirrolidín-3-ol,

5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[(2-isotiocianatofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

fluoruro de 2-{[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil}benceno-1-sulfonilo,

1-{5-terc-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

5 (3S)-1-{5-terc-butil-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il}pirrolidín-3-tiol,

7-(3-azidopirrolidín-1-il)-5-terc-butil-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

10 5-terc-butil-7-(3-isotiocianatopirrolidín-1-il)-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

15 5-[difluoro(fenil)metil]-7-[3-(metildisulfanil)pirrolidín-1-il]-3-[(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

7-(3-azidopirrolidín-1-il)-3-[(2-clorofenil)metil]-5-[difluoro(fenil)metil]-3H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pirimidina,

20 fluoruro de 2-[[5-[difluoro(fenil)metil]-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]bencenosulfonilo,

2-[2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]etanol,

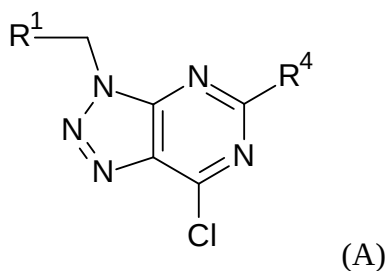
25 fluoruro de 2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etanosulfonilo,

5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)-3-[[2-[2-(piridín-2-ildisulfanil)etil]fenil]metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,

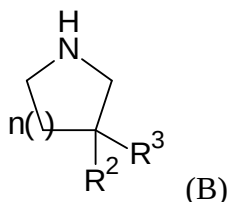
30 3-[2-[2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]fenil]etildisulfanil]propane-1,2-diol y

fluoruro de 2-[[5-terc-butil-7-(3,3-difluoropirrolidín-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-3-etinilbencenosulfonilo.

10. Un procedimiento para la preparación de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, que comprende la reacción de un compuesto de fórmula (A):



en presencia de un compuesto de fórmula (B):



y una base, en la que R¹ a R⁴ y n son tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7.

11. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, preparado siguiendo un procedimiento según la reivindicación 10.

12. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, para uso como sustancia terapéuticamente activa.

13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 y un portador terapéuticamente inerte.

14. El uso de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para la preparación de medicamentos destinados al tratamiento o profilaxis del dolor, dolor neuropático, aterosclerosis, degeneración macular relacionada con la edad, retinopatía diabética, glaucoma, diabetes mellitus, inflamación, enfermedad intestinal inflamatoria, isquemia-daño por reperusión, insuficiencia hepática aguda, fibrosis hepática, fibrosis pulmonar, fibrosis renal, fibrosis sistémica, rechazo agudo del

aloinjerto, nefropatía crónica del aloinjerto, nefropatía diabética, glomerulonefropatía, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca, isquemia/infarto miocárdica, esclerosis sistémica, daño térmico, quemadura, cicatrices hipertróficas, queloides, pirexia de gingivitis, cirrosis o tumores hepáticos, regulación de la masa ósea, neurodegeneración, ictus, ataque isquémico transitorio, uveitis, asma, osteoporosis, enfermedades psiquiátricas, psicosis, oncología, encefalitis, malaria, alergia, trastornos inmunológicos, artritis, trastornos gastrointestinales, artritis reumatoide o alergia.

- 5
- 10 15. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para uso en el tratamiento o la profilaxis del dolor, dolor neuropático, aterosclerosis, degeneración macular relacionada con la edad, retinopatía diabética, glaucoma, diabetes mellitus, inflamación, enfermedad intestinal inflamatoria, isquemia-daño por reperfusión, insuficiencia hepática aguda, fibrosis hepática, fibrosis pulmonar, fibrosis renal, fibrosis sistémica, rechazo agudo del aloinjerto, nefropatía crónica del aloinjerto, nefropatía diabética, glomerulonefropatía, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca, isquemia/infarto miocárdica, esclerosis sistémica, daño térmico, quemadura, cicatrices hipertróficas, queloides, pirexia de gingivitis, cirrosis o tumores hepáticos, regulación de la masa ósea, neurodegeneración, ictus, ataque isquémico transitorio, uveitis, asma, osteoporosis, enfermedades psiquiátricas, psicosis, oncología, encefalitis, malaria, alergia, trastornos inmunológicos, artritis, trastornos gastrointestinales, artritis reumatoide o alergia.
- 20
- 25 16. Un método para el tratamiento o la profilaxis del dolor, dolor neuropático, aterosclerosis, degeneración macular relacionada con la edad, retinopatía diabética, glaucoma, diabetes mellitus, inflamación, enfermedad intestinal inflamatoria, isquemia-daño por reperfusión, insuficiencia hepática aguda, fibrosis hepática, fibrosis pulmonar, fibrosis renal, fibrosis sistémica, rechazo agudo del aloinjerto, nefropatía crónica del aloinjerto, nefropatía diabética, glomerulonefropatía, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca, isquemia/infarto miocárdica, esclerosis sistémica, daño térmico, quemadura, cicatrices hipertróficas, queloides, pirexia de gingivitis, cirrosis o tumores hepáticos, regulación de la masa ósea, neurodegeneración, ictus, ataque isquémico transitorio, uveitis, asma, osteoporosis, enfermedades psiquiátricas, psicosis, oncología, encefalitis, malaria, alergia, trastornos inmunológicos, artritis,
- 30

trastornos gastrointestinales, artritis reumatoide o alergia, comprendiendo el método la administración de una cantidad eficaz de un compuesto según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en un paciente que lo necesita.

- 5 17. El uso de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 para la detección o la obtención de imágenes del receptor de CB2.
18. Invención según se ha descrito anteriormente en la presente memoria.