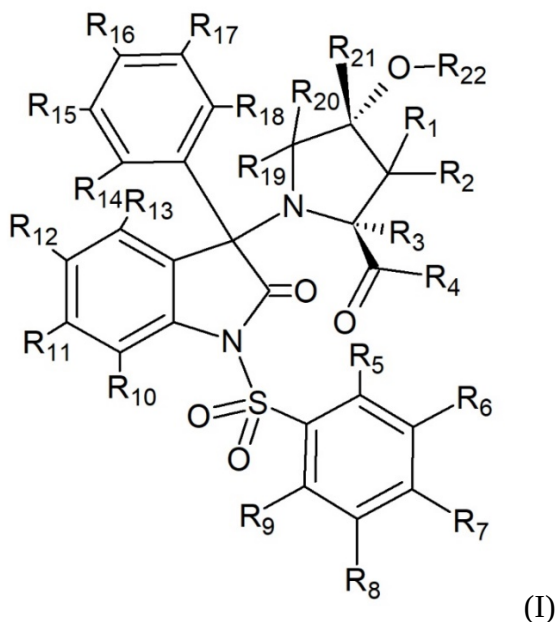


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I):



o una sal farmacéuticamente aceptable o un profármaco del mismo, en donde:

R₁, R₂, R₃, R₁₉, R₂₀ y R₂₁ se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁₋₄ y alcoxi C₁₋₄,

R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇ y R₁₈ se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁₋₄, halogenalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ y halogenalconxi C₁₋₄,

R₄ se selecciona del grupo que consiste en alquil C₁₋₄-amino, halogenalquil C₁₋₄-amino, di-alquil C₁₋₄-amino, di-halogenalquil C₁₋₄-amino y azetidin-1-ilo,

R₂₂ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁₋₄, halogenalquilo C₁₋₄, -(CH₂)_n-CO-R₃₈, y -CO-(CH₂)_n-NR₃₉R₄₀,

R₃₈ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxí y alquilo C₁₋₄,

R₃₉ y R₄₀ se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁₋₄ y halogenalquilo C₁₋₄, o R₃₉ y R₄₀, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, constituyen un grupo heterocíclico seleccionado del grupo que consiste en: azetidin-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, piperid-1-ilo, piperazin-1-ilo, morfolin-4-ilo y tiomorfolin-4-ilo; y el número entero n es 1 o 2,

en donde

a) al menos un hidrógeno de R₄, que se selecciona de entre alquil C₁₋₄-amino o dialquil C₁₋₄-amino, está enriquecido en deuterio, y/o

b) al menos un hidrógeno de R₅, R₇ o R₁₄, que se seleccionan individualmente entre alquilo C₁₋₄ o alcoxi C₁₋₄, está enriquecido en deuterio, y

c) opcionalmente, al menos un hidrógeno de R₁, R₂, R₃, R₆, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₃, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ o R₂₁ está enriquecido en deuterio.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

a) al menos un hidrógeno de R₁, R₂, R₃, R₆, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₃, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ o R₂₁ está enriquecido en deuterio,

b) al menos un hidrógeno de R₄, que es dimetilamino, está enriquecido en deuterio, y/o

c) al menos un hidrógeno de R₅, R₇ o R₁₄, que son metoxi, está enriquecido en deuterio.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

d) R₅, R₇ y R₁₄ son un grupo metoxi,

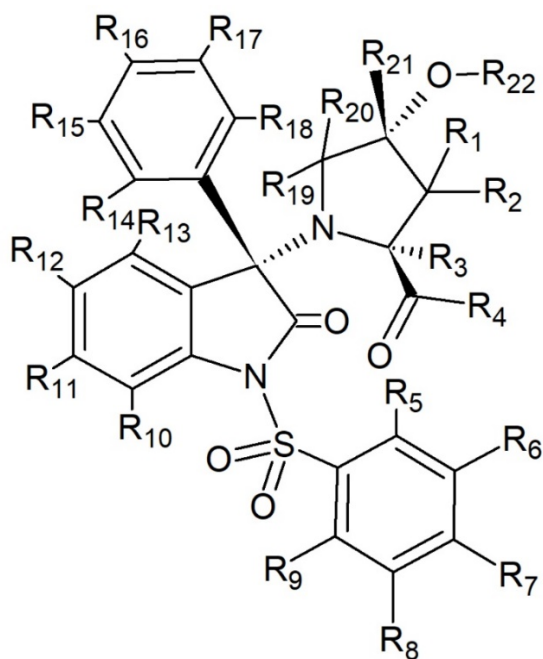
e) R₁₂ es un metilo, trifluorometilo o átomo de halógeno, preferentemente un átomo de cloro,

