

Brigard & Castro
Abogados

Apartado 3892

Cra 7 16-56
Bogotá - Colombia S.A

Tel Conm 3802200
Tel/Fax (57 1) 2827976
(57 1) 3802700

E Mail bncas@brgardycastro.com.co

AS 04 339

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Radicación : 00039628 00000002 Folios: 109
Fecha (RE): 2000-12-05 17:02:13
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 RESPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E S D

REF Expediente No 00 039 628 - Solicitud de Patente de Invención
a favor de MONSANTO COMPANY

Titulada ARILO POLICICLICO Y PIRAZINONAS DE HETEROARILO
SUSTITUIDOS UTILES PARA LA INHIBICION SELECTIVA DE LA
CASCADA DE COAGULACION

RAMIRO CASTRO DUQUE, vecino de Bogotá, portador de la tarjeta profesional No 1003, obrando como apoderado de la sociedad MONSANTO COMPANY, según lo acredita el documento de poder protocolizado en esa División bajo el número 300, para dar cumplimiento al auto No 1934 notificado por estado el 07/09/2000, cuyo término fue prorrogado mediante escrito radicado el 19 de Octubre del 2000, me permito anexar al presente escrito los siguientes documentos

- 1 Nuevas páginas 41, 50, 51, 53, 70, 81 y 82 de la descripción y nuevo capítulo reivindicatorio donde se han realizado todas y cada una de las modificaciones y correcciones solicitadas por el señor Examinador, adicionalmente hemos retirado la reivindicación 50 de la cual desistimos, de acuerdo con la observación del señor Examinador

Brigard & Castro
Abogados

Apartado 3892

Cra 7 16-56
Bogotá Colombia S A

Tel Conm 3802200
Tel./Fax (57 1) 2827876
(57 1) 3802700

E Mail bricas@brigardycastro.com.co

- 2 Extracto para publicación, tarjeta de archivo temático y artes finales (2 de 12 x 12 cm y 1 de 6 x 6 cm)

Del señor Jefe atentamente,



RAMIRO CASTRO DUQUE
C C No 170 322 de Bogotá
Código 340
Cra 7a No 16-56 Piso 9

Santafé de Bogotá, Diciembre 5, 2000
CPB/yg

Nota de retira folio 402 correspondiente a la
tarjeta de archivo temático, para archivarla
y folio 404 que corresponde al extracto para
publicación

202040

FORMA PI 131	
EXTRACTO	
21	00 039.628
22	00-05-29
23	
24	
25	
26	

Dibujo Característico
se puede pegar aquí
6 cms. x 6 cms

74	RAHIRO CASTRO DUQUE
75	Michael S. South, John J. Parlow, Melvin L. Rueppel, Darin E. Jones, Brenda Case, Tom Dice, Richard Lindmark, Michael J. Hayes, Ricky Fenton, Gary Franklin, Horng-Chih Huang, Wei Huang, Carrie Kusturin, Scott Long, Mathew Mahoney, William Neumann, David Reitz, John Trujillo, Ching-Cheng Wang, Rhonda Hood, Gingping Zeng

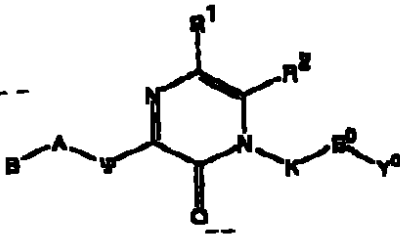
MONSANTO COMPANY, Saint Louis, Missouri, Estados Unidos de América

SELECTIVA DE LA CASCADA DE COAGULACION

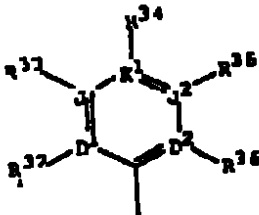
64	TITULO	ARILO POLICICLICO Y PIRAZINONAS DE HETEROARILO SUSTITUIDOS UTILES PARA LA
----	--------	---

CORTAR POR AQUI

Título No	Fecha
57)	
1. Un compuesto cuya Fórmula es	



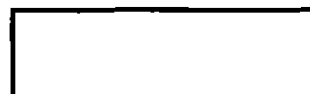
o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde
B es la fórmula (V).



Continúa al respaldo

en donde D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son seleccionados independientemente del grupo consistente en C, N, O, S y un enlace covalente, a condición de que no más de uno sea un enlace covalente, no más de uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 sea O, no más de uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 sea S, uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 debe ser un enlace covalente donde dos de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son O y S, y no más de cuatro de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son N.

**EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**



783
483
✓

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No SOLICITUD 00 039 628

(51) INT CL

(22) FECHA DE
PRESENTACION 00-05-29

(71) SOLICITANTE.

(30) PRIORIDAD

MONSANTO COMPANY

(31) No DE SOLICITUD

(72) INVENTOR/ES (Cont.)

(32) FECHA DE
PRESENTACION

Franklin, Horng-Chih Huang, Wei Huang, Carrie
Kusturin, Scott Long, Mathew Mahoney, William
Neumann, David Reitz, John Trujillo, Ching-Cheng
Wang, Rhonda Wood, Gingping Zeng

(33) PAIS

(74) APODERADO **RAMIRO CASTRO DUQUE**

(54) TITULO **ARILO POLICICLICO Y PIRAZINONAS DE HETEROARILO SUSTITUIDOS UTILES PARA
LA INHIBICION SELECTIVA DE LA CASCADA DE COAGULACION**

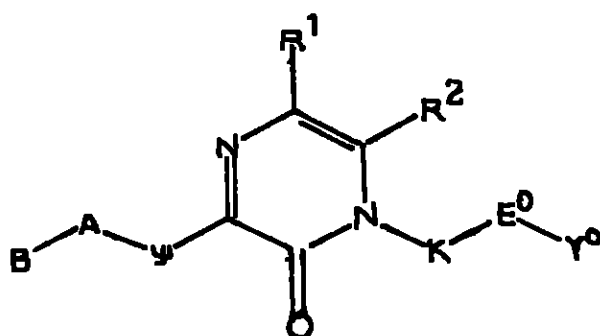
(57) RESUMEN

186
187

10

E Mail brncas@brngardycastro.com.co

Nota
Se retira arte final de 12x12cm
para anexarlo al extracto para
publicación
202040



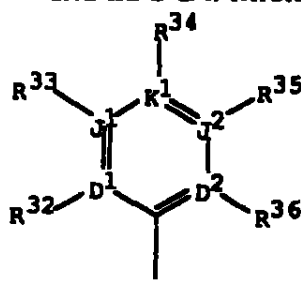
181
X
US

En una incorporacion de compuestos de la Fórmula I o una sal de los mismos farmacéuticamente aceptable

J se selecciona del grupo formado por S

Opcionalmente J se selecciona del grupo que consta de CH-R⁶ y N-R⁶, en el que R⁶ es una mitad espaciadora lineal que tiene una longitud de cadena de 1 a 4 átomos enlazados en el punto de enlace de un sustituyente seleccionado del grupo formado por R^{4a}, R^{4b}, R³⁹, R⁴⁰, R⁵, R¹⁴ y R¹⁵ para formar un anillo heterocíclico que tiene de 5 a 8 miembros contiguos

B es la fórmula (V)



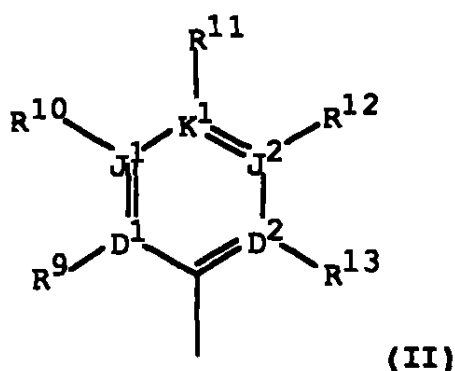
Donde D¹, D², J¹, J² y K¹ se seleccionan de forma independiente del grupo que consta de C, N, O, S y un enlace covalente con la condición de que no mas de un enlace covalente, no mas de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ es O, no mas de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ es S, uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ debe ser un enlace covalente cuando dos de D¹, D², J¹, J² y K¹ son S, y no más de cuatro de D¹, D², J¹, J² y K¹ son N con la condición de que R³², R³³, R¹⁴, R³⁵ y R³⁶ es cada uno seleccionado separadamente para conservar la naturaleza tetravalente del carbono, la naturaleza trivalente del nitrógeno, la naturaleza bivalente del azufre, y la naturaleza bivalente del oxígeno

R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁸, R¹⁹, R³², R³³, R³⁴, R³⁵, y R³⁶, se seleccionan en forma independiente, del grupo formado por hidruro, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, dialquilsulfonio,

486 488
X

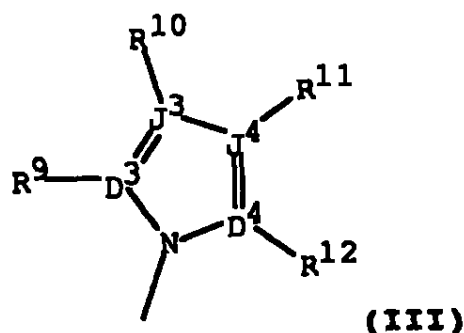
haloalqueniloxialquilo, halocicloalcoxi, halocicloalcoxialquilo, halocicloalqueniloxialquilo, heterociclilo saturado, heterociclilo parcialmente saturado, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroariltioalquilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, arilsulfonilalquilo, aralquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilalquilo, heteroarilsulfonilalquilo, heteroarilsulfonilo, y aralquilsulfonilalquilo

Q es la formula (II)



Donde D¹, D², J¹, J² y K¹ se seleccionan en forma independiente, del grupo formado por C, N, O, S y un enlace covalente con la condición de que no mas de uno sea un enlace covalente, no mas de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ sea O, no mas de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ sea S, uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ debe ser un enlace covalente cuando dos de D¹, D², J¹, J² y K¹ son S, y no más de cuatro de D¹, D², J¹, J² y K¹ son N, con la condición de que R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², y R¹³ se selecciona cada uno de manera independiente para conservar la naturaleza tetravalente del carbono, la naturaleza trivalente del nitrógeno, la naturaleza bivalente del azufre, y la naturaleza bivalente del oxígeno.

Q se seleccionan opcionalmente de la fórmula (III)



Donde D^3 , D^4 , J^3 , y J^4 se seleccionan en forma independiente, del grupo formado por C, N, O, y S, no mas de uno de D^3 , D^4 , J^3 , y J^4 es O, no mas de uno de D^3 , D^4 , J^3 , y J^4 es S, y no más de tres de D^3 , D^4 , J^3 , y J^4 son N, con la condicion de que R^9 , R^{10} , R^{11} , y R^{12} se selecciona cada uno en forma independiente, para conservar la naturaleza tetravalente del carbono, la naturaleza trivalente del nitrogeno, la naturaleza bivalente del azufre, y la naturaleza bivalente del oxigeno

Q se selecciona en forma opcional del grupo conformado por hidruro, alquilo alcoxi, alquilamino, alquiltio, haloalquiltio, alquenilo, alquinilo, heterocicilo saturado, heterocicilo parcialmente saturado, acilo, aroilo, heteroarilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquenilo, cicloalquenilalquilo, cicloalquilalquenilo, haloalquilo, haloalcoxi, haloalquenilo, halocicloalquilo, halocicloalquenilo, haloalcoxialquilo, haloalqueniloxialquilo, halocicloalcoxialquilo, y halocicloalqueniloxialquilo con la condicion de que Z^0 se seleccione de uno distinto a un enlace covalente simple cuando Q es hidruro

K es $(CR^{4a}R^{4b})_n$, en donde n es un entero seleccionado de 1 a 2

$R^{4a}R^{4b}$ se seleccionan separadamente del grupo que consta de halo, hidruro, hidroxilo, ciano, hidroxialquilo, alquilo, alquenilo, alcoxialquilo,

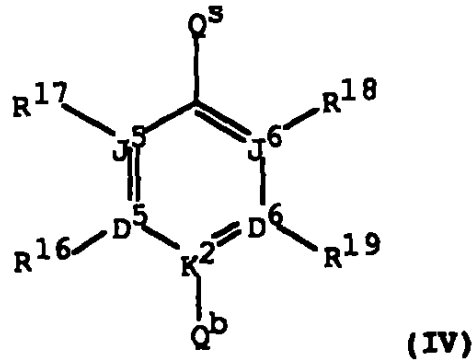
488-190
X

Opcionalmente, K es $G-(CH(R^{15}))_k$, en donde k se selecciona de un entero de 1 a 2 y G se selecciona del grupo formado por O, S, y $N(R^7)$, siempre y cuando R sea uno diferente a hidruro, ciano, halo, amino, alquilamino, dialquilamino, y sulfhidrido, cuando k es 1

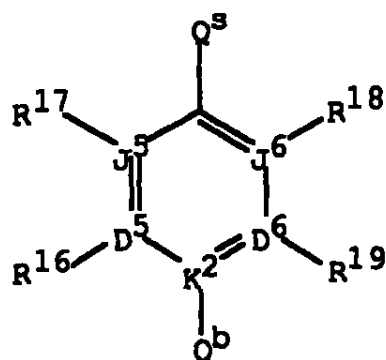
E'' es opcionalmente E^1 cuando K es $G-CH(R^{15})_k$, en donde E^1 se selecciona del grupo formado por un enlace covalente simple O, S, C(O),

C(S), C(O)O, C(S)O, C(O)S, C(S)S, C(O) $N(R^7)$, $(R^7)NC(O)$, C(S) $N(R^7)$, $(R^7)NC(S)$, OC(O) $N(R^7)$, $(R^7)NC(O)O$, SC(S) $N(R^7)$, $(R^7)NC(S)S$, SC(O) $N(R^7)$, $(R^7)NC(O)S$, OC(S) $N(R^7)$, $(R^7)NC(S)O$, $N(R^8)C(O)N(R^7)$, $(R^7)NC(O)N(R^8)$, $N(R^8)C(S)N(R^7)$, $(R^7)NC(S)N(R^8)$, S(O), S(O)₂, S(O)₂ $N(R^7)$, $N(R^7)S(O)_2$, P(O) R^8 , $N(R^7)P(O)R^8$, P(O) $R^8N(R^7)$, $N(R^7)ON(R^7)$, $CR^{4a}=CR^{4b}$ (incluyendo C=C, 1,2-dihidro-1,4-dihidro, y C=CR^{4a}R^{4b}).

