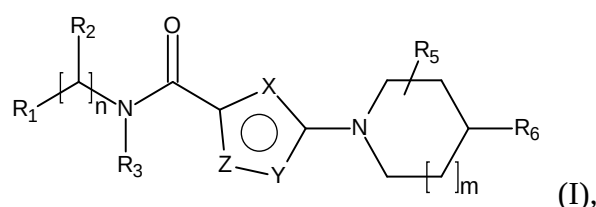


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto de Fórmula general (I)



en donde

X representa S, N u O;

Y representa N, S u O;

en donde, cuando X es igual a S, entonces Y es igual a N;

en donde, cuando X es igual a O, entonces Y es igual a N;

Z representa CR₄, O, o NR₄;

en donde, cuando X es igual a N y Y es igual a N, entonces Z es igual a O;

en donde, cuando X es igual a S, entonces Z es igual a CR₄ o NR₄;

R₁ representa piridinilo, pirazolilo, tiazolilo, tienilo o fenilo;

en donde el piridinilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes independientes entre sí, seleccionados del grupo de alquilo (C₁-C₂), flúor, cloro, trifluorometilo y trifluorometoxi;

en donde el pirazolilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes independientes entre sí, seleccionados del grupo de alquilo (C₁-C₂), flúor, cloro y trifluorometilo;

en donde el tiazolilo puede estar sustituido por cloro;

en donde el tienilo puede estar sustituido por flúor;

en donde el fenilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes independientes entre sí, seleccionados del grupo de alquilo (C₁-C₂), cicloalquilo (C₃-C₄), metoxi, ciano, hidroxilo, flúor, cloro y trifluorometilo;

R₂ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₂);

o

junto al átomo de carbono al que está unido R₂, forma un anillo ciclopropilo;

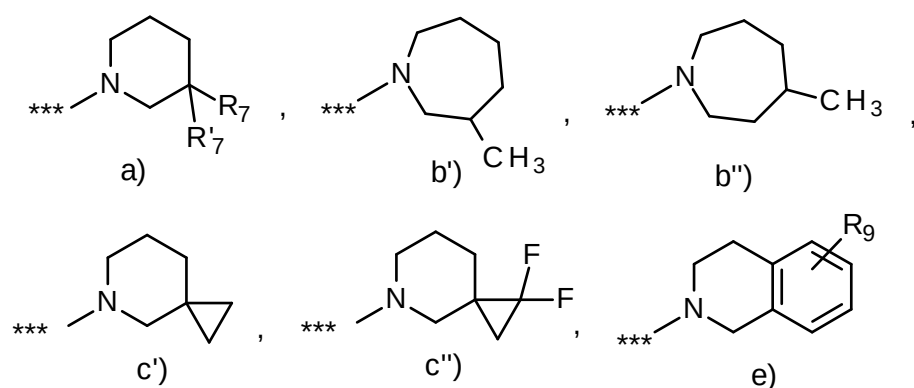
R₃ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₂);

R₄ en CR₄ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₄), fenilo, F, Cl, Br o I;

en donde alquilo el (C₁-C₄) puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I y el fenilo puede estar sustituido por F, Cl, Br y I;

R₅ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₂) o flúor;

R₆ representa un grupo de Fórmula a), b'), b''), c'), c'') o e),



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

en donde R₇ representa hidrógeno o metilo;

en donde, si R'₇ representa metilo, entonces R₇ representa metilo;

en donde, si R'₇ representa hidrógeno, entonces R₇ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₄), alcoxi (C₁-C₄), cicloalcoxi (C₃-C₄) o fenilo;

en donde el alquilo (C₁-C₄) puede estar sustituido por cicloalquilo (C₃-C₄), alcoxi (C₁-C₄) o cicloalcoxi (C₃-C₄) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;

en donde alcoxi (C₁-C₄) puede estar sustituido por cicloalquilo (C₃-C₄) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;

en donde cicloalquilo (C₃-C₄) puede estar sustituido por monofluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo y puede estar sustituido hasta dos veces por F, Cl, Br y I;

en donde alcoxi (C₁-C₄) puede estar sustituido por cicloalquilo (C₃-C₄) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;

en donde cicloalquilo (C₃-C₄) puede estar sustituido una vez o dos veces por F, Cl, Br y I;

en donde cicloalcoxi (C₃-C₄) puede estar sustituido hasta dos veces por F, Cl, Br y I,

en donde R₈ representa hidrógeno o flúor;

en donde R₉ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), F, Cl, Br o I ;

en donde alquilo (C₁-C₄) puede estar sustituido por alcoxi (C₁-C₄),

n representa 0 o 1;