f) R₂₂ es hidrógeno, y/o

g) R₁, R₂, R₃, R₆, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₃, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ y R₂₁ son hidrógeno.

4. El compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde los seis átomos de hidrógeno de R₄, que es dimetilamino, y/o los tres átomos de hidrógeno de R₅, R₇ o R₁₄, que son un grupo metoxi, están enriquecidos en deuterio.

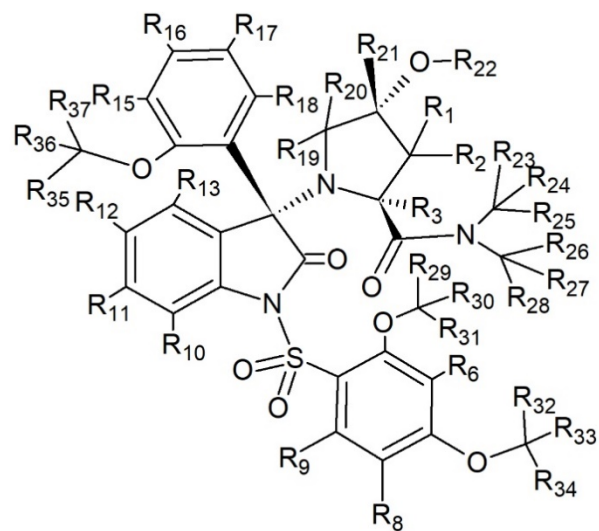
5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que es un compuesto de la fórmula (II):



(II),

en donde R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀, R₂₁, y R₂₂ son tal como se definen en la reivindicación 1.

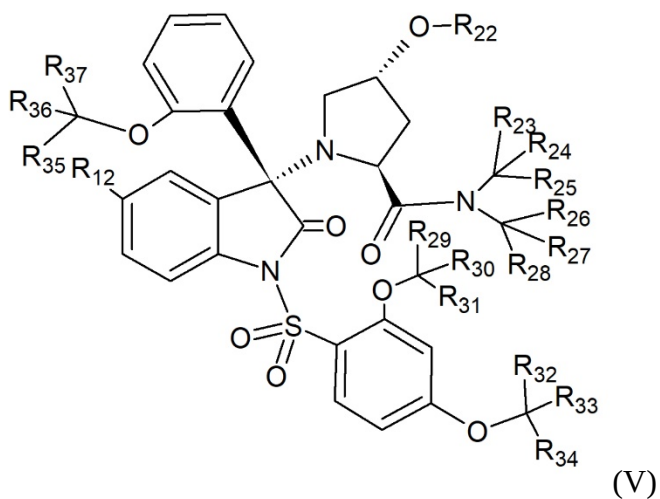
6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que es un compuesto de la fórmula (III) o (IV):



(IV)

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈, R₂₉, R₃₀, R₃₁, R₃₂, R₃₃, R₃₄, R₃₅, R₃₆ y R₃₇ son hidrógeno.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es un compuesto de la fórmula (V):



en donde

R_{22} es tal como se define en la reivindicación 6, preferentemente hidrógeno, y

R_{12} es tal como se define en la reivindicación 6, preferentemente cloro.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, en donde