Y^0 es la formula (IV)



Donde D^1 , D^6 , J^1 , y J'' se seleccionan en forma independiente, del grupo que consista de C, N, O, S y un enlace covalente con la condicion de que no más



(IV)

En donde D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 se seleccionan separadamente del grupo que consta de C, N, O, S y un enlace covalente simple con la condición de que no mas de uno sea un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 , es O, no mas de D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 , es S, uno de D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 , debe ser un enlace covalente cuando dos de D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 , son S, y no más de cuatro de D^1 , D^6 , J^5 , y J^6 , son N cuando K^2 es carbono con la condición de que R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} se seleccione cada uno en forma independiente, para conservar el caracter tetravalente del carbono, el trivalente del nitrogeno, el bivalente del azufre y del oxígeno

Q^b se selecciona del grupo que consta de $NR^{20}R^{21}$, $NR^{20}R^{21}R^{22}$, aminoalquilenilo, y Q^h , en el que hidruro y R^{20} , R^{21} , y R^{22} se seleccionan separadamente del grupo formado por hidruro, alquilo, hidroxilo, amino, aminoalquilenilo, dialquilamino, alquilamino, e hidroxialquilo, con la condición de que no más de uno de R^{20} y R^{21} sean hidroxilo, amino, alquilamino o dialquilamino al mismo tiempo

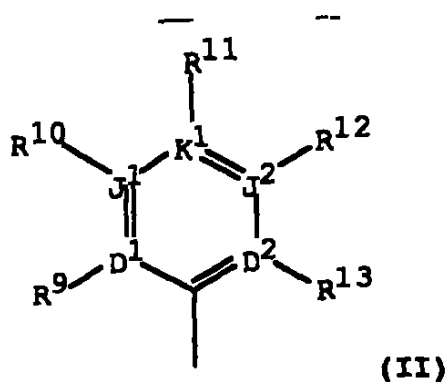
Opcionalmente, Q^h se selecciona del grupo compuesto por

492
490

W^{22} se selecciona del grupo formado por $CR^{41}=CR^{42}$, 1,2-ciclopropilo, 1,2-ciclobutilo, 1,2-ciclohexilo, 1,3-ciclohexilo, 1,2-ciclopentilo, 1,3-ciclopentilo, 2,3-morfolinilo, 2,4-morfolinilo, 2,6-morfolinilo, 3,4-morfolinilo, 3,5-morfolinilo, 1,2-piperazinilo, 1,3-piperazinilo, 2,3-piperazinilo, 2,6-piperazinilo, 1,2-piperidinilo, 1,3-piperidinilo, 2,3-piperidinilo, 2,4-piperidinilo, 2,6-piperidinilo, 3,4-piperidinilo, 1,2-pirrolidinilo, 1,3-pirrolidinilo, 2,3-pirrolidinilo, 2,4-pirrolidinilo, 2,5-pirrolidinilo, 3,4-pirrolidinilo, 2,3-tetrahidrofuranilo, 2,4-tetrahidrofuranilo, 2,5-tetrahidrofuranilo, y 3,4-tetrahidrofuranilo, con la condición de que Z^0 se enlaza directamente con el anillo de pirazinona

R^{41} y R^{42} se seleccionan en forma independiente, del grupo conformado por anidino, hidroxiamino, hidruro, hidroxilo, amino, y alquilo

Q se selecciona del grupo que consta de hidruro, con la condición de que Z'' es diferente a un enlace covalente simple, y la fórmula (II)



Donde D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 se seleccionan en forma independiente, del grupo conformado por C, N, O, S y un enlace covalente con la condición de que no más de uno es un enlace covalente, no más de uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1

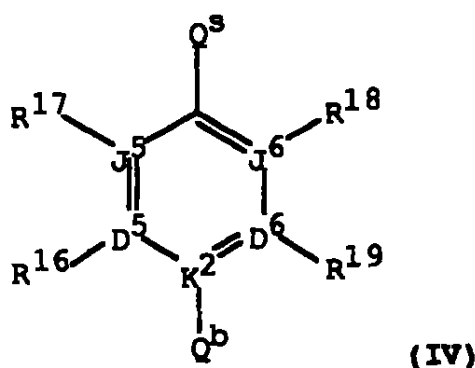
es O, no más de uno de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 es S, uno de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 son S, y no más de cuatro de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 son N, con la condición de que $R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$, y R^{13} se seleccionan separadamente cada uno para conservar la carbono, trivalente del nitrógeno, bivalente del azufre y del oxígeno

K es $(CR^{14}R^{15})_n$, en el que n es un entero seleccionado de 1 a 2

R^{14} y R^{15} se seleccionan separadamente del grupo compuesto por halo, hidruro, hidroxialquilo, alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, y haloalquilo

E^1 es E^1 , cuando K es $(CR^{14}R^{15})_n$, donde E^1 se selecciona del grupo que consta de un enlace covalente simple, $C(O), C(S), C(O)N(R^7)$,

Y^1 es la formula (IV)

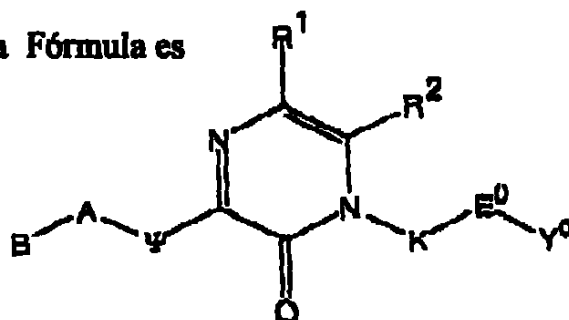


Donde D^5, D^6, J^5 , y J^6 se seleccionan en forma independiente, del grupo formado por C, N, O, S y un enlace covalente, siempre y cuando no más de uno sea un enlace covalente, K sea C, no más de uno de D^5, D^6, J^5 , y J^6 sean O, no más de uno de D^5, D^6, J^5 , y J^6 sean S, uno de D^5, D^6, J^5 , y J^6 deben ser un enlace covalente cuando dos de D^5, D^6, J^5 , y J^6 sean S, y no más de

REIVINDICACIONES

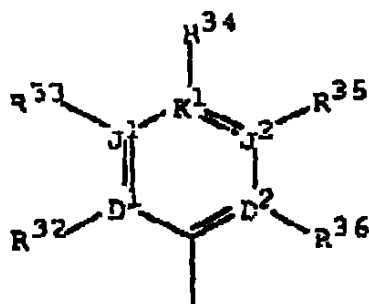
Lo que reivindicamos es

1 Un compuesto cuya Fórmula es



o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde

B es la fórmula (V)



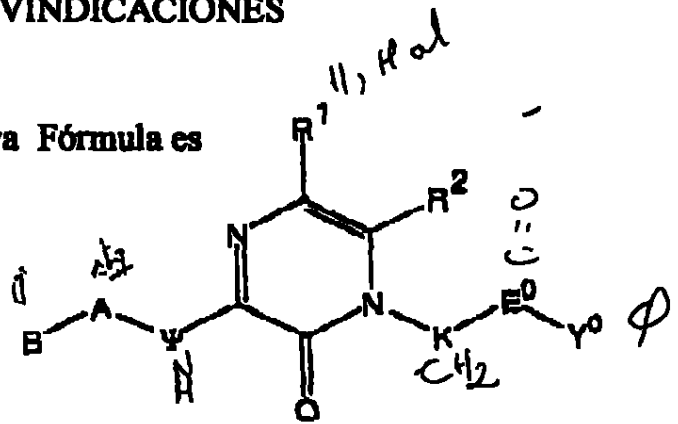
en donde D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son seleccionados independientemente del grupo consistente en C, N, O, S y un enlace covalente, a condición de que no más de uno sea un enlace covalente, no más de uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 sea O, no más de uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 sea S, uno de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 debe ser un enlace covalente donde dos de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son O y S, y no más de cuatro de D^1 , D^2 , J^1 , J^2 y K^1 son N,

R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} , y R^{36} son seleccionados independientemente a partir de un grupo formado por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquilenodioxo, haloalquiltio, alcanonilo, alcoxi, alcoxialquil, haloalcoxialquil, hidroxilo, amino, alcóxiamino, nitró, alquilamino, alquiltio, alquiltioalquil, alquilsulfonil, alquilsulfonilalquil, ari, aralquil, cicloalquil, cicloalquilalquil, heteroaril, heterocíclico, alquilsulfonamido, alquilaminosulfonil, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, alcanonil, haloalcanonil, alquil, alqueni, halo, haloalquil, haloalqueni, haloalcoxi, hidroxihaloalquil, hidroxialquil, aminoalquil, haloalcoxialquil, carboxialquil, carboalcoxi, carboxilo, carboxamido,

REIVINDICACIONES

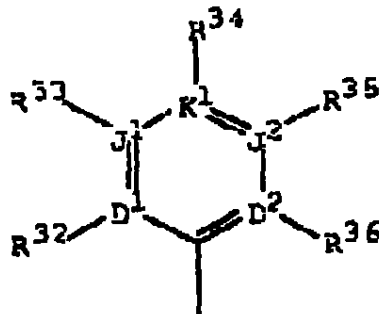
Lo que reivindicamos es

1 Un compuesto cuya Fórmula es



o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde

B es la fórmula (V)



en donde D¹, D², J¹, J² y K¹ son seleccionados independientemente del grupo consistente en C, N, O, S y un enlace covalente, a condición de que no más de uno sea un enlace covalente, no más de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ sea O, no más de uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ sea S, uno de D¹, D², J¹, J² y K¹ debe ser un enlace covalente donde dos de D¹, D², J¹, J² y K¹ son O y S, y no más de cuatro de D¹, D², J¹, J² y K¹ son N,

R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R³², R³³, R³⁴, R³⁵, y R³⁶ son seleccionados independientemente a partir de un grupo formado por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquilenodioxo, haloalquiltio, alcanoiloxi, alcoxi, alcoxialquil, haloalcoxialquil, hidroxilo, amino, alcóxiamino, nitró, alquilamino, alquiltio, alquiltioalquil, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilalquil, arilo, aralquil, cicloalquil, cicloalquilalquil, heteroarilo, heterociclo, alquilsulfonamido, alquilaminosulfonilo, amidosulfonilo, monoalquil amidosulfonilo, dialquil amidosulfonilo, alcanilo, haloalcanilo, alquil, alquenoilo, halo, haloalquil, haloalquenoilo, haloalcoxi, hidroxihaloalquil, hidroxialquil, aminoalquil, haloalcoxialquil, carboxialquil, carboalcoxi, carboxilo, carboxamido,

2
X
4914

carboxamidoalquil y ciano, R^{16} , R^{19} , R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} , y R^{36} son independientemente opcionalmente Q^b a condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

B es seleccionado opcionalmente del grupo formado por hidrógeno, trialkilsilil, C2-C8 alquil, C3-C8 alquilenil, C3-C8 alquenil, C3-C8 alquinnil, y C2-C8 haloalquil, en donde cada miembro del grupo B es sustituido opcionalmente en cualquier carbono hasta e incluyendo 6 átomos desde el punto de unión de B a A con uno o más del grupo formado por R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} , y R^{36} ,

B es escogido opcionalmente del grupo formado por C3-C12 cicloalquil y C4-C9 heterociclicil saturado, en donde cada carbono de anillo es reemplazado opcionalmente por R^{33} , un carbono de anillo diferente del carbono de anillo del punto de unión de B a A es reemplazado opcionalmente con oxo, a condición de que no más de un carbono de anillo sea sustituido con oxo al mismo tiempo, los carbonos de anillo y un nitrógeno adyacente al átomo de carbono en el punto de unión son sustituidos opcionalmente con R^9 o R^{13} , un carbono de anillo o átomo de nitrógeno adyacente a la posición R^9 y dos átomos desde el punto de unión se sustituye opcionalmente por R^{10} , un carbono de anillo o nitrógeno adyacente a la posición R^{13} y dos átomos del punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , un carbono de anillo o tres átomos de nitrógeno del punto de unión y adyacente a la posición R^{10} es opcionalmente sustituido por R^{11} , un carbono de anillo o tres átomos de nitrógeno del punto de unión y adyacente a la posición R^{12} es sustituido opcionalmente con R^{33} , y un carbono de anillo o cuatro átomos de hidrógeno del punto de unión y adyacente a las posiciones R^{11} y R^{33} es opcionalmente sustituido por R^{34} ,

A es seleccionado del grupo formado por un enlace covalente simple, $(W^7)_{rr}-(CH(R^{15}))_{rr}$ y $(CH(R^{15}))_{rr}-(W^7)_{rr}$ en donde rr es un numero entero seleccionado de 0 a 6, y W^7 es seleccionado dentro del grupo

3 

compuesto por O, S, C(O), (R⁷)NC(O), (R⁷)NC(S), y N(R⁷) con la condición de que no más de uno del grupo formado por rr y pa sea 0 al mismo tiempo,

R⁷ es seleccionado dentro del grupo constituido por hidrógeno, hidroxi y alquil,

R¹⁵ es seleccionado dentro del grupo constituido por hidrógen , hidroxi, halo, alquilo y haloalquil,

Ψ es seleccionado dentro del grupo constituido por NH y NOH,

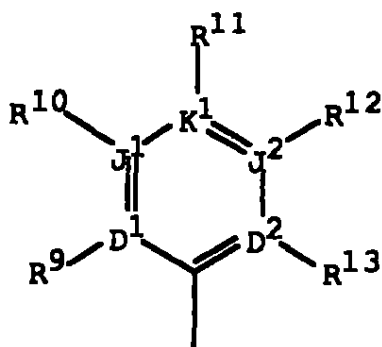
R¹ es seleccionado del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo, alqueni, ciano, halo, haloalquil, haloalcoxi, haloalquiltio, amino, aminoalquil, alquilamino, amidino, hidroxi, hidroxiamino, alcoxi, hidroxialquil, alcoxi-amino, tiol y alquiltio,

R² es Z⁰-Q,

Z⁰ es seleccionado dentro del grupo conformado por un enlace simple covalente, (CR⁴¹R⁴²)_q en donde q es un número entero seleccionado de 1 a 3, (CH(R⁴¹))_g-W⁰-(CH(R⁴²))_p en donde g y p son numeros enteros seleccionados independientemente de 0 a 3 y W⁰ es seleccionado del grupo formado por O, S, C(O), S(O), N(R⁴¹), y ON(R⁴¹), y (CH(R⁴¹))_e-W²²-(CH(R⁴²))_h en donde e y h son numeros enteros independientemente seleccionados de 0 a 1 y W²² es seleccionado en el grupo conformado por CR⁴¹=CR⁴², 1,2-ciclopropil, 1,2-ciclobutil, 1,2-ciclohexil, 1,3-ciclohexil, 1,2-ciclopentil, 1,3-ciclopentil, 2,3-morfolinil, 2,4-morfolinil, 2,6-morfolinil, 3,4-morfolinil, 3,5-morfolinil, 1,2-piperacil, 1,3-piperacil, 2,3-piperacil, 2,6-piperacil, 1,2-piperidinil, 1,3-piperidinil, 2,3-piperidinil, 2,4-piperidinil, 2,6-piperidinil, 3,4-piperidinil, 1,2-pirrolidinil, 1,3-pirrolidinil, 2,3-pirrolidinil, 2,4-pirrolidinil, 2,5-pirrolidinil, 3,4-pirrolidinil, 2,3-tetrahidrofuranil, 2,4-tetrahidrofuranil, 2,5-tetrahidrofuranil, y 3,4-tetrahidrofuranil con la condición de que Z⁰ esté directamente enlazado al anillo de pirazinona,