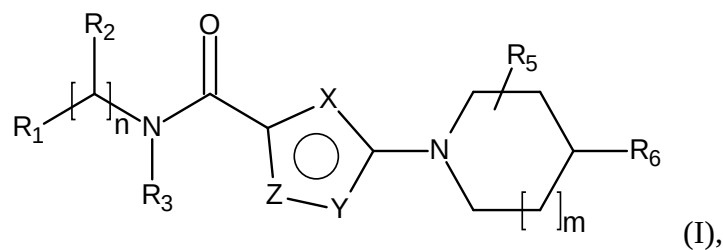
m representa 0, 1 o 2;

p representa 0, 1 o 2; y

q representa 0, 1 o 2;

y sales del mismo.

2. Un compuesto de Fórmula general (I)



en donde

X representa S, N u O;

Y representa N, S u O;

en donde, cuando X es igual a S, entonces Y es igual a N;

en donde, cuando X es igual a O, entonces Y es igual a N;

Z representa CR₄, O o NR₄;

en donde, cuando X es igual a N y Y es igual a N, entonces Z es igual a O;

en donde, cuando X es igual a S, entonces Z es igual a CR₄ o NR₄;

R₁ representa piridinilo, 2-etilpiridinilo, 4,6-dimetilpiridinilo, 3,5-difluoropiridinilo, 3-fluoropiridinilo, 4-trifluorometilpiridinilo, 6-trifluorometilpiridinilo, 5-cloro-3-fluoropiridinilo, 3-cloro-5-fluoropiridinilo, 3-metilpiridinilo, 4-metilpiridinilo, 6-metilpiridinilo, 3-cloropiridinilo, 5-cloropiridinilo, 6-trifluorometoxipiridinilo, fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 2,5-difluorofenilo, 5-cloro-2-hidroxifenilo, 5-fluoro-2-metoxifenilo, 5-cloro-2-fluorofenilo, 2-cloro-5-fluorofenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 3-ciano-4-fluorofenilo, 2-ciclopropilfenilo, 4-cloro-1-metil-1H-pirazolilo, 5-cloro-1,3-tiazolilo o 5-fluoro-2-tienilo;

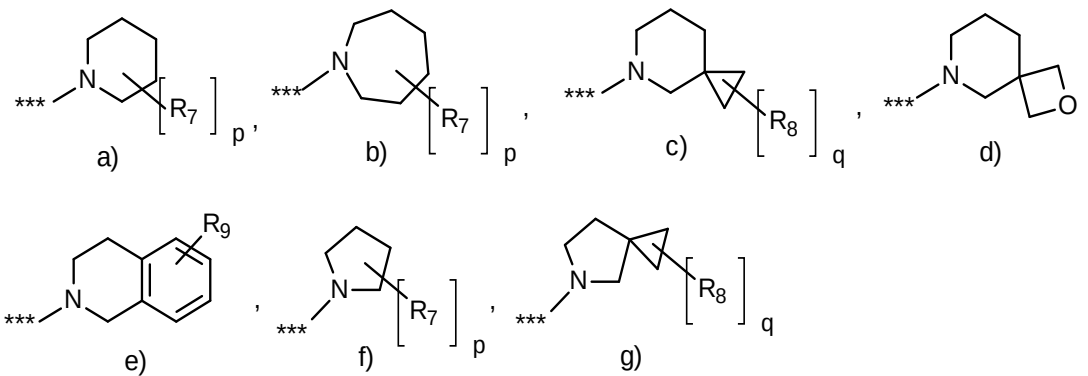
R₂ representa hidrógeno o metilo;