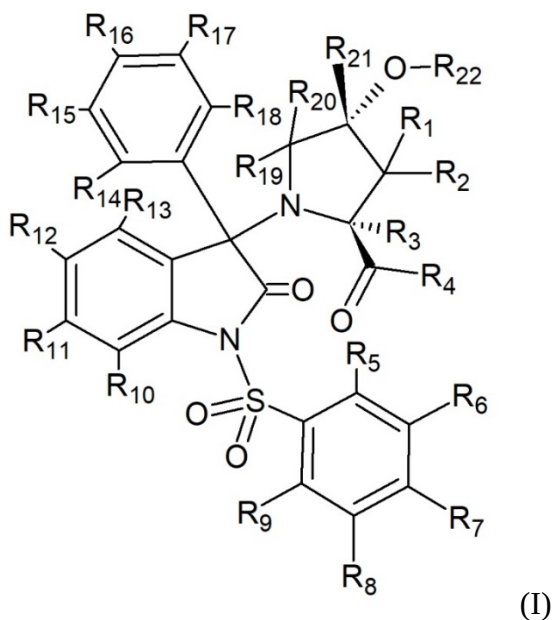
a) R_{23} , R_{24} , R_{25} , R_{26} , R_{27} y R_{28} están enriquecidos en deuterio,

b) R_{29} , R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} y R_{34} están enriquecidos en deuterio, y/o

c) R_{35} , R_{36} y R_{37} están enriquecidos en deuterio.

9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el enriquecimiento en deuterio es al menos del 10 %, al menos del 30 %, al menos del 50 %, al menos del 70 %, al menos del 97 %, al menos del 98 % o al menos del 99 %.

10. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I):



o una sal farmacéuticamente aceptable o un profármaco del mismo, en donde:

R_1 , R_2 , R_3 , R_{19} , R_{20} y R_{21} se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_{1-4} y alcoxi C_{1-4} ,

R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} , R_{14} , R_{15} , R_{16} , R_{17} y R_{18} se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_{1-4} , halogenalquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} y halogenalcoxi C_{1-4} ,

R_4 se selecciona del grupo que consiste en alquil C_{1-4} -amino, halogenalquil C_{1-4} -amino, di-alquil C_{1-4} -amino, di-halogenalquil C_{1-4} -amino y azetidin-1-ilo,

R_{22} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_{1-4} , halogenalquilo C_{1-4} , $-(CH_2)_n-CO-R_{38}$, y $-CO-(CH_2)_n-NR_{39}R_{40}$,

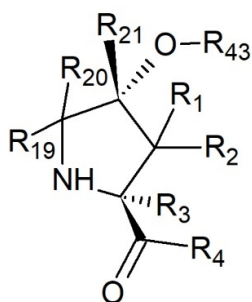
R_{38} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo y alquilo C_{1-4} ,

R_{39} y R_{40} se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_{1-4} y halogenalquilo C_{1-4} , o R_{39} y R_{40} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, constituyen un grupo heterocíclico seleccionado del grupo que consiste en: azetidin-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, piperazin-1-ilo, morfolin-4-ilo y tiomorfolin-4-ilo; y el número entero n es 1 o 2, en donde

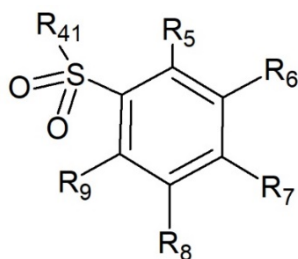
a) al menos un hidrógeno de R_4 , que se selecciona de entre alquil C_{1-4} -amino o dialquil C_{1-4} -amino, está enriquecido en deuterio, y/o

b) al menos un hidrógeno de R_5 , R_7 o R_{14} , que se seleccionan individualmente entre alquilo C_{1-4} o alcoxi C_{1-4} , está enriquecido en deuterio, y

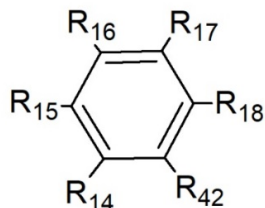
c) opcionalmente, al menos un hidrógeno de R_1 , R_2 , R_3 , R_6 , R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , R_{13} , R_{15} , R_{16} , R_{17} , R_{18} , R_{19} , R_{20} o R_{21} está enriquecido en deuterio, el proceso comprende una etapa de reacción de al menos uno de los siguientes compuestos de las fórmulas (VI), (VII), (VIII) o (IX)



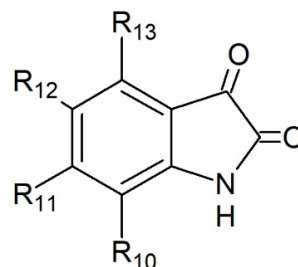
(VI)



(VII)



(VIII)



(IX)

en donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} , R_{14} , R_{15} , R_{16} , R_{17} , R_{18} , R_{19} , R_{20} y R_{21} son tal como se definen para la fórmula (I),

R_{41} es un halógeno o un residuo de éster activador,

R_{42} es un halógeno, y

R_{43} es R_{22} o un grupo protector de hidroxilo.