R^{41} y R^{42} son seleccionados independientemente del grupo conformado por amidino, hidroxiamino, hidrógeno, hidroxil, amino y alquil,

Q es seleccionado del grupo constituido por hidrógeno, con la condición de que Z^0 es diferente de un enlace simple covalente, y la fórmula (II)



en donde D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 son seleccionados independientemente dentro del grupo compuesto por C, N, O, S y un enlace covalente a condición que no más de uno sea un enlace covalente, no más de uno de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 sea O, no más de uno de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 sea S, uno de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 debe ser un enlace covalente donde dos de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 sean O y S, y no más de cuatro de D^1, D^2, J^1, J^2 y K^1 sean N, con la condición de que $R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}$ y R^{13} sean cada uno seleccionado independientemente para mantener la naturaleza tetravalente del carbono, la naturaleza trivalente del nitrógeno, la naturaleza bivalente del azufre y la naturaleza bivalente del oxígeno,

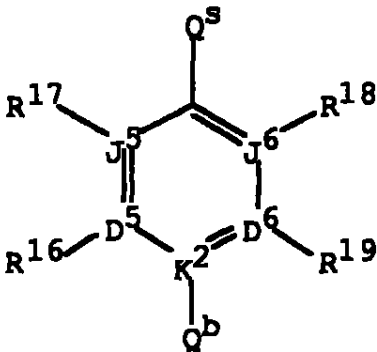
K es $(CR^{4a}R^{4b})_n$ en donde n es un numero entero seleccionado dentro del grupo 1 a 2,

R^{4a} y R^{4b} son seleccionados independientemente en el grupo conformado por halo, hidrógeno, hidroxialquil, alquil, alcoxialquil, alquiltioalquil y haloalquil,

5
497

E^0 es E^1 , cuando K es $(CR^{4a}R^{4b})_n$, en donde E^1 es seleccionado dentro del grupo conformado por un enlace simple covalente, $\underline{C(O)}$, $C(S)$, $C(O)N(R^7)$, $(R^7)NC(O)$, $S(O)_2$, $(R^7)NS(O)_2$ y $S(O)_2N(R^7)$,

Y^0 es la fórmula (IV)

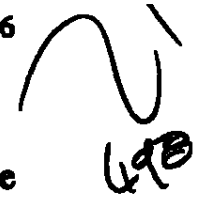


en donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son seleccionados independientemente del grupo constituido por C,N,O,S y un enlace covalente a condición que no más de uno sea un enlace covalente, K^2 sea C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sea O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sea S, debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son O y S y no más de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sean N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente dentro del grupo conformado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxí, amino, nitro, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfonil, alcanoil, haloalcanoil, alquil, alquenal, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, alquilamino, haloalcoxialquil, carboalcoxi y ciano,

Q^b es seleccionado en el grupo constituido por $NR^{20}R^{21}$, aminoalquilenil, Q^{be} en donde Q^{be} es hidrógeno, $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$ y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, a condición que no más de uno de R^{20} y R^{21} sea hidroxí, amino, alquilamino o dialquilamino al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} sea hidroxí, amino, alquilamino o dialquilamino al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo constituido por hidrógeno, alquilo,

6


hidroxi, aminoalquilenil, amin , dialquilamino, alquilamino e hidroxi alquil,

Q^1 es seleccionado en el grupo constituido por un enlace simple covalente, $(CR^{37}R^{38})_b$ donde b es un número entero seleccionado de 1 a 4 y $(CH(R^{14}))_c-W^1-(CH(R^{15}))_d$ en donde c y d son numeros enteros seleccionados en el grupo de 1 a 3 y W^1 es seleccionado dentro del grupo conformado por $C(O)N(R^{14})$, $(R^{14})NC(O)$, $S(O)$, $S(O)_2$, $S(O)_2N(R^{14})$, $N(R^{14})S(O)_2$, y $N(R^{14})$, a condición que R^{14} no sea seleccionado en halo cuando está enlazado directamente a N y que $(CR^{37}R^{38})_b$ y $(CH(R^{14}))_c$ están enlazados con E^0 ,

R^{14} es seleccionado en el grupo formado por hidrógeno, halo, alquilo y haloalquil,

R^{37} y R^{38} son seleccionados independientemente en el grupo compuesto por hidrógeno, alquilo y haloalquil,

R^{38} es seleccionado opcionalmente en el grupo formado por aroil y heteroaroil,

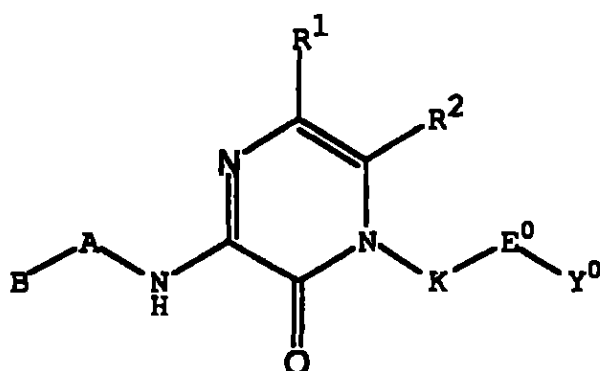
Y^0 es opcionalmente Q^b-Q^m en donde Q^m es $(CH(R^{14}))_e-W^2-(CH(R^{15}))_h$ en donde e y h son numeros enteros seleccionados independientemente de 1 a 2 y W^2 es $CR^{4a}=CR^{4b}$ con la condición de que $(CH(R^{14}))_e$ está enlazado con E^0 ,

Y^0 es seleccionado opcionalmente dentro del grupo formado por Q^b-Q^{ms} y Q^b-Q^{msr} en donde Q^{ms} es $(CH(R^{3b}))_r-W^5$ y Q^{msr} es $(CH(R^{3b}))_r-W^6$, r es un numero entero seleccionado de 1 a 2, y W^5 y W^6 son seleccionados independientemente dentro del grupo formado por 1,4-indenil, 1,5-indenil, 1,6-indenil, 1,7-indenil, 2,7-indenil, 2,6-indenil, 2,5-indenil, 2,4-indenil, 3,4-indenil, 3,5-indenil, 3,6-indenil, 3,7-indenil, 2,4-benzofuranil, 2,5-benzofuranil, 2,6-benzofuranil, 2,7-benzofuranil, 3,4-

7
499

benzofuranil, 3,5-benzofuranil, 3,6-benzofuranil, 3,7-benzofuranil, 2,4-benzotiofenil, 2,5-benzotiofenil, 2,6-benzotiofenil, 2,7-benzotiofenil, 3,4-benzotiofenil, 3,5-benzotiofenil, 3,6-benzotiofenil, 3,7-benzotiofenil, 2,7-imidazo(1,2-a)piridinil, 3,4-imidazo(1,2-a)piridinil, 3,5-imidazo(1,2-a)piridinil, 3,6-imidazo(1,2-a)piridinil, 3,7-imidazo(1,2-a)piridinil, 2,4-indolil, 2,5-indolil, 2,6-indolil, 2,7-indolil, 3,4-indolil, 3,5-indolil, 3,6-indolil, 3,7-indolil, 1,4-isoindolil, 1,5-isoindolil, 1,6-isoindolil, 2,4-isoindolil, 2,5-isoindolil, 2,6-isoindolil, 2,7-isoindolil, 1,3-isoindolil, 3,4-indazolil, 3,5-indazolil, 3,6-indazolil, 3,7-indazolil, 2,4-benzoxazolil, 2,5-benzoxazolil, 2,6-benzoxazolil, 2,7-benzoxazolil, 3,4-bencizoxazolil, 3,5-bencizoxazolil, 3,6-bencizoxazolil, 3,7-bencizoxazolil, 1,4-naftil, 1,5-naftil, 1,6-naftil, 1,7-naftil, 1,8-naftil, 2,4-naftil, 2,5-naftil, 2,6-naftil, 2,7-naftil, 2,8-naftil, 2,4-quinolinil, 2,5-quinolinil, 2,6-quinolinil, 2,7-quinolinil, 2,8-quinolinil, 3,4-quinolinil, 3,5-quinolinil, 3,6-quinolinil, 3,7-quinolinil, 3,8-quinolinil, 4,5-quinolinil, 4,6-quinolinil, 4,7-quinolinil, 4,8-quinolinil, 1,4-isoquinolinil, 1,5-isoquinolinil, 1,6-isoquinolinil, 1,7-isoquinolinil, 1,8-isoquinolinil, 3,4-isoquinolinil, 3,5-isoquinolinil, 3,6-isoquinolinil, 3,7-isoquinolinil, 3,8-isoquinolinil, 4,5-isoquinolinil, 4,6-isoquinolinil, 4,7-isoquinolinil, 4,8-isoquinolinil, 3,4-cinnolinil, 3,5-cinnolinil, 3,6-cinnolinil, 3,7-cinnolinil, 3,8-cinnolinil, 4,5-cinnolinil, 4,6-cinnolinil, 4,7-cinnolinil, 4,8-cinnolinil, y cada carbono e hidrógeno que contiene un nitrógeno del anillo de W^5 y del anillo de W^6 , diferentes de los puntos de unión de W^5 y W^6 , es sustituido opcionalmente con una o más del grupo formado por R^9 , R^{10} , R^{11} y R^{12} , a condición de que Q^b esté enlazado con la posición sustituyente de número de cada W^5 , Q^b está enlazado con la posición sustituyente de número más alto de cada W^6 , y $(CH(R^{38}))_r$ está enlazado a E^0

2 El compuesto tal como se menciona en la Reivindicación 1 tiene la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde

B se selecciona en el grupo formado por aril y heteroaril en donde un carbono adyacente al carbono del punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono del punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y dos átomos del carbono en el punto de unión se substituye opcionalmente por R^{33} , un carbono adyacente a R^{36} y dos átomos del carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{35} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{33} y R^{35} es sustituido por R^{34}

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son seleccionados independientemente dentro del grupo formado por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquilenedioxi, haloalquiltio, alcanoiloxi, alcoxi, hidroxil, amino, alcoxiamino, haloalcanoil, nitro, alquilamino, alquiltio, aril, aralquil, cicloalquil, cicloalquilalquil, heteroaril, heterocicli, alquilsulfonamido, amidosulfonil, monoalquil, amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, alquil, alqueni, halo, haloalquil, haloalqueni, haloalcoxi, hidroxialquil, alquilamino, carboalcoxi, carboxi, carboxamido, ciano, y Q^b ,

B es seleccionado opcionalmente dentro del grupo formado por hidrógeno, trialquilsilil, C2-C8 alquil, C3-C8 alquilenil, C3-C8 alqueni, C3-C8 alquini y C2-C8 haloalquil, en donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido en cualquier carbono hasta e incluyendo 6 átomos desde el punto de unión de B a A con uno o más del grupo consistente en R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

B es seleccionado opcionalmente del grupo constituido por C3-C12 cicloalquil y C4-C9 heterociclil saturado, en donde cada carbono de anillo es sustituido opcionalmente con R^{33} , un carbono de anillo diferente del carbono de anillo en el punto de unión de B y A es opcionalmente sustituido con oxo a condición que no más de un carbono de anillo sea sustituido por oxo al mismo tiempo, carbonos de anillo y nitrógeno adyacente al átomo de carbono en el punto de unión son sustituidos opcionalmente con R^9 o R^{13} , un carbono de anillo o átomo de nitrógeno adyacente a la posición R^9 y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{10} , un carbono de anillo o átomo de nitrógeno adyacente a la posición R^{13} y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{12} , un carbono de anillo o átomo de nitrógeno tres átomos desde el punto de unión y adyacente a la posición R^{10} , es opcionalmente sustituido con R^{11} , un carbono de anillo o átomo de nitrógeno tres átomos desde el punto de unión y adyacente a la posición R^{12} , es opcionalmente sustituido con R^{33} , y un carbono de anillo o átomo de nitrógeno cuatro átomos desde el punto de unión y adyacente a las posiciones R^{11} y R^{33} es opcionalmente sustituido con R^{34} ,

R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, alcoxiamino, alcanoil, haloalcanoil, amidino, guanidino, alquilenedioxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxil, amino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfamido, alquilsulfonil, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, aminoalquil, carboalcoxi, carboxil, carboxialquil, carboxamido y ciano,

A es seleccionado en el grupo conformado por un enlace simple covalente y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_{rr}$ en donde rr es un número entero seleccionado de 0 a 1, pa es un número entero seleccionado de 0 a 3, y

W^7 es seleccionado en el grupo formado por O, S, C(O), $(R^7)NC(O)$, $(R^7)NC(S)$, y $N(R^7)$,

R^7 es seleccionado del grupo formado por hidrógeno, hidroxilo y alquilo,

R^{15} es seleccionado en el grupo formado por hidrógeno, hidroxilo, halo, alquilo y haloalquilo,

R^1 es seleccionado del grupo conformado por hidrógeno, alquilo, ciano, halo, haloalquilo, haloalcoxi, amino, aminoalquilo, alquilamino, amidino, hidroxilo, hidroxiamino, alcoxi, hidroxialquilo, alcoxiamino, tiol, y alquiltio,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es seleccionado del grupo formado por enlace simple covalente y $(CR^{41}R^{42})_q$ donde q es un número entero seleccionado de 1 a 2, $(CH(R^{41}))_g-W^0-(CH(R^{42}))_p$ en donde g y p son números enteros seleccionados independientemente de 0 a 3 y W^0 es seleccionado del grupo formado por O, S, y $N(R^{41})$, y $(CH(R^{41}))_e-W^{22}-(CH(R^{42}))_h$ en donde e y h son números enteros independientemente seleccionados de 0 a 1 y W^{22} es seleccionado de entre el grupo formado por $CR^{41}=CR^{42}$, 1,2-ciclopropilo, 1,2-ciclobutilo, 1,2-ciclohexilo, 1,3-ciclohexilo, 1,2-ciclopentilo, 1,3-ciclopentilo, 2,3-morfolinilo, 2,4-morfolinilo, 2,6-morfolinilo, 3,4-morfolinilo, 3,5-morfolinilo, 1,2-piperazinilo, 1,3-piperazinilo, 2,3-piperazinilo, 2,6-piperazinilo, 1,2-piperidinilo, 1,3-piperidinilo, 2,3-piperidinilo, 2,4-piperidinilo, 2,6-piperidinilo, 3,4-piperidinilo, 1,2-pirrolidinilo, 1,3-pirrolidinilo, 2,3-pirrolidinilo, 2,4-pirrolidinilo, 2,5-pirrolidinilo, 3,4-pirrolidinilo, 2,3-tetrahidrofuranilo, 2,4-tetrahidrofuranilo, 2,5-tetrahidrofuranilo, y 3,4-tetrahidrofuranilo, con la condición de que Z^0 está directamente enlazado con el anillo pirazinona,

R^{41} y R^{42} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, hidroxilo y amino,

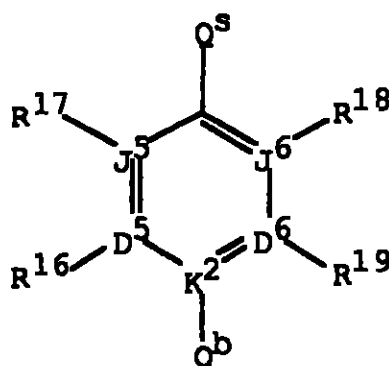
Handwritten signature and number 503.