R₃ representa hidrógeno o metilo;

R₄ representa hidrógeno, metilo o trifluorometilo;

R₅ representa hidrógeno o flúor;

R₆ representa un grupo de Fórmula a), b), c), d), e), f) o g)



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

en donde R₇ representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo, 2-fluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilmetilo, metoxi, etoxi, metoximetilo,

monofluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxi, 3,3-difluorociclobutilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopropilmetoximetilo, ciclobutiloximetilo, 3-fluorobutiloximetilo, 3,3-difluorociclobutilmetoximetilo, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoximetilo, 2,2-difluorociclopropilmetoxi, ciclobutiloxi, 3,3-difluorociclobutiloxi, fluorometilciclopropilmetoxi, difluorometilciclopropilmetoxi, trifluorometilciclopropilmetoxi o flúor;

en donde R_8 representa hidrógeno o flúor;

en donde R_9 representa hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), o halógeno;

en donde el alquilo (C_1-C_4) puede estar sustituido por alcoxi (C_1-C_4);

n representa 0 o 1;

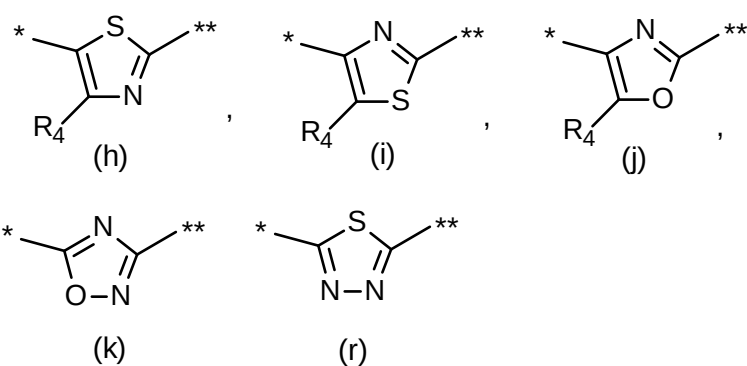
m representa 0, 1 o 2;

p representa 0, 1 o 2; y

q representa 0, 1 o 2;

y sales del mismo.

3. El compuesto de Fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde X, Y y Z se seleccionan de modo tal que el anillo aromático de 5 miembros tenga la Fórmula estructural (h), (i), (j), (k) o (r)



en donde * caracteriza la unión con el grupo carbonilo y ** caracteriza la unión con el átomo de N del anillo piperidina adyacente; y

R_1 representa piridinilo, 2-etilpiridinilo, 4,6-dimetilpiridinilo, 3,5-difluoropiridinilo, 3-fluoropiridinilo, 4-trifluorometilpiridinilo, 6-trifluorometilpiridinilo, 5-cloro-3-fluoropiridinilo, 3-cloro-5-fluoropiridinilo, 3-metilpiridinilo, 4-metilpiridinilo, 6-metilpiridinilo, 3-cloropiridinilo, 5-cloropiridinilo, 6-trifluorometoxipiridinilo, fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 2,5-difluorofenilo, 5-cloro-2-hidroxifenilo, 5-fluoro-2-metoxifenilo, 5-cloro-2-fluorofenilo, 2-cloro-5-fluorofenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 3-ciano-4-fluorofenilo, 2-ciclopropilfenilo, 4-cloro-1-metil-1H-pirazolilo, 5-cloro-1,3-tiazolilo o 5-fluoro-2-tienilo;