11. El proceso de acuerdo con la reivindicación 10, en donde

a) en el compuesto de la fórmula (VI), al menos un hidrógeno de R_4 , que se selecciona de entre alquil C_{1-4} -amino o dialquil C_{1-4} -amino, preferentemente dimetilamino, está enriquecido en deuterio, y preferentemente R_1 , R_2 , R_3 , R_{19} , R_{20} y R_{21} son hidrógeno y R_{43} es hidrógeno o un grupo protector de hidroxilo,

b) en el compuesto de la fórmula (VII), al menos un hidrógeno de R_5 o R_7 , que se seleccionan individualmente entre alquilo C_{1-4} o alcoxi C_{1-4} , preferentemente metoxi, está enriquecido en deuterio, y preferentemente R_6 , R_8 y R_9 son hidrógeno, y/o

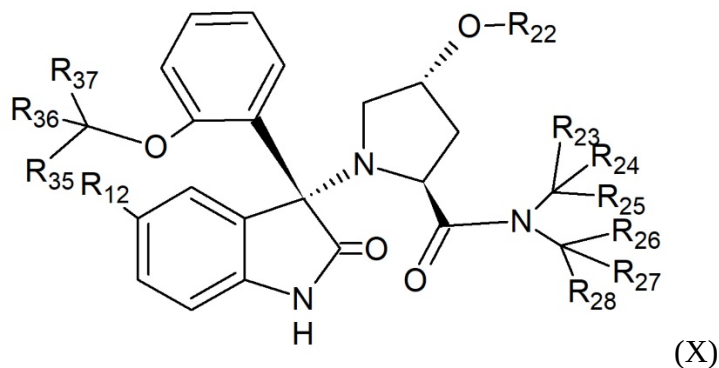
c) en el compuesto de la fórmula (VIII) al menos uno, preferentemente al menos dos o al menos tres, hidrógenos de R_{14} , que se selecciona de entre alquilo C_{1-4} o alcoxi C_{1-4} , preferentemente metoxi, están enriquecidos en deuterio, y preferentemente R_{15} , R_{16} , R_{17} y R_{18} son hidrógeno.

12. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 y un portador farmacéutico aceptable.

13. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o la composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 12 para su uso como medicamento.

14. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o la composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 12 para su uso en el tratamiento o la profilaxis de trastornos del sistema nervioso central, en particular de ansiedad o depresión.

15. Un compuesto según la fórmula (X):



en donde

R₁₂ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁₋₄, halogenalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ y halogenalcoksi C₁₋₄, preferentemente metilo, trifluorometilo o halógeno, más preferentemente cloro,

R₂₂ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁₋₄, halogenalquilo C₁₋₄, –(CH₂)_n–CO–R₃₈, y –CO–(CH₂)_n–NR₃₉R₄₀, R₃₈ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo y alquilo C₁₋₄, R₃₉ y R₄₀ se seleccionan individualmente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁₋₄ y halogenalquilo C₁₋₄, o R₃₉ y R₄₀, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, constituyen un grupo heterocíclico seleccionado del grupo que consiste en: azetidin-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, piperid-1-ilo, piperazin-1-ilo, morfolin-4-ilo y tiomorfolin-4-ilo; y el número entero n es 1 o 2; o R₂₂ es un grupo protector de hidroxilo, y

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈, R₃₅, R₃₆ y R₃₇ son hidrógeno, siempre que al menos uno, preferentemente al menos dos o al menos tres, de R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈, R₃₅, R₃₆ y R₃₇ estén enriquecidos en deuterio.