Q es seleccionado dentro del grupo formado por hidrógeno, con la condición de que Z^0 es diferente de un enlace simple covalente, aril y heteroaril, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono del punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono del punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{12} y cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como a R^{12} es sustituido opcionalmente por R^{11} ,

K es CHR^{4a} en donde R^{4a} es seleccionado dentro del grupo consistente en hidrógeno, hidroxialquil, alquil, alcoxialquil, alquiltioalquil, y haloalquil,

E^0 es seleccionado dentro del grupo formado por un enlace simple covalente, $C(O)N(H)$, $(H)NC(O)$, $(R^7)NS(O)_2$, y $S(O)_2N(R^7)$,

Y^0 es la fórmula (IV),



en donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son seleccionados independientemente en el grupo formado por C, N, O, S y un enlace covalente a condición que no más de uno puede ser un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 puede ser O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 puede ser S, uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5 , D^6 , J^5 y

J^6 son O y S, y no más de 4 de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 pueden ser N, a condición que R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} sean cada uno seleccionado independientemente para mantener la naturaleza tetravalente del carbono, la naturaleza trivalente del nitrógeno, la naturaleza bivalente del azufre y la naturaleza bivalente del oxígeno,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo formado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxi, amino, alcoxi-amino, alquil-amino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfonil, alcanoil, haloalcanoil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxi-alquil, aminoalquil, y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{ba} ,

Q^b es seleccionado dentro del grupo que consiste en $NR^{20}R^{21}$, Q^{ba} en donde Q^{ba} es hidrógeno, $H(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$ y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, a condición que no más de uno de R^{20} y R^{21} sea hidroxi, amino, alquil-amino o dialquil-amino al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} sea hidroxi, amino, alquil-amino, o dialquil-amino al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{22} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente dentro del grupo formado por hidrógeno, alquil, hidroxi, amino, alquil-amino, y dialquil-amino,

Q^a es seleccionado dentro del grupo formado por un enlace simple covalente, $(CR^{37}R^{38})_b$ en donde b es un número entero seleccionado de 1 a 4 y $(CH(R^{14}))_c-W^1-(CH(R^{15}))_d$ en donde c y d son números enteros seleccionados independientemente de 1 a 3 y W^1 es seleccionado de entre el grupo formado por $C(O)N(R^{14})$, $(R^{14})NC(O)$, $S(O)$, $S(O)_2$, $S(O)_2N(R^{14})$, $N(R^{14})S(O)_2$, y $N(R^{14})$, a condición que R^{14} sea seleccionado en otro que no sea halo cuando está enlazado directamente con N y que $(CR^{37}R^{38})_b$ y $(CH(R^{14}))_c$ son enlazados a E^0 ,

R^{14} es seleccionado de entre el grupo formado por hidrógeno, halo, alquil y haloalquil,

R^{37} y R^{38} son seleccionados independientemente en el grupo de hidrógeno, alquil y haloalquil,

R^{38} es opcionalmente seleccionado del grupo formado por aroil y heteroaroil,

Y^0 es opcionalmente Q^b-Q^m en donde Q^m es $(CH(R^{14}))_e-W^2-(CH(R^{15}))_h$ en donde e y h son numeros enteros independientemente seleccionados de 1 a 2 y W^2 es $CR^{4a}=CH$ con la condición de que $(CH(R^{14}))_e$ está enlazado con E^0

3 El compuesto como se menciona en la Reivindicación 2 o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde,

B es seleccionado de entre el grupo formado por hidrógeno, trialkilsilil, C2-C8 alquil, C3-C8 alquemil, C3-C8 alquemil, C3-C8 alquini, y C2-C8 haloalquil, en donde cada miembro del grupo B es sustituido opcionalmente en cualquier carbono hasta e incluyendo 6 átomos desde el punto de unión de B con A con uno o más del grupo formado por R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son seleccionados independientemente dentro del grupo conformado por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alcoxi, hidroxi, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxi alquil, carboalcoxi, carboxi, carboxamido, ciano y Q^b ,

A es $(CH(R^{15}))_{pa}-W^7$ en donde pa es un numero entero seleccionado de 1 a 3 y W^7 es seleccionado en el grupo formado por O, S y $N(R^7)$ en donde R^7 es seleccionado del grupo formado por hidrógeno y alquil,

R^{15} es seleccionado entre el grupo formado por hidrógeno, hidroxil, halo, alquil y haloalquil con la condición de que R^{15} es diferente de hidroxil y halo cuando R^{15} está en el carbono enlazado directamente a W^7 ,

R^1 es seleccionado de entre el grupo formado por hidrógeno, alquil, ciano, halo y haloalquil,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es seleccionado del grupo formado por un enlace simple covalente y $(CR^{41}R^{42})_q$ en donde q es un número entero seleccionado de 1 a 2,

R^{41} y R^{42} son seleccionados independientemente dentro del grupo formado por hidrógeno, hidroxil y amino,

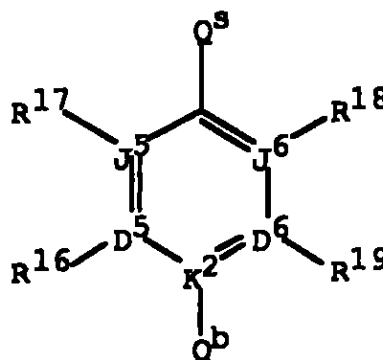
Q es seleccionado dentro del grupo formado por aril y heteroaril, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{12} , cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como a R^{12} es sustituido opcionalmente por R^{11} ,

R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son independientemente seleccionados dentro del grupo constituido por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, alcoxiamino, alcanoil, haloalcanoil, amidino, guanidino, alquilenedioxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxil, amino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfamido, alquilsulfonil, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, aminoalquil, carboalcoxi, carboxil, carboxialquil, carboxamido y ciano,

K es CHR^{4a} en donde R^{4a} es seleccionado dentro del grupo formado por hidrógeno, hidroxialquil, alquil, alcoxialquil, alquiltioalquil, y haloalquil,

E^0 es seleccionado dentro del grupo formado por un enlace simple covalente, $C(O)N(H)$, $(H)NC(O)$, $(R^7)NS(O)_2$ y $S(O)_2N(R^7)$,

Y^0 es la fórmula (IV)



en donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son seleccionados independientemente dentro del grupo formado por C, N, O, S y un enlace covalente a condición que no más de uno es un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es S, uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son O y S, y no más de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente dentro del grupo conformado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxí, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfonil, alcanoil, haloalcanoil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, alquilamino y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

Q^b es seleccionado dentro del grupo formado por $NR^{20}R^{21}$, Q^b en donde Q^{be} es hidrógeno, $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$ y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, a condición de que no más de uno de R^{20} y R^{21} es hidroxí, amino,

16
508

alquilamino o dialquilamino al mismo tiempo que no mas de uno de R^{23} y R^{24} es hidroxil, amino, alquilamino o dialquilamino al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente dentro del grupo conformado por hidrógeno, alquil, hidroxil, amino, alquilamino y dialquilamino,

Q^b es seleccionado dentro del grupo formado por un enlace simple covalente, $(CR^{37}R^{38})_b$ en donde b es un número entero seleccionado de 1 a 3 y $(CH(R^{14}))_c-W^1-(CH(R^{15}))_d$ en donde c y d son números enteros independientemente seleccionados de 1 a 2 y W^1 es seleccionado en el grupo formado por $C(O)N(R^{14})$, $(R^{14})NC(O)$, $S(O)$, $S(O)_2$, $S(O)_2N(R^{14})$, $N(R^{14})S(O)_2$, y $N(R^{14})$, a condición de que R^{14} es seleccionado para que no sea halo cuando está directamente enlazado a N y que $(CR^{37}R^{38})_b$ y $(CH(R^{14}))_c$ están enlazados en E^0 ,

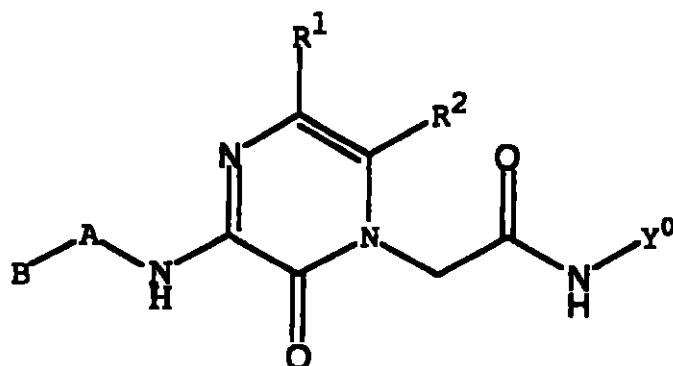
R^{14} es seleccionado de entre el grupo formado por hidrógeno, halo, alquil y haloalquil,

$R^{37}R^{38}$ son independientemente seleccionados de entre el grupo formado por hidrógeno, alquil y haloalquil,

R^{38} es opcionalmente seleccionado de entre el grupo formado por aroil y heteroaroil,

Y^0 es opcionalmente Q^b-Q^m en donde Q^m es $(CH(R^{14}))_e-W^2-(CH(R^{15}))_h$ en donde e y h son numeros enteros independientemente seleccionados de 1 a 2 y W^2 es $CR^{4a}=CH$ con la condición de que $(CH(R^{14}))_e$ está enlazado en E^0

4 El compuesto tal como es citado en la Reivindicación 3 tiene la fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde,

B es seleccionado dentro del grupo formado por hidrógeno, trialkilsilil, C2-C4 alkyl, C3-C5 alkulenil, C3-C4 alquenil, C3-C4 alquinil y C2-C4 haloalkyl, en donde cada miembro del grupo B es sustituido opcionalmente en cualquier carbono hasta e incluyendo 3 átomos desde el punto de unión de B con A con uno o más del grupo formado por R^{32} , R^{33} y R^{34} ,

R^{32} , R^{33} y R^{34} son seleccionados independientemente dentro del grupo conformado por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alcoxi, hidroxil, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, amidosulfonil, monoalkyl amidosulfonil, dialkyl amidosulfonil, alkyl, halo, haloalkyl, haloalcoxi, hidroxialkyl, carboalcoxi, carboxil, carboxamido y ciano,

A es $(CH(R^{15}))_{pa}-N(R^7)$ en donde pa es un numero entero seleccionado entre 1 a 2 y R^7 es seleccionado en el grupo formado por hidrógeno y alkyl,

R^{15} es seleccionado entre el grupo formado por hidrógeno, halo, alkyl y haloalkyl,

R^1 es seleccionado de entre el grupo formado por hidrógeno, alkyl, ciano, halo y haloalkyl,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es seleccionado en el grupo formado por un simple enlace covalente y CH_2 ,

Q es seleccionado en el grupo constituido por aril y heteroaril, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en

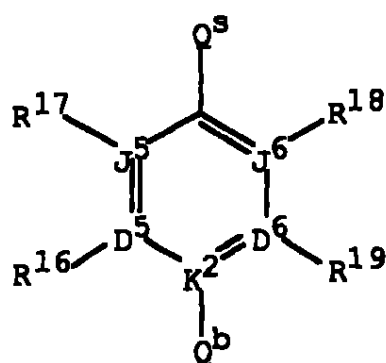


el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^{12} , cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como a R^{12} es sustituido opcionalmente por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, hidroxilo, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfonamido, alquilsulfinil, alquilsulfonil, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, alquil alcoxi, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, carboxilo, carboxamido y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquil, alcoxi, hidroxilo, amino, alcóxiamino, alquilamino, alquilsulfonamido, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialquil amidosulfonil, hidroxialquil, aminoalquil, carboalcoxi, carboxilo, carboxialquil, amido carbonil, halo, haloalquil, y ciano,

Y^0 es la fórmula (IV)



en donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son independientemente seleccionados dentro del grupo conformado por C, N, O, S y un enlace covalente, a condición de que no más de uno sea un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de



D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es S, uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son O y S, y no más de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son N, a condición de que R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son cada uno seleccionado independientemente para mantener la naturaleza tetravalente del carbono, trivalente del nitrógeno, bivalente del azufre y bivalente del oxígeno,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, haloalquiltio, alcoxi, hidroxí, amino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinil, alquilsulfonil, alcanoil, haloalcanoil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxi, hidroxialquil, aminoalquil y ciano,

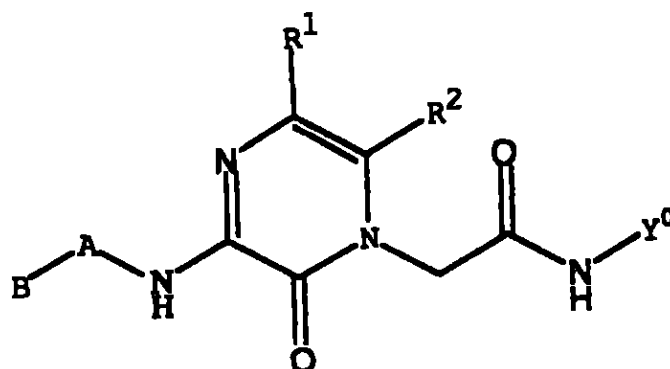
R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

Q^b es seleccionado dentro del grupo consistente en $NR^{20}R^{21}$, Q^{be} en donde Q^{be} es hidrógeno, $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, y $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$, a condición de que no más de uno de R^{20} y R^{21} es hidroxí al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} es hidroxí al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente dentro del grupo constituido por hidrógeno, alquil e hidroxí,