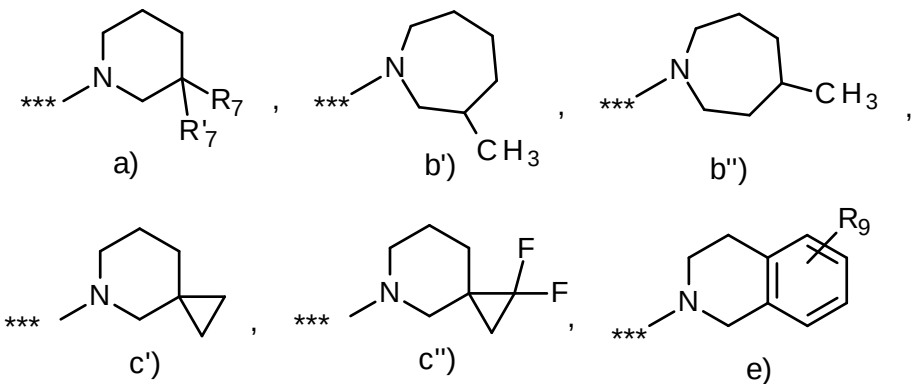
R_2 representa hidrógeno o metilo;

R_3 representa hidrógeno o metilo;

R₄ representa hidrógeno, metilo o trifluorometilo;

R₅ representa hidrógeno o flúor;

R₆ representa un grupo de Fórmula a), b'), b''), c'), c'') o e)



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

en donde R₇ o R'₇ representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo, 2-fluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilmetilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, monofluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxi, 3,3-difluorociclobutilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopropilmetoximetilo, ciclobutiloximetilo, 3-fluorobutiloximetilo, 3,3-difluorociclobutilmetoximetilo, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoximetilo, 2,2-difluorociclopropilmetoxi, ciclobutiloxi, 3,3-difluorociclobutiloxi, fluorometilciclopropilmetoxi, difluorometilciclopropilmetoxi, trifluorometilciclopropilmetoxi o flúor;

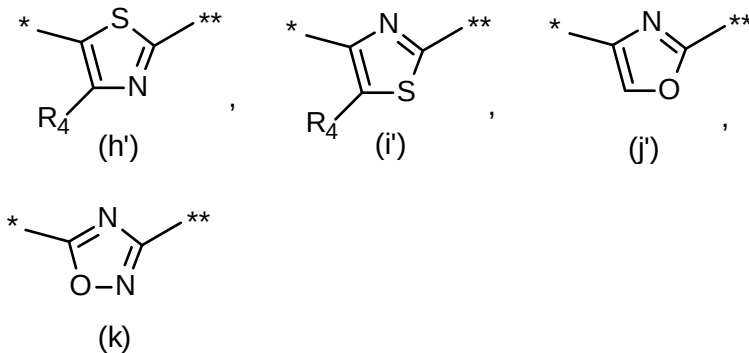
en donde R₉ representa hidrógeno, metilo, ter-butilo, metoxi, metoximetilo, flúor, cloro;

n representa 0 o 1; y

m representa 1 o 2;

y sales del mismo.

4. El compuesto de Fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde el anillo aromático de 5 miembros que comprende X, Y y Z tiene la Fórmula estructural h'), i'), j') o k)



R₁ representa piridinilo, 2-etilpiridinilo, 4,6-dimetilpiridinilo, 3,5-difluoropiridinilo, 3-fluoropiridinilo, 4-trifluorometilpiridinilo, 6-trifluorometilpiridinilo, 5-cloro-3-fluoropiridinilo, 3-cloro-5-fluoropiridinilo, 3-metilpiridinilo, 4-metilpiridinilo, 6-metilpiridinilo, 3-cloropiridinilo, 5-cloropiridinilo, 6-trifluorometoxipiridinilo, fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 2,5-difluorofenilo, 5-cloro-2-hidroxifenilo, 5-fluoro-2-metoxifenilo, 5-cloro-2-fluorofenilo, 2-cloro-5-fluorofenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 3-ciano-4-fluorofenilo, 2-ciclopropilfenilo, 4-cloro-1-metil-1H-pirazolilo, 5-cloro-1,3-tiazolilo o 5-fluoro-2-tienilo;

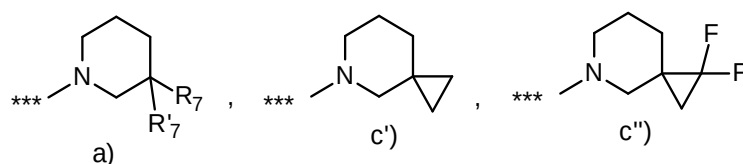
R₂ representa hidrógeno o metilo;