Q^a es seleccionado en el grupo formado por un enlace covalente simple, CH_2 , y CH_2CH_2

5 El compuesto como se menciona en la Reivindicacion 4 tiene la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde,

B es seleccionado de entre el grupo constituido por etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, trimetileno, tetrametileno, butil, 2-butenil, 3-butenil, 2-butil, sec-butil, ter-butil, isobutil, 2-metilpropenil, 2,2,2-trifluoroetil, 3,3,3-trifluoropropil y 2,2-difluoropropil, en donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido en cualquier carbono hasta e incluyendo 3 átomos desde el punto de unión entre B y A con uno o más del grupo constituido por R^{32} , R^{33} y R^{34} ,

R^{32} , R^{33} y R^{34} son independientemente seleccionados de entre el grupo compuesto de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, amidosulfonil, N-metilamidósulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil, metoxycarbonil, etoxycarbonil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil y ciano,

A es seleccionado de entre el grupo constituido por enlace covalente simple, NH y $N(CH_3)$,

R^1 es seleccionado del grupo formado por hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, fluoro, cloro y bromo,

R^2 es Z^0 -Q,

Z^0 es seleccionado entre el grupo formado por un enlace simple covalente y CH_2 ,

Q es seleccionado del grupo formado por fenil, 2-tienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 5-isoxazolil, 2-piridil, 3-piridil, 4-piridil, 2-pirazinil, 2-pirimidinil, 4-pirimidinil, 5-pirimidinil, 3-piridacilil, 4-piridacilil, y 1,3,5-triacin-2-il, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como a R^{12} es sustituido opcionalmente por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son independientemente seleccionados del grupo formado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, metil, etil, propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, N,N-dimetilamidossulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil y ciano,

R^{10} y R^{12} son independientemente seleccionados del grupo formado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, carboximetil, metil,

21
X
5B

etil, propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amin ,
metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, aminometil, 1-
aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino,
metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, N,N-
dimetilamidossulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-
trifluoro-1-hidroxietil, metoxycarbonil, etoxycarbonil, amidocarbonil, N-
metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, fluoro, cloro, bromo y
ciano,

Y^0 es seleccionado del grupo formado por

- 1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benceno,
- 2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,
- 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina, 2- Q^b -4- Q^s -3- R^{16} -6- R^{18} piracina,
- 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{18} -5- R^{18} -4- R^{19} piridacina,
- 2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} pirimidina, 5- Q^b -2- Q^s -3- R^{16} -6- R^{19} pirimidina,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} tiofeno, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tiofeno,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} furano, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} furano,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} pirrol, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} pirrol,
- 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} imidazol, 2- Q^b -4- Q^s -5- R^{17} imidazol,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} isoxazol, 5- Q^b -3- Q^s -4- R^{16} isoxazol,
- 2- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} pirazol, 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{18} tiazol y
- 2- Q^b -5- Q^s -4- R^{17} tiazol,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente desde el
grupo conformado por hidrógeno, metil, etil, isopropil, propil, carboxi,
amidino, guanidino, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino,
aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-
etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometiltio, metilsulfonil,
etilsulfonil, metilsulfonil, etilsulfonil, trifluorometil, pentafluoroetil,
2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-penta fluoropropil, trifluorometoxi, 1,1,2,2-
tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, amidosulfonil, N-

metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroximetil, 1-hidroxi-etil, 2-hidroxi-etil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente W^b con la condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo constituido por NR20R21, Q^{be} en donde Q^{be} es hidrógeno, C(NR25)NR23R24, y N(R26)C(NR25)N(R23)(R24), a condición de que no más de uno de R20, R21, R23 y R24 puedan ser hidroxil, cuando dos cualesquiera del grupo constituido por R20, R21, R23 y R24 están enlazados al mismo átomo y eso dice que el grupo Q^b está enlazado directamente a un átomo de carbono,

R20, R21, R23, R24, R25 y R26 son independientemente seleccionados del grupo formado por hidrógeno, metil, etil, propil, butil, isopropil e hidroxil,

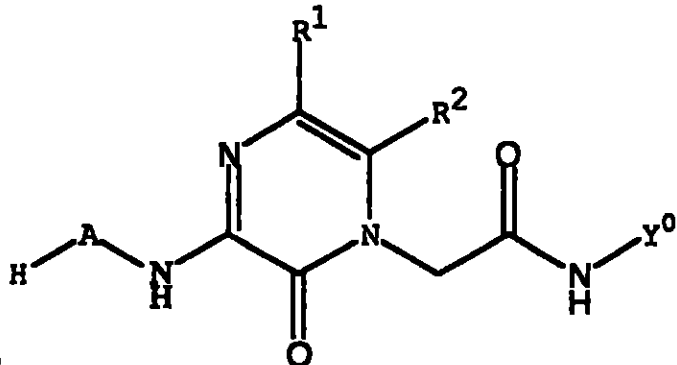
Q^c es seleccionado del grupo formado por un enlace covalente simple, CH_2 , y CH_2CH_2

23

515

216
24
518

6 El compuesto citado en la Reivindicación 4 tiene la Fórmula



o una sal de éste farmacéuticamente aceptable, en donde,

A es seleccionado del grupo conformado por $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)$, y $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)$,

R^1 se escoge de un grupo formado por hidrógeno, metil, etil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoro, cloro y bromo,

R^2 es $\text{Z}^0\text{-Q}$,

Z^0 es escogido del grupo que consiste en un enlace simple covalente y CH_2 ,

Q es escogido del grupo formado por fenil, 2-tienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 5-isoxazolil, 2-piridil, 3-piridil, 4-piridil, 2-pirazinil, 2-pirimidinil, 4-pirimidinil, 5-pirimidinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil y 1,3,5-triazin-2-il, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es sustituido opcionalmente por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos desde el carbono en el punto de enlace es sustituido opcionalmente por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como a R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo conformado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, metil, etil,

317
25
319

propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, N,N-dimetilamidossulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo formado por hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, carboximetil, metil, etil, propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, N,N-dimetilamidossulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2-trifluoro-1-hidroxietil, metoxicarbonil, etoxicarbonil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, fluoro, cloro, bromo y ciano,

Y^0 es seleccionado del grupo formado por

- 1- $Q^b-4-Q^s-2-R^{16}-3-R^{17}-5-R^{18}-6-R^{19}$ benceno,
- 2- $Q^b-5-Q^s-6-R^{17}-4-R^{18}-2-R^{19}$ piridina,
- 3- $Q^b-6-Q^s-2-R^{16}-5-R^{18}-4-R^{19}$ piridina, 2- $Q^b-4-Q^s-3-R^{16}-6-R^{18}$ pirazina,
- 3- $Q^b-6-Q^s-2-R^{18}-5-R^{18}-4-R^{19}$ piridacina,
- 2- $Q^b-5-Q^s-6-R^{17}-4-R^{18}$ pirimidina, 5- $Q^b-2-Q^s-3-R^{16}-6-R^{19}$ pirimidina,
- 3- $Q^b-5-Q^s-4-R^{16}-2-R^{19}$ tiofeno, 2- $Q^b-5-Q^s-3-R^{16}-4-R^{17}$ tiofeno,
- 3- $Q^b-5-Q^s-4-R^{16}-2-R^{19}$ furano, 2- $Q^b-5-Q^s-3-R^{16}-4-R^{17}$ furano,
- 3- $Q^b-5-Q^s-4-R^{16}-2-R^{19}$ pirrol, 2- $Q^b-5-Q^s-3-R^{16}-4-R^{17}$ pirrol,
- 4- $Q^b-2-Q^s-5-R^{19}$ imidazol, 2- $Q^b-4-Q^s-5-R^{17}$ imidazol,
- 3- $Q^b-5-Q^s-4-R^{16}$ isoxazol, 5- $Q^b-3-Q^s-4-R^{16}$ isoxazol,

518
26
020

2- Q^b-5-Q^a-4-R¹⁶ pirazol, 4- Q^b-2-Q^a-5-R¹⁹ tiazol y

2- Q^b-5-Q^a-4-R¹⁷ tiazol,

R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son seleccionados independientemente desde el grupo conformado por hidrógeno, metil, etil, isopropil, propil, amidino, guanidino, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N,N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometiltio, metilsulfinil, etilsulfinil, metilsulfonyl, etilsulfonyl, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, amidosulfonyl, N-metilamidosulfonyl, N,N-dimetilamidosulfonyl, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo conformado por NR₂₀R₂₁, C(NR₂₅)NR₂₃R₂₄, y N(R₂₆)C(NR₂₅)N(R₂₃)(R₂₄), a condición que no más de uno de R₂₀, R₂₁, R₂₃ y R₂₄ puede ser hidroxil, cuando dos cualesquiera del grupo constituido por R₂₀, R₂₁, R₂₃ y R₂₄ están enlazados al mismo átomo y eso dice que el grupo Q^b está enlazado directamente en un átomo de carbono,

R₂₀, R₂₁, R₂₃, R₂₄, R₂₅ y R₂₆ son seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, metil, etil, propil, butil, isopropil e hidroxil,

Q^a es escogido en el grupo formado por un enlace covalente simple, CH₂, y CH₂CH₂

7 El componente citado en la Reivindicación 6 o una sal aceptable farmacéuticamente de éste, en donde,

A es escogido dentro del grupo constituido por CH₂N(CH₃), CH₂N(CH₂CH₃), CH₂CH₂N(CH₃) y CH₂CH₂N(CH₂CH₃),

519
27
22
521

R^1 es seleccionado en el grupo formado por hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoro, cloro y bromo,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es escogido del grupo formado por enlace covalente simple y CH_2 ,

Q es escogido del grupo compuesto por 5-amino-3-amidocarbonilfenil, 5-amino-2-fluorofenil, 3-amino-5-hidroximetilfenil, 5-amino-3-metoxycarbonilfenil, 3-amidinofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, bencil, 3-carboxifenil, 3-carboxi-5-hidroxifenil, 3-carboxi-5-aminofenil, 3-clorofenil, 2-clorofenil, 3-cianofenil, 3-dimetilaminofenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 2-hidroxifenil, 3-hidroxifenil, 3-metanesulfonilaminofenil, 2-metoxifenil, 3-metoxifenil, 3-metoxiaminofenil, 3-metoxycarbonilfenil, 2-metilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-trifluorometilfenil, 2-trifluorometilfenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-3-tienil, 3-bromo-2-tienil, 3-piridil, 4-piridil, 2-tienil y 3-tienil,

Y^0 es seleccionado del grupo constituido por

- 1- $Q^b-4-Q^a-2-R^{16}-3-R^{17}-5-R^{18}-6R^{19}$ benceno,
- 2- $Q^b-5-Q^a-6-R^{17}-4-R^{18}-2-R^{19}$ piridina,
- 3- $Q^b-6-Q^a-2-R^{16}-5-R^{18}-4-R^{19}$ piridina,
- 3- $Q^b-5-Q^a-4-R^{16}-2-R^{19}$ tiofeno, 2- $Q^b-5-Q^a-3-R^{16}-4-R^{17}$ tiofeno,

R^{16} y R^{19} son seleccionados independientemente desde el grupo conformado por hidrógeno, amido, amino, aminometil, metoxi, metilamino, hidroxi, hidroximetil, fluoro, cloro y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de un de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

320
28
X 7 322

R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo formado por hidrógeno, fluoro, cloro, hidroxilo, hidroximetil, amino, carboxilo, y ciano,

Q^b es escogido del grupo formado por Q^{bs} en donde Q^{bs} es hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo formado por hidrógeno y metil,

Q^s es CH_2

8 Un compuesto como el citado en la Reivindicación 7 o una sal aceptable farmacéuticamente de éste en donde dicho componente es seleccionado del grupo constituido por

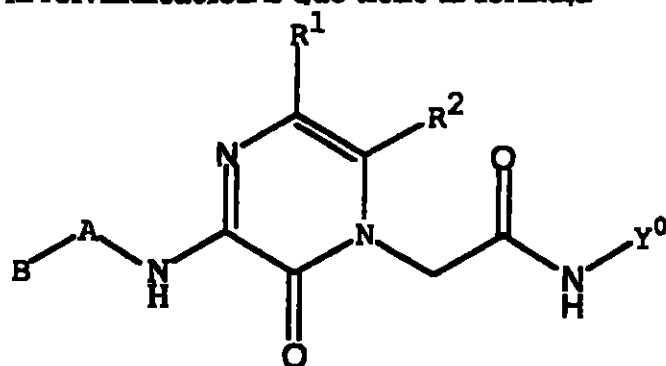
6-[3-aminofenil]-5-cloro-N-[[4-iminometilfenil]metil]-3-[N,N-dimetilhidrazino]-2-oxo-1(2H)-pirazineacetamida,

6-[3-aminofenil]-5-cloro-3-[N-etil-N-metilhidracino]-N-[[4-iminometilfenil]metil]-2-oxo-1(2H)-pirazineacetamida,

6-[3-aminofenil]-5-cloro-3-[N,N-diethylhidracino]-N-[[4-iminometilfenil]metil]-2-oxo-1(2H)-pirazineacetamida,

6-[3-aminofenil]-3-[N-(acetidin-1-il)amino]-5-cloro-N-[[4-iminometilfenil]metil]-2-oxo-1(2h)-pirazineacetamida,

9 El compuesto de la descrito en la reivindicación 2 que tiene la fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable de este, en donde,

B se selecciona del grupo que consiste en arilo y heteroarilo en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es un 32 opcionalmente sustituido por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de

521
28
523

unión es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbón adyacente a R^{32} y dos átomos del carbón en el punto de unión son sustituidos opcionalmente por R^{33} , un carbono adyacente, a R^{36} y dos átomos de carbono en el punto de enlace se sustituyen opcionalmente por R^{35} , y cualquier carbono adyacente tanto a R^{33} como R^{35} es un 34 sustituido opcionalmente por R^{34} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} , y R^{36} , se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alcoxi, hidroxí, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, amidosulfonilo, monoalquilo, amidosulfonilo, dialquilo amidosulfonilo, alquilo y halo, haloalquilo, haloalcoxi, hidroxialquilo, carboalcoxi, carboxi, carboxamido, ciano y Q^b ,

A se selecciona del grupo que consiste en un solo enlace covalente y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_{rr}$ en donde rr es un entero seleccionado entre 0 y 1, pa es un entero seleccionado entre 0 y 3, y W^7 es seleccionado entre el grupo consistente en $(R^7)NC(O)$ y $N(R^7)$, R^7 se selecciona del grupo consistente en hidrógeno, hidroxí y alquilo, R^{15} se selecciona del grupo consistente en hidrógeno, halo, alquilo y haloalquilo,

R^1 se selecciona del grupo consistente en hidrógeno, alquilo, ciano, haloalquilo y halo,

R^2 es Z^0-Q ,

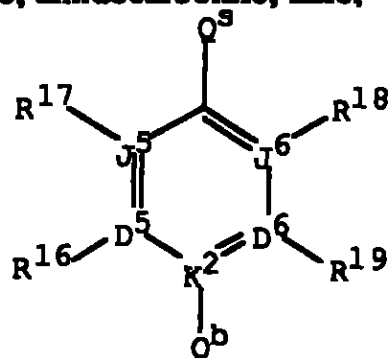
Z^0 se selecciona del grupo consistente en un solo enlace covalente y CH_2 ,

Q se selecciona del grupo consistente en arilo y heteroarilo en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido

Por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono del punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de enlace se sustituyen opcionalmente por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto

522
38
52A

de enlace son opcionalmente substituidos por R^{12} , y cualquier carbono adyacente tanto a R^{10} como R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} , R^9 , R^{11} , y R^{13} se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, hidroxí, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfonamido, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, amidosulfonilo, monoalquilo amidosulfonilo, alquilo, alcoxi, halo, haloalquilo, haloalcoxi, hidroxialquilo, carboxí, carboxamido y ciano, R^{10} y R^{11} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquilo, alcoxi, hidroxí, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquilsulfonamido, amidosulfonilo, monoalquilo, amidosulfonilo, dialquilo, amidosulfonilo, hidroxialquilo, aminoalquilo, carboalcoxi carboxí, carboxialquilo, amidocarbonilo, halo, haloalquilo y ciano, Y^0 es la fórmula (IV)



En donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 se seleccionan independientemente del grupo consistente en C, N, O, S y un enlace covalente con la condición de que no más de uno sea un enlace covalente, $K2$ es C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 , es O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sea S, uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos entre D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son O y S, y no más de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, amidino, guanidino, carboxí, haloalquiltio, alcoxi, hidroxí, amino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcanoil, haloalcanoil, alquilo, halo, haloalquilo, haloalcoxi, hidroxialquilo, aminoalquilo y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de un de R^{16} y R^{19} sean Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{b0} ,

Q^b se selecciona del grupo que consiste en $NR^{20}R^{21}$, Q^{be} en donde Q^{be} es híbrido, y $C(N^{25})N^{23}R^{24}$, con la condición de que no más de uno de R^{20} y R^{21} sea hidroxilo al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} sea hidroxilo al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, alquilo e hidroxilo, Q^f se selecciona del grupo consistente en un solo enlace covalente, CH_2 , y CH_2CH_2

10 El compuesto que se describió en la Reivindicación 9 o una sal farmacéuticamente aceptable de éste, en donde,

B se selecciona del grupo consistente en fenilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo, 3-furilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 2-tiazolilo, 3-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-Piridilo, 2-Pirazinilo, 2-Pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo y 1,3,5-triazin-2-il, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y dos átomos del carbono en el punto de enlace son opcionalmente sustituidos por R^{33} , un carbono adyacente a R^{36} y dos átomos del carbono en el punto de enlace son opcionalmente sustituidos por R^{35} , y cualquier carbono adyacente tanto a R^{33} como R^{35} es sustituido opcionalmente por R^{34} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, amidino, guanidino, carboxilo, metoxilo, etoxilo, isopropoxilo, propoxilo, hidroxilo, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, trifluorometoxilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxilo, fluoro, cloro, bromo, amidosulfonilo, N-metilamidosulfonilo, N,N-dimetilamidosulfonilo, hidroximetilo, 1-

524
32
526

hidroxietilo, 2-hidroxietilo, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, amidocarbonilo, N-metilamidocarbonilo, N,N-dimetilamidocarbonilo, ciano y Q^b,

A se selecciona del grupo consistente en un solo enlace covalente, NH, N(CH₃), N(OH), CH₂, CH₃CH, CF₃CH, NHC(O), N(CH₃)C(O), C(O)NH, C(O)N(CH₃), CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₃CHCH₂, y CF₃CHCH₂, R¹ es seleccionado del grupo consistente en hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, fluor, cloro y bromo, R² es Z^o-Q, Z^o se selecciona del grupo consistente en un solo enlace covalente y CH₂, Q se selecciona del grupo consistente en fenil, 2-etienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 5-isoxazolil, 2-piridil, 3-piridil, 4-piridil, 2-pirazinil, 2-pirimidinil, 4-pirimidinil, 5-pirimidinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil y 1,3,5-triazin-2- y 1, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es sustituido opcionalmente por R⁹, el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹³, un carbono adyacente a R⁹ y dos átomos del carbono en el punto de enlace son sustituidos opcionalmente por R¹⁰, un carbono adyacente a R¹³ y dos átomos del carbono en el punto de enlace son sustituidos opcionalmente por R¹², y cualquier carbono adyacente tanto a R¹⁰ como R¹² se sustituyen opcionalmente por R¹¹, R⁹, R¹¹ y R¹³ se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, metil, etil, propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-Pentafluoropropil trifluorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, fluor, cloro, bromo, metanosulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil, amidocarbonil, N-

metilamídocarbonil, N,N-dimetilamídocarbonil, y ciano, R^{10} y R^{12} se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, carboximetil, metil, etil, propil, isopropil, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietil, metoxycarbonil, etoxycarbonil, amídocarbonil, N-metilamídocarbonil, N,N-dimetilamídocarbonil, flúor, cloro, bromo y ciano,

Y° se selecciona del grupo consistente en

1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benceno,
2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina
3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- piridina, 2- Q^b -4- Q^s -3- R^{16} -6- R^{18} pirazina, 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina,
2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} pirimidina, 5- Q^b -2- Q^s -3- R^{16} -6- R^{19} pirimidina,
3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} tiofena, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tiofena,
3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} furan, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} furan,
3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} pirrola, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} pirrola,
4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} imidazola, 2- Q^b -4- Q^s -5- R^{17} , imidazola,
3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} isoxazola, 5- Q^b -3- Q^s -4- R^{16} isoxazola,
2- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} pirazola, 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} tiazola, y
2- Q^b -5- Q^s -4- R^{17} tiazola,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionadas independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, propilo, carboxi, amidino, guanidino, metoxi, etoxi, isopropoxi, propoxi, hidroxil, amino, aminometilo, 1-aminoetilo, 2-aminoetilo, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, triflorometiltio, metilosulfinilo, etilosulfinilo, metilosulfunilo, etilosulfunilo,

526 528
34

trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, trifluorometoxi, 1,1,2,3-tetrafluoroetoxi, fluoro, cloro, bromo, amidosulfonilo, N-metiloamidosulfonilo, N,N-dimetiloamidosulfonilo, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, 2-hidroxietilo, 2,2,2-trifluoro-1-hidroxietilo y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de un R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{b*} ,

Q^b se selecciona del grupo consistente en Q^{b*} en donde Q^{b*} es un hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, con la condición de que no más de 1 de R^{23} y R^{24} sea hidroxil al mismo tiempo, R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente del grupo consistente en hidrógeno, metilo, etilo e hidroxil,

Q^a se selecciona del grupo consistente en un enlace covalente sencillo, CH_2 y CH_2CH_2

11 El compuesto que se narra en la reivindicación 10 ó una sal de éste aceptable farmacéuticamente, en donde

B sea seleccionada del grupo que consiste en 2-aminofenilo, 3-aminofenilo, 3-amidinofenilo, 4-amidinofenilo, 3-carboxifenilo, 3-carboxi-5-hidroxifenilo, 3-fluorofenilo, 4-clorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 4-hidroxifenilo, 3-metoxiaminofenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, fenilo, 3-trifluorometilofenilo, 2-imidazolil, 2-piridilo, 3-piridilo, 5-cloro-3-trifluorometilo-2-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo y 3-trifluorometilo-2-piridilo,

A se selecciona del grupo que consiste en CH_2 , CH_3CH_2 , CF_3CH_2 , $NHC(O)$, CH_2CH_2 y $CH_2CH_2CH_2$,

R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, propilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, fluor, cloro y bromo,

R^2 es Z^0-Q ,

527
35
529

Z^0 se selecciona del grupo consistente en un enlace sencillo covalente y CH_2 ,

Q se selecciona del grupo que consiste en 5-amino-3-amidocarbonilfenilo, 5-amino-2-fluorofenilo, 3-amino-5-hidroximetilofenilo, 5-amino-3-metoxycarbonilfenilo, 3-amidinofenilo, 3-amino-2-metilofenilo, 5-amino-2-metilotiofenilo, 3-aminofenilo, bencilo, 3-carboxifenilo, 3-carboxi-5-aminofenilo, 3-carboxi-5-hidroxifenilo, 3-carboximetilo-5-aminofenilo, 3-carboximetilo-5-hidroxifenilo, 3-carboximetilofenilo, 3-clorofenilo, 2-clorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3-cianofenilo, 3-dimetiloaminofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2-hidroxifenilo, 3-hidroxifenilo, 3-metanosulfonilaminofenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 3-metoxiaminofenilo, 3-metoxycarbonilfenilo, 2-metilaminofenilo, 3-metilaminofenilo, 2-metilofenilo, 3-metilofenilo, 4-metilofenilo, fenilo, 3-trifluoroacetamidofenilo, 3-trifluorometilofenilo, 2-trifluorometilofenilo, 5-amino-2-tienilo, 5-amino-3-tienilo, 3-bromo-2-tienilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo y 3-tienilo,

Y^0 se selecciona del grupo que consiste en

1- Q^b -4- Q^a 2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benceno,

2- Q^b -5- Q^a 6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,

3- Q^b -6- Q^a 2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina,

3- Q^b -5- Q^a 4- R^{16} -2- R^{19} tiofena, y 2- Q^b -5- Q^a 3- R^{16} -4- R^{17} tiofena,

R^{16} y R^{19} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, amidino, amino, aminometilo, metoxi, metilamino, hidroxi, hidroximetilo, flúor, cloro y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de un R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

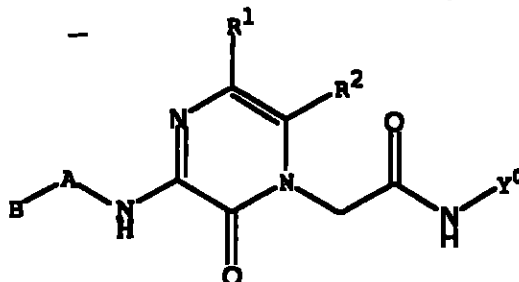
R^{17} y R^{18} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, hidroxi, hidroximetilo, amino, carboxi y ciano,

528
36
320

Q^b se selecciona del grupo que consiste en Q^{bs} en donde Q^{bs} es un hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno y metilo, Q^a es CH_2

12 El compuesto que se narra en la reivindicación 9 con la fórmula



O una sal de ésto aceptable farmacéuticamente, en donde

B se selecciona del grupo que consiste en arilo y heterarilo en donde un carbono adyacente al carbono al punto de unión se sustituye opcionalmente por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{33} , un carbono adyacente a R^{36} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{35} y cualquier carbono adyacente a R^{33} y R^{35} es opcionalmente sustituido por R^{34} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alcoxi, hidroxilo, amino, alcoxi-amino, alquil-amino interior, alquiltio, almidosulfonilo, monoalquilo, amidosulfonilo, dialquilo, aminosulfonilo, alquilo, halo, aloalquilo, alalcoxi, hidroxialquilo, carboalcoxi, carboxilo, carboxamido, ciano y Q^b ,

A se selecciona del grupo que consiste de un enlace covalente sencillo y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_n$ en donde n es un numero entero seleccionado de 0 a 1, pa es un número entero seleccionado de 0 hasta 3, y W^7 es $N(R^7)$,

R^7 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo,

R^{15} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halo, alquilo y haloalquilo,

329
37

R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, haloalquilo, y halo,

R^2 es Z^0-Q ,

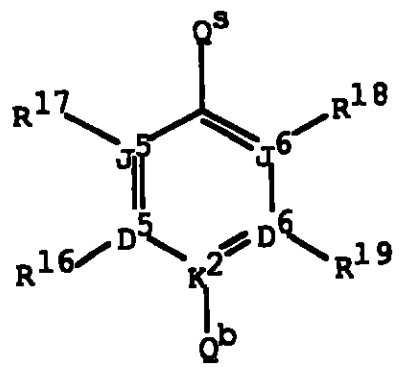
Z^0 es un enlace sencillo covalente,

Q se selecciona del grupo que consiste en arilo y heteroarilo en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de union es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} y cualquier carbono adyacente a R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son independientemente seleccionados del grupo consistente en hidrógeno, hidroxí, amino, amidino, guanidino, alquilamino , alquiltio, alcoxi, alquilosulfinilo, alquilosulfonilo, amidosulfonilo, monoalquilamidossulfonilo, alquilo, halo, haloalquilo, haloalcoxi, hidroxialquilo, carboxi, carboxamido y ciano,

R^{10} y R^{13} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquilo, alcoxi, alcoxiamino, aminoalquilo, hidroxí, animo, alquilamino , alquilosulfonamido, amidosulfonilo, monoalquilo, amidosulfonil , dialquiloamidossulfonilo, hidroxialquilo, aminoalquilo, halo, haloalquilo, carboalcoxi, carboxi, carboxiamido, carboxialquilo y ciano,

Y^0 es la fórmula (IV)



530
38
032

En donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son independientemente seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, S y un enlace covalente con la condición de que no más que uno sea un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sea S uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 deben ser un enlace covalente cuando dos de los D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sean O y S y no más de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 sean N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} se seleccionan independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxi, haloalquilo, alcoxi, hidroxi, amino, alquilamino, alquilo, alquilosulfonilo, alquilosulfonilo, alcanilo, haloalcanilo, alquilo, halo, haloalquilo, haloalcoxi, hidroxialquilo, aminoalquilo y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la condición de que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{ba} ,

Q^b se selecciona del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$, Q^b en donde Q^b es hidrógeno, y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo,

Q^a es CH_2

13 El Compuesto que se narra en la reivindicación 12 o una sal de éstos aceptable farmacéuticamente, en donde

B se selecciona del grupo que consiste en fenilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-furilo, 3-furilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 2-tiazolilo, 3-isoxazolilo, y 5-isoxazolilo, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y 2 átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{33} , un carbono adyacente R^{36} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{35} y

33'
39
533

cualquier carbono adyacente a R^{33} y R^{35} es opcionalmente sustituido por R^{34} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, amidino, guanidino, metilo, etilo, metoxi, etoxi, hidroxilo, amino, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, flúor, cloro, bromo, amidosulfonilo, N-metilamidossulfonilo, hidroximetilo, amidocarbonilo, carboxi, ciano y Q^b ,