R₃ representa hidrógeno o metilo;

R₄ representa hidrógeno, etilo o trifluorometilo;

R₅ representa hidrógeno o flúor;

R₆ representa un grupo de Fórmula a), c') o c'')



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

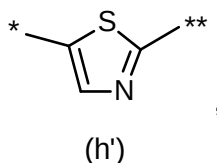
en donde R₇ y R'₇ representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, ter.-butilo, 2-fluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilmetilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, monofluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxi, 3,3-difluorociclobutilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopropilmetoximetilo, ciclobutiloximetilo, 3-fluorbutiloximetilo, 3,3-difluorociclobutilmetoximetilo, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoximetilo, 2,2-difluorociclopropilmetoxi, ciclobutiloxi, 3,3-difluorociclobutiloxi, fluorometilciclopropilmetoxi, difluorometilciclopropilmetoxi, trifluorometilciclopropilmetoxi, flúor;

n representa 0 o 1; y

m representa 1;

y sales del mismo.

5. El compuesto de Fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 2, en donde el anillo aromático de 5 miembros que comprende X, Y y Z tiene la Fórmula estructural h')



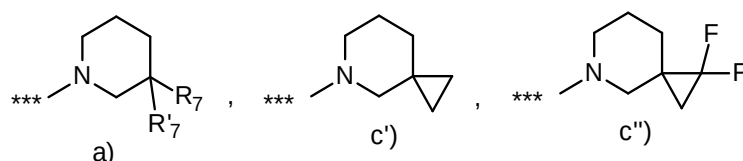
R₁ representa piridinilo, 2-etilpiridinilo, 4,6-dimetilpiridinilo, 3,5-difluoropiridinilo, 3-fluoropiridinilo, 4-trifluorometilpiridinilo, 6-trifluorometilpiridinilo, 5-cloro-3-fluoropiridinilo, 3-cloro-5-fluoropiridinilo, 3-metilpiridinilo, 4-metilpiridinilo, 6-metilpiridinilo, 3-cloropiridinilo, 5-cloropiridinilo, 6-trifluorometoxipiridinilo, fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 2,5-difluorofenilo, 5-cloro-2-hidroxifenilo, 5-fluoro-2-metoxifenilo, 5-cloro-2-fluorofenilo, 2-cloro-5-fluorofenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 3-ciano-4-fluorofenilo, 2-ciclopropilfenilo, 4-cloro-1-metil-1H-pirazolilo, 5-cloro-1,3-tiazolilo, 5-fluoro-2-tienilo;

R₂ representa hidrógeno o metilo;

R₃ representa hidrógeno;

R₅ representa hidrógeno o flúor;

R₆ representa un grupo de Fórmula a), c') o c'')



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

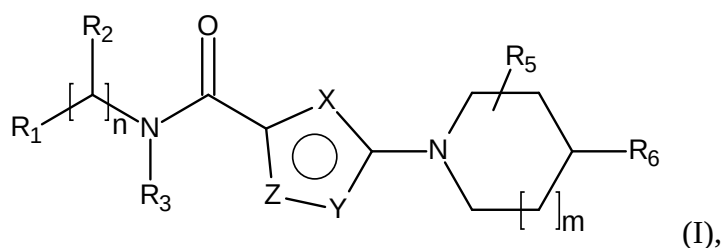
en donde R₇ y R'₇ representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, ter.-butilo, 2-fluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopropilmetilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, monofluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxi, 3,3-difluorociclobutilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopropilmetoximetilo, ciclobutiloximetilo, 3-fluorbutiloximetilo, 3,3-difluorociclobutilmetoximetilo, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoximetilo, 2,2-difluorociclopropilmetoxi, ciclobutiloxi, 3,3-difluorociclobutiloxi, fluorometilciclopropilmetoxi, difluorometilciclopropilmetoxi, trifluorometilciclopropilmetoxi o flúor;

n representa 0 o 1; y

m representa 1;

y sales del mismo.