A se selecciona del grupo que consiste en un enlace covalente sencillo, NH , $N(CH_3)$, CH_2 , CH_3CH , y CH_2CH_2 ,

R^1 se selecciona del grupo que consiste en un hidrido, trifluorometilo, pentafluoroetilo, fluor y cloro,

R^2 se selecciona del grupo que consiste en fenilo, 2-tienilo, 2-furilo, 2-pirrolilo, 2-imidazolilo, 2-tiazolilo, 3-isoxazolilo, 2-piridilo y 3-piridilo, en donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos de carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos de carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} y cualquier carbono adyacente a R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son independientemente seleccionados del grupo que consiste hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, etoxi, hidroxilo, amino, N-metilamino, N, N-dimetilamino, etiltio, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, fluor, cloro, bromo, aminosulfonilo, N-metilamidossulfonilo, N,N-dimetilamidossulfonilo, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, amidocarbonilo, N-metilamidocarbonilo, carboxi y ciano,

R^{10} y R^{12} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, amidino, amidocarbonilo, N-metilamidocarbonilo,

53240 534

guanidino, metilo, etilo, metoxi, etoxi, hidroxil, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, 2-hidroxietilo, carboxi, carboximetilo, amino, acetamido, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, trifluoroacetamido, aminometilo, N-metilamino, dimetilamino, amidosulfonilo, N-metilamidosulfonilo, N,N-dimetilamidosulfonilo, metoxycarbonilo, flúor, cloro, bromo y ciano,

Y^0 se selecciona del grupo que consiste en

1- Q^b -4- Q^a -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6 R^{19} benceno

2- Q^b -5- Q^a -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina, 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} tiofeno

3- Q^b -6- Q^a -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina, 3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} tiofeno

3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} furan, 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} furan

3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} pirrole, 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} pirrole

4- Q^b -2- Q^a -5- R^{19} tiazole y 2- Q^b -5- Q^a -4- R^{17} tiazole

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, amidino, guanidino, metoxi, hidroxil, amino, aminometilo, 1-aminoetilo, 2-aminoetilo, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilosulfonilo, metilosulfonilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, trifluorometoxi, fluor, cloro, amidosulfonilo, N-metilamidosulfonilo, hidroximetilo, carboxi y ciano

Q^b es seleccionado del grupo que consiste en $NR^{20}R^{21}$ y

$C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, con la condición que dicho grupo Q^b esté enlazado directamente a un átomo de carbono,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} y R^{25} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en un hidrógeno, metilo y etilo,

Q^a es CH_2

14 El compuesto que se narra en la reivindicación 13 o una sal de éstos farmacéuticamente aceptable, en donde

B es seleccionada del grupo que consiste en 2-aminofenilo, 3-aminofenilo, 3-amidin fenilo, 4-amidinofenilo, 3-carboxifenilo, 3-

533
41
505

carboxi-5-hidroxifenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3-hidroxifenilo, 4-hidroxifenilo, 3-metoxiaminofenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 3-metilofenilo, 4-metilofenilo, fenilo, 3-trifluorometilofenilo, 2-imidazol, 2-piridilo, 3-piridilo, 5-cloro, 3-trifluorometilo, 2-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo, 3-tienilo y 3 trifluorometilo-2-piridilo,

A se selecciona del grupo que consiste en CH_2 , CH_2CH_3 , CF_3CH_2 , NHC(O) , CH_2CH_2 y $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$,

R^1 se selecciona del grupo que consiste en un hidrógeno, trifluorometilo, pentafluoroetilo, flúor y cloro,

R^2 se selecciona del grupo que consiste en 5-amino-3-amidocarbonilofenilo, 5-amino-2-fenilo, 3-amino-5-hidroximetilofenilo, 5-amino-3-metoxicarbonilofenilo, 3-amidinofenilo, 3-amino-2-metilofenilo, 5-amino-2-metilofenilo, 3-aminofenilo, bencilo, 3-carboxifenilo, 3-carboxi-5-aminofenilo, 3-carboxi-5-hidroxifenilo, 3-carboximetilo-5-aminofenilo, 3-carboximetilo-5-hidroxifenilo, 3-carboximetilofenilo, 3-clorofenilo, 2-clorofenilo, 3-cianofenilo, 3-dimetilaminofenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2-hidroxifenilo, 3-hidroxifenilo, 3-metanesulfonilaminofenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 3-metoxiaminofenilo, 3-metoxicarbonilofenilo, 2-metilaminofenilo, 3-metilaminofenilo, 2-metilofenilo, 3-metilofenilo, 4-metilofenilo, fenilo, 3-trifluoroacetamidofenilo, 3-trifluorometilofenilo, 2-trifluorometilofenilo, 5-amino-2-tienilo, 5-amino-3-tienilo, 3-bromo-2-tienilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tienilo y 3-tienilo,

Y^0 se selecciona del grupo que consiste en

1 - Q^b -4 Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} bencina,

2- Q^b -5 Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,

3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina,

3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} tiazene, y 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17}

534
42
536
A
/

tiofene,

R^{16} y R^{19} son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, amino, aminometil, metoxe, metilamine, hidroxide, hidrosimetil, fluoruro, cloro y ciano, R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, fluoruro, cloro, hidroxide, hidroximetil, amino, carbono y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo que consiste de Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} so independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno y metil,

Q^a es CH_2

15 El compuesto como el citado en la Reinvidicación 14 o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde,

B es seleccionada del grupo que consiste de 3 - aminofenil, 3-amidinofenil, 4-amidinofenil, 3-clorofenil, 4-clorofenil, 3,4-diclorofenil, 2-fluorofenil, 4-metilfenil, fenil, 2-imidazolil, 3-piridil, 4-piridil, y 3-triflorometil-2-piridil,

A es seleccionado del grupo que consiste de CH_2 , $NHC(O)$, CH_2CH_2 y $CH_2CH_2CH_2$,

R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno y cloro,

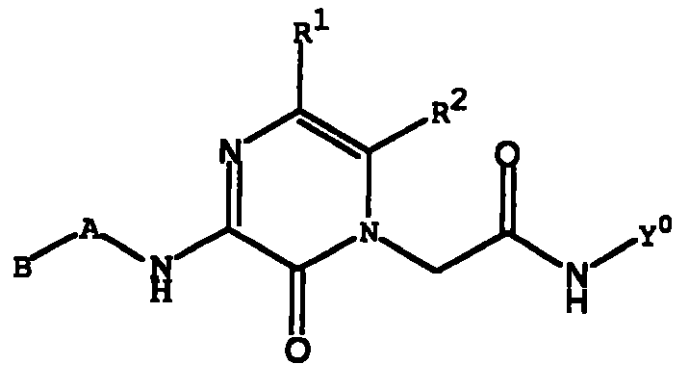
R^2 es seleccionado del grupo que consiste de 3-aminofenil, benceno, 3-clorofenil, 3-dimetilaminofenil, 3-hidroxifenil, 3-

535
43
537

metanosulfonilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-bromo-2-tienil, 2-tienil, y 3-tienil,

Y⁰ es seleccionado del grupo que consiste de 5-amidino - 2-tienilmetil, 4-amidinobencil, 2-fluoro-4-amidinobencil, y 3-fluoro-4-amidinobencil

16 Un compuesto como citado en la Reinvención 9 donde dicho compuesto es seleccionado del grupo que tiene Fórmula

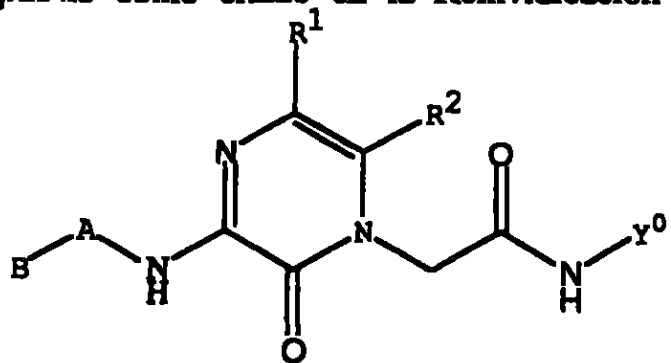


o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde
 R² es 3-aminofenil, B es 3-clorofenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-aminodinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-aminofenil, B es fenil, A es CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es fenil, B es 3-clorofenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-aminofenil, B es 2-imidazolil, A es CH₂CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-dimetilaminofenil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 2-metilfenil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es fenil, B es 3-aminofenil, A es C(O)NH, Y⁰ es 4-aminobencil, y R¹ es hidrógeno, R² es fenil, B es 3-amidnofenil, A es CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-(N-metilamino)fenil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-tienil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-metilsulfonamidofenil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es fenil,

536
44
538

B es 4-amidinofenil, A es CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-metilaminofenil, B es fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es hidrógeno, R² es fenil, B es fenil, A es CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es fenil, B es 4-piridil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es fenil, B es 3-piridil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-clorofenil, B es 4-piridil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro, R² es 3-metilfenil, B es 4-fenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es hidrógeno, R² es 3-tienil, B es 3-clorofenil, A es CH₂CH₂, Y⁰ es 4-amidinobencil, y R¹ es cloruro,

17 El compuesto como citado en la Reinvidicación 2 con la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, C2-C8 alkil, C3-C8 alkenil, C3-C8 alkinil, y C2-C8 haloalkil, donde cada miembro del grupo B está opcionalmente sustituido en cualquier carbono hasta incluir 6 átomos desde el punto de adhesión de B a A con uno o más del grupo que consiste de R³², R³³, R³⁴, R³⁵ y R³⁶, R³², R³³, R³⁴, R³⁵ y R³⁶ son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alkoxe, Hidroxe, amino, alkoxiamino, alquilamino, alkitio, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, diakil amidosulfonil, alkil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidrosialkil, carboalkoxe, carboxe, carboxamido, ciano y Q^b,

A es seleccionado del grupo que consiste de un enlace covalente y (CH(R¹⁵))_{rr} -(W⁷)_{rr} donde rr es un integrante seleccionado de 0 através

537
45
539

de 1, pa es integrante seleccionado de 0 a través de 3, y W^7 es seleccionado del grupo que consiste de $(R^7) NC(O)$ y $N(R^7)$,

R^7 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, hidroxí y alkil,

R^{15} es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halo, alkil y haloalkil,

R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, alkil, ciano, haloalkil y halo,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es seleccionado del grupo que consiste de un único enlace covalente y CH_2 ,

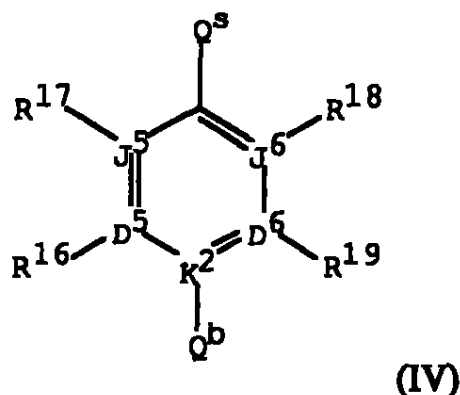
Q es seleccionado del grupo que consiste de aril y heteroaril donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es sustituido opcionalmente por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es sustituido opcionalmente por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de enlace que es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente de R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de enlace que es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} que es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, hidroxí, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alquilo, alkilsulfonamido, alkildulfinil, alkilsulfonil, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, alkil, alkoxí, halo, haloalkil, haloalkoxí, hidrociálkil, carboxí, carboxamido, y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alkil, alkoxí, hidroxí, amino, alkoxiamino, alquilamino, alkilsulfonamida, amidosulfonil, monoalkil amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, hidroxiálkil, aminoalkil, carboalkoxí, carboxí, carboxiálkil, amídocarbonil, halo, haloalkil, y ciano,

538
46
540

Y^0 es formula (IV)



donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son seleccionados independientemente del grupo que consiste de C,N, O,S y un enlace covalente con la provisión de que no más de uno es un enlace covalente, K^2 es C, no más que uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es 0, no más que uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es S, uno de D^5 , D^6 , J^5 , y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son 0 y S, y no más que cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, haloalkiltio, alkoxe, hidrox, amino, alquilamino, alkiltio, alkilsulfinil, alkilsulfonil, alkanoil, haloalkanoil, alquil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, aminoalkil y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión que no más que uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo que consiste de $NR^{20} R^{21}$, Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno, $C(NR^{25})NR^{23} R^{24}$, y $N(R^{26})C(NR^{25}) N(R^{23}) (R^{24})$, con la provisión que no más que uno de R^{20} y R^{21} sea hidrox al mismo tiempo y que no más que uno de R^{23} y R^{24} sea hidrox al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alquil e hidrox,

Q^s es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente, CH_2 y CH_2CH_2

53+
47
CHI

18 El compuesto como citado en la Reivindicación 17 o una sal farmacéuticamente aceptable, donde

B es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propenil, propil, isopropil, butil, 2-butenil, 3-butenil, 2-butenil, sebutil, tert-butil, isobutil, 2-metilpropenil, 1-pentil, 2-pentenil, 3-pentenil, 4-pentenil, 2-pentinil, 3-pentinil, 2-pentil, 1-metil-, 2-butenil, 1-metil-3-butenil, 1-metil-2-butenil, 3-pentil, 1-etil-2-propenil, 2-metilbutil, 2-metil-2-butenil, 2-metil-3-butenil, 3-metilbutil, 3-metil-2-butenil, 3-metil-3-butenil, 1-hexil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 5-hexenil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 2-hexil, 1-metil-2-pentenil, 1-metil-3-pentenil, 1-metil-4-pentenil, 1-metil-2-pentinil, 1-metil-3-pentinil, 3-hexil, 1-etil-2-butenil, 1-etil-3-butenil, 1-propil-2-propenil, 1-etil-2-butenil, 1-heptil, 2-heptenil, 3-heptenil, 4-heptenil, 5-heptenil, 6-heptenil, 2-heptenil, 3-heptenil, 4-heptenil, 5-heptenil, 2-heptil, 1-metil-2-hexenil, 1-metil-3-hexenil, 1-metil-4-hexenil, 1-metil-5-hexenil, 1-metil-2-hexinil, 1-metil-3-hexinil, 1-metil-4-hexinil, 3-heptil, 1-etil-2-pentenil, 1-etil-3-pentenil, 1-etil-4-pentenil, 1-butil-2-propenil, 1-etil-2-pentinil, 1-etil-3-pentinil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2-difluoropropil, 4-trifluorometil, 5,5,5-trifluoropentil, 4-trifluorometilpentil, 5,5,6,6,6-pentafluorohexil, y 3,3,3-trifluoropropil, donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido en cualquier carbono hasta incluir 5 átomos desde el punto de enlace de B a A con uno o más del grupo que consiste de

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxide, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo,

48 540 3642

amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroxemetil, 1-hidroxetil, 2-hidroxetil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxetil, metoxicarbonil, etoxicarbonil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, ciano y Q^b,

A es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente, BH, N(CH₃), N(OH), CH₂, CH₃, CH, CF₃CH, NHC(O), N(CH₃) C(O), C(O)NH, C(O)N(CH₃), CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₃CH₂CH₂, y CF₃CHCH₂,

R¹ es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, metil etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, fluoruro, cloruro y bromo,

R² es Z⁰-Q,

Z⁰ es seleccionado del grupo que consiste del unico enlace covalente y CH₂,

Q es seleccionado del grupo que consiste de fenil, 2-tienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 5-isoxazolil, 2-piridil, 3-piridil, 4-piridil, 2-pirazinil, 2-pirimidinil, 4-pirimidinil, 5-pirimidinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil, y 1,3,5 triazin-2-il, donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R⁹, el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹³, un carbono adyacente a R⁹ y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹⁰, un carbono adyacente a R¹³ y dos átomos del carbono en el punto de enlace que es opcionalmente sustituido por R¹², y cualquier carbono adyacente a ambos R¹⁰ y R¹² que es opcionalmente sustituido por R¹¹,

R⁹, R¹¹ y R¹³ se seleccionan independientemente des grupo que consiste de hidrógeno,amidino, guanidino, carboxe, metil, etil, propil, isopropil, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidrox, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, N-etilamin, metiltio, etiltio, isopropiltio,

54
49
543

trifluoropropil, pentafluorometoxe, 1,1,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroxietil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, carboximetil, metil, etil, propil, isopropil, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxide, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metanesulfonamido, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroximetil, 1-hidroximetil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil, metoxicarbonil, etoxicarbonil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, fluoruro, cloruro, bromo y ciano,

Y^0 es seleccionado del grupo que consiste de

- 1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} bencina,
- 2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,
- 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina, 2- Q^b -4- Q^s -3- R^{16} -6- R^{18} pirazina, 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{18} -5- R^{18} -4- R^{19} piridazina,
- 2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} pirimidina, 5- Q^b -2- Q^s -3- R^{16} -6- R^{19} pirimidina, 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} tiofene, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tiofene,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} , furan, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} furan,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} pirrole, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} pirrole,
- 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} imidazole, 2- Q^b -4- Q^s -5- R^{17} imidazole,
- 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} isoxazole, 5- Q^b -3- Q^s -4- R^{16} isoxazole,
- 2- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} pirazole, 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} tiazole y
- 2- Q^b -5- Q^s -4- R^{17} tiazole,

542
50
544

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metil, etil, isopropil, propil, carboxe, amidino, guanidino, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxé, amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, triflurometiltio, metilsulfinil, etilsulfinil, metilsulfonyl, etilsulfonyl, triflurometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonyl, N-metilamidosulfonyl, N,N-dimetilamidosulfonyl, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil, y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo que consiste de $NR^{20} R^{21}$, Q^{be} , donde Q^{be} es hidrógeno, $C(NR^{25}) NR^{23} R^{24}$, y $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$, con la provisión de que no más de uno de R^{20} y R^{21} sea hidroxé al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} sea hidroxé al mismo tiempo, R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metil, etil, propil, butil, isopropil, e hidroxé,

Q^a es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente, CH_2 , y CH_2CH_2

19 El compuesto así citado en la Reinvención 18 o una sal farmacéuticamente aceptada aquí, donde,

B es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butil, (R)-2-butil, (S)-2-butil, tertbutil, isobutil, 1-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2,2,2-trifluoroetil, 6-amidocarbonilhexil, 4-metil-2-pentil, 3-hidroxipropil, 3-metoxe-2-propil, 2-metoxietil, 2-metil-2-butil, 3-metil-2-butil, 2-dimetilaminopropil, 2-cianoetil, 6-hidroxihexil, 2-hidroxietil, 2-amidonoetil, 2-guanidinoetil,

543
545

3-guanidinopropil, 4-guanidinobutil, 3-hidroxipropil, 4-hidroxibutil, 6-cianohexil, 2-dimetilaminoetil, 3-metilbutil, 2-metilbutil, (S)-2-metilbutil, 3-aminopropil, 2-hexil, y 4-aminobutil,

A es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente, CH_2 , NHC(O) , CH_2CH_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, y CH_3CHCH_2 ,

R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,-trifluoroetil, fluoruro, cloruro y bromo, R^2 es $\text{Z}^0\text{-Q}$,

Z^0 es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente y CH_2 ,

Q es seleccionado del grupo que consiste de 5-amino-3-amidocarbonilfenil, 5-amino-2-fluorofenil, 3-amino-5-hidroximetilfenil, 5-amino-3-metoxycarbonilfenil, 3-amidinofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, benzil, 3-carboxifenil, 3-carboxe-5-aminofenil, 3-carboxe-5-hidroxifenil, 3-carboxemetilfenil, 3-clorofenil, 2-clorofenil, 2,6-diclorofenil, 3-cianofenil, 3-dimetilaminofenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 2,5-difluorofenil, 2-hidroxifenil, 3-metoxifenil, 3-metoxiaminofenil, 3-metoxycarbonilfenil, 2-metilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-trifluorometilfenil, 2-trifluorometilfenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-3-tienil, 3-bromo-2-tienil, 3-piridil, 4-piridil, 2-tienil y 3-tienil,

Y^0 es seleccionado del grupo que consiste de

1- Q^b -4- Q^a -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} bencina,

2- Q^b -5- Q^a -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,

3- Q^b -6- Q^a -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina,

3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} tiofene, y 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} tiofene,

R^{16} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, amino, amonometil, metoxe, metilamino, hidroxide, hidroximetil, fluoruro, cloruro y ciano,

544
52
16

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión de que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

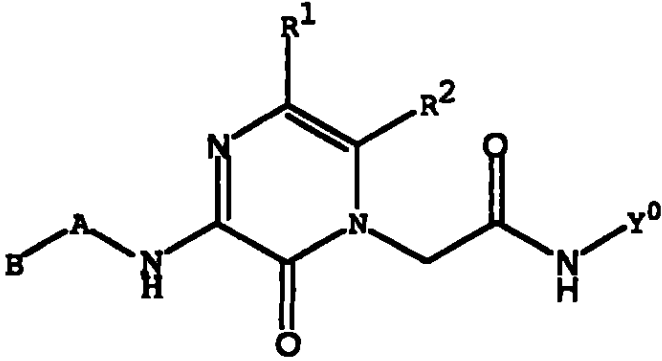
R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, fluoruro, cloruro, hidroxide, hidroximetil, amino, carboxe y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo que consiste de Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y metil,

Q^a es CH_2

20 El compuesto así como citado en la Reminvidicación 17 teniendo la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable aquí, donde

B es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, C2-C8 alkil, C3-C8 akenil, C3-C8 alquil, y C2-C8 haloalkil, donde cada miembro del grupo B es sustituido opcionalmente en cualquier carbono hasta e incluyendo 6 átomos desde el punto de enlace de B a A con uno o más del grupo que consiste de R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alkoxe, hidroxide, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, dialkil, amidosulfonil, alkil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroalkil, carboalkoxe, carboxe, caboxamido, ciano y Q^b ,

545
53
547

A es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente y $(CH(R^{15}))_m - (W^7)_n$ donde m es un integral seleccionado de 0 a través de 1, n es un integral seleccionado de 0 a través de 3, y

W^7 es $N(R^7)$,

R^7 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno y alquil,

R^{15} es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halo, alquil, y haloalquil,

R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, haloalquil y halo,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es un único enlace covalente,

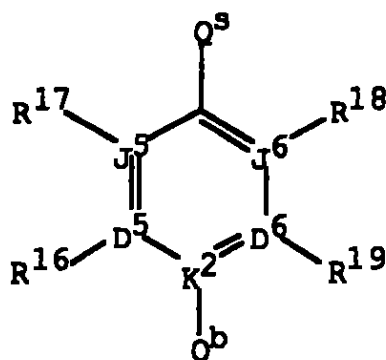
Q es seleccionado del grupo que consiste de aril y heteroaril donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono al punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, hidroxilo, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alquiltio, alcoxilo, alkilsulfonilo, alkilsulfonilo, amidosulfonilo, monoalkilaminosulfonilo, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxilo, hidroalquil, carboxilo, carboxamido y ciano,

R^{10} y R^{12} son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquil, alcoxilo, alkoxamino, aminoalquil, hidroxilo, amino, alquilamino, alkilsulfanamido, amidosulfonilo, monoalquil amidosulfonilo, dialquil amidosulfonilo, hidroalquil, aminoalquil, halo, haloalquil, carboalcoxilo, carboxilo, carboxamido, carboxialquil y ciano,

546
548

Y^0 es fórmula (IV)



(IV)

donde D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son seleccionados independientemente del grupo que consiste de C,N,O,S y un enlace covalente con la provisión de que no más de uno es un enlace covalente, K^2 es C, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 es O, no más de uno de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando do de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son O y S, y no mas de cuatro de D^5 , D^6 , J^5 y J^6 son N,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, haloalkitio, alkoxe, hidrox, amino, alquilamino, alkitio, alkilsulfinil, alkilsulfonyl, alkanoyl, haloalkanoyl, alquil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, aminolakil y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b sea Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo que consiste de $NR^{20}R^{21}$, Q^{be}

donde Q^{be} es hidrógeno, $N(R^{26})C(NR^{25})n(R^{23})(R^{24})$, y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y alquil,

Q^a es CH_2

21 El compuesto así citado en la Reivindicación 17 o una sal farmaceuticamente aceptable aquí, donde,

547
55
549

B es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butenil, 2-butinil, sec-butil, tert-util, isobutil, 2-metilpropenil, 1-pentil, 2-pentenil, 3-pentenil, 2-pentinil, 3-pentinil, 2-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2-metil-2-butenil, 3-metilbutil, 3-metil-2-butenil, 1-hexil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 2-hexil, 1-metil-2-pentenil, 1-metil-3-pentenil, 1-metil-2-pentinil, 1-metil-3-pentinil, 3-hexil, 1-etil-2-butenil, 1-heptil, 2-heptenil, 3-heptenil, 4-heptenil, 5-heptenil, 2-heptil, 1-metil-2-hexenil, 1-metil-3-hexenil, 1-metil-4-hexenil, 1-metil-2-hexenil, 1-metil-3-hexinil, 1-metil-4-hexinil, 3-heptil, 1-etil-2-pentenil, 1-etil-3-pentenil, 1-etil-2-pentinil, 1-etil-3-pentinil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2-difluoropropil, 4-trifluorometil, 5,5,5-trifluoropentil, 4-trifluorometilpentil, 5,5,6,6,6-pentafluorohexil, y 3,3,3-trifluoropropil, donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido en cualquier carbono hasta e incluyendo 5 átomos desde el punto de enlace de B a A con uno o más del grupo que consiste de R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, guanidino, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxе, amino, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo amidosulfonil, N-metilamidisulfonil, hidroxemetil, amidocarbonil, carboxe, ciano y Q^b ,

A es seleccionado del grupo que consiste de un solo enlace covalente, NH, N(CH₃), CH₂, CH₃CH, y CH₂CH₂,

A es seleccionado opcionalmente del grupo que consiste de CH₂N(CH₃), CH₂N(CH₂CH₃) CH₂CH₂N(CH₃) y CH₂CH₂N(CH₂CH₃) con la provisión que B es hidrógeno,

R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, trifluorometil, pentafluoroetil, fluoruro y cloruro,

548
56
330

R^2 es seleccionado del grupo que consiste de fenil, 2-tienil, 2-furil, 2-pirrolil, 2-imidazolil, 2-thiazolil, 3-isoxazolil, 2-piridil, y 3-piridil, donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metil, etil, metoxe, etoxe, hidrox, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, metiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, carboxe y ciano,

R^{10} y R^{12} son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, amidino, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, guanidino, metil, etil, metoxe, etoxe, hidrox, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, carboxe, carboximetil, amino, acetamido, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluoroacetamido, aminometil, N-metilamino, dimetilamino, amidosulfonil, N-metilamidosulfonil, N,N-dimetilamidosulfonil, metoxeicarbonil, fluoruro, cloruro, bromo y ciano, Y^0 es seleccionado del grupo que consiste de

1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} bencina, 2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina, 2- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tiofene, 3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina, 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{17} tiofene, 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} furan, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} furan, 3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} pirrole, 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} pirrole, 4- Q^b -2- Q^s -5- R^{19} tiazole, y 2- Q^b -5- Q^s -4- R^{17} tiazole,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metil, etil, amidino, guanidino, metoxe, hidrox,

549
57
551

amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio Trifluorometiltio, metilsulfinil, metilsulfonil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluorometoxe, fluoruro, cloruro, amidosulfonil, N- metilamidossulfonil, hidroximetil, carboxe y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$, $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, y $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$, con la provisión que dicho grupo Q^b está directamente ligado a un átomo de carbono,

$R^{20}, R^{21}, R^{23}, R^{24}, R^{25}$ y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil y etil,

Q^a es CH_2

22 Este compuesto como citado en la Reivindicación 21 o una sal farmacéuticamente aceptada, donde

B es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, etil 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butil, (R)-2-butil, (S) 2-butil, tertbutil, isobutil, 1-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2,2,2-trifluoroetil, 6-amidocarbonilhexil, 4-metil-2-pentil, -3hidroxipropil, 3-metoxe-2-propil, 2-metoxietil, 2-metil-2-butil, 3-metil-2-butil, 2-dimetilaminopropil, 2-cianoetil, 6-hidroxihexil, 2-hidroxihexil, 2-amidonoetil, 2-guanidinoetil, 3-guanidinopropil, 4-guadinobutil, 3-hidroxipropil, 4-hidroxibutil, 6-cianohexil, 2-dimetilamioetil, 3-metilbutil, 2-metilbutil, (S) -2-metilbutil, 3-aminopropil, 2-hexil, y 4-aminobutil,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , CH_3CH y CH_2CH_2 ,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, trifluorometil, fluoruro y cloruro,

R^2 es seleccionado del grupo consistente de 5-amino-3-amidocarbonilfenil, 5-amino-2-fluorofenil, 3-amino-5-hidroximetilfenil,

55
58
552

5-amino-3-metoxycarbonolfenil, 3-amidinofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, bencil, 3-carboxifenil, 3-carboxe-5-aminofenil, 3-carboxe-5-hidroxifenil, 3-carboximetil-5-aminofenil, 3-carboximetil, -5-hidroxifenil, 3-carboximetilfenil, 3-clorofenil, 2-clorofenil