6. Un procedimiento para la preparación de los compuestos de Fórmula (I)



X representa S, N u O;

Y representa N, S u O,

en donde, cuando X es igual a S, entonces Y es igual a N;

en donde, cuando X es igual a O, entonces Y es igual a N;

Z representa CR₄, O o NR₄;

en donde, cuando X es igual a N e Y es igual a N, entonces Z es igual a O;

en donde, cuando X es igual a S, entonces Z es igual a CR₄ o NR₄;

R₁ representa piridinilo, pirazolilo, tiazolilo, tienilo o fenilo;

en donde el piridinilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes, independientes entre sí, seleccionados del grupo constituido por alquilo (C₁-C₂), flúor, cloro, trifluorometilo y trifluorometoxi;

en donde el pirazolilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes, independientes entre sí, seleccionados del grupo constituido por alquilo (C₁-C₂), flúor, cloro y trifluorometilo;

en donde el tiazolilo puede estar sustituido por cloro;

en donde el tienilo puede estar sustituido por flúor;

en donde el fenilo puede estar sustituido por 1 a 2 sustituyentes, independientes entre sí, seleccionados del grupo de (C₁-C₂), cicloalquilo (C₃-C₄), metoxi, ciano, hidroxilo, flúor, cloro y trifluorometilo;

R₂ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₂);

o

junto al átomo de carbono al que está unido R₂, forma un anillo ciclopropilo;

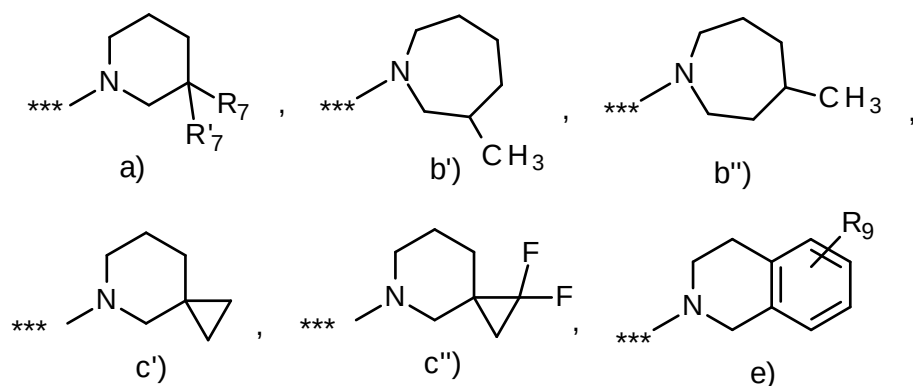
R₃ representa hidrógeno o alquilo (C₁-C₂);

R₄ en CR₄ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₄), fenilo, F, Cl, Br o I;

en donde alquilo (C₁-C₄) puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I y fenilo puede estar sustituido por F, Cl, Br y I,

R₅ representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₄) o flúor;

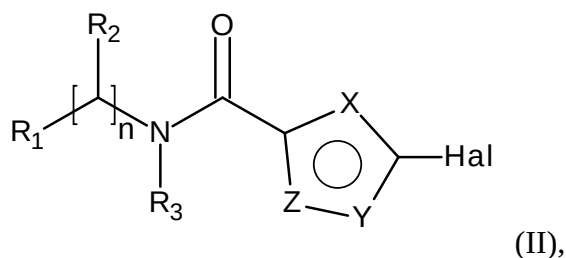
R₆ representa un grupo de Fórmula a), b'), b''), c'), c'') o e)



en donde *** marca la unión con el anillo de piperidina adyacente;

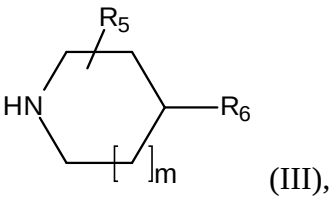
en donde R₇ representa hidrógeno o metilo;

en donde, si R'_7 representa metilo, entonces R_7 representa metilo;
en donde, si R'_7 representa hidrógeno, entonces R_7 representa hidrógeno;
alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_4), alcoxi (C_1-C_4), cicloalcoxi (C_3-C_4) o fenilo;
en donde alquilo (C_1-C_4) puede estar sustituido por cicloalquilo (C_3-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o cicloalcoxi (C_3-C_4) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;
en donde alcoxi (C_1-C_4) puede estar sustituido por cicloalquilo (C_3-C_4) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;
en donde cicloalquilo (C_3-C_4) puede estar sustituido por monofluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo, y puede estar sustituido hasta dos veces por F, Cl, Br y I;
en donde alcoxi (C_1-C_4) puede estar sustituido por cicloalquilo (C_3-C_4) y puede estar sustituido hasta tres veces por F, Cl, Br y I;
en donde cicloalquilo (C_3-C_4) puede estar sustituido una vez o dos veces por F, Cl, Br y I;
en donde cicloalcoxi (C_3-C_4) puede estar sustituido hasta dos veces por F, Cl, Br y I;
en donde R_8 representa hidrógeno o flúor;
en donde R_9 representa hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), F, Cl, Br o I;
en donde alquilo (C_1-C_4) puede estar sustituido por alcoxi (C_1-C_4);
 n representa 0 o 1;
 m representa 0, 1 o 2;
 p representa 0, 1 o 2; y
 q representa 0, 1 o 2;
y sales del mismo, en donde
[A] compuestos de Fórmula (II)



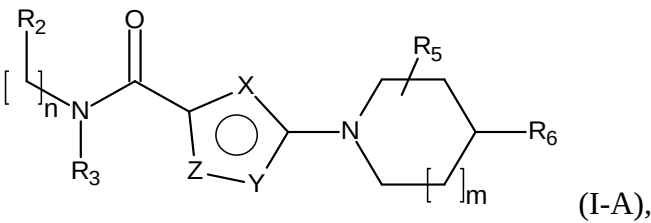
en donde
X, Y, Z, R_1 , R_2 , R_3 y R_4 así como n presentan los significados antes indicados,
Hal representa un grupo saliente;

se hacen reaccionar en presencia de una base con compuestos de Fórmula (III)



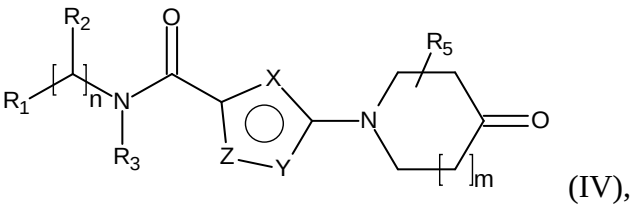
en donde

R₅ y R₆ así como m presentan los significados antes indicados;
en compuestos de Fórmula (I-A)



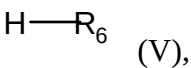
o

[B] compuestos de Fórmula (IV)



en donde

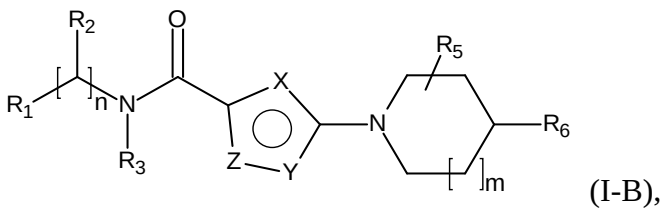
X, Y, Z, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ así como n y m presentan los significados antes indicados;
se hacen reaccionar con compuestos de Fórmula (V)



en donde

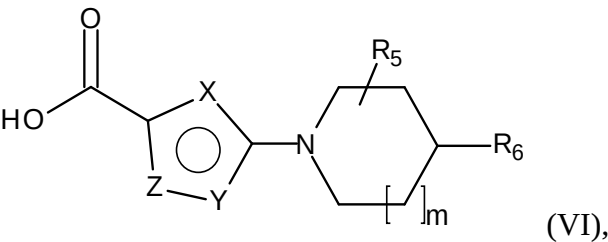
R₆ presenta el significado antes indicado;

en presencia de un agente de reducción, así como opcionalmente un ácido en
compuestos de Fórmula (I-B)



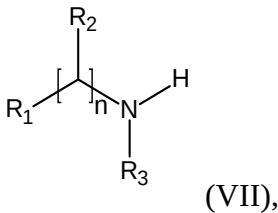
o

[C] compuestos de Fórmula (VI)



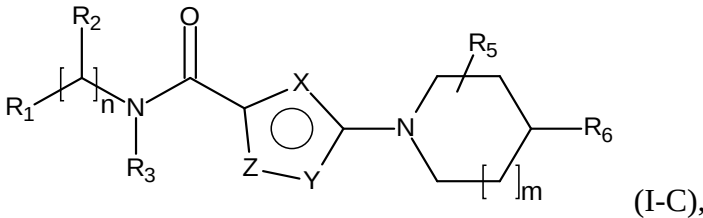
en donde

X, Y, Z, R₄, R₅ y R₆ así como m presentan los significados antes indicados;
se hacen reaccionar con compuestos de Fórmula (VII)



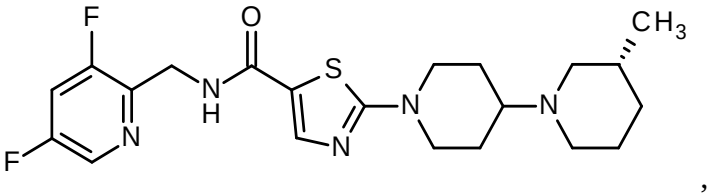
en donde

R₁, R₂ y R₃ así como n presentan los significados antes indicados;
en presencia de un agente de condensación o de activación en compuestos de Fórmula (I-C)



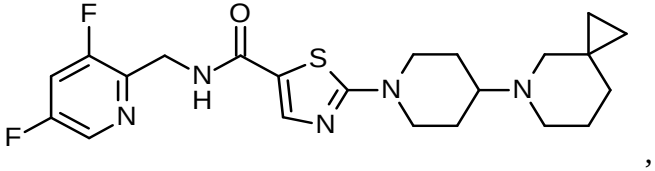
los compuestos de Fórmulas (IA), (IB), (IC) así obtenidos, si es necesario, se separan en sus enantiómeros y/o diastereómeros y/u opcionalmente convertidos con los ácidos apropiados a sales de los mismos.

7. El compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



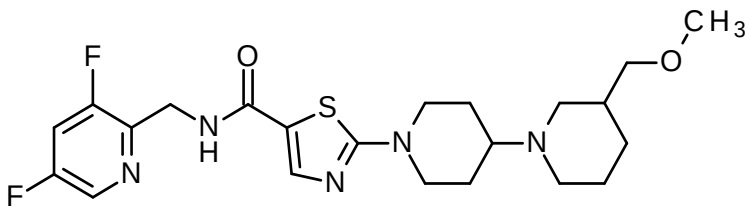
y sales del mismo.

8. El compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



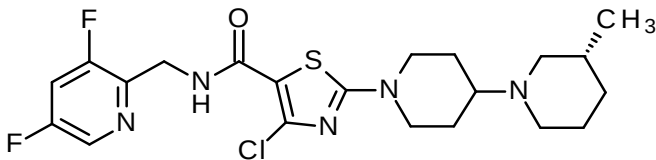
y sales del mismo.

9. El compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



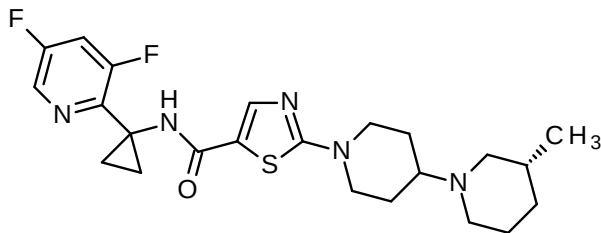
y sales del mismo.

10. El compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



y sales del mismo.

11. El compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



y sales del mismo.

12. Medicamentos que comprenden un compuesto como se define en una de las Reivindicaciones 1 a 5 y 7 a 11, en combinación con una o más sustancias auxiliares inertes, no tóxicas y farmacéuticamente adecuadas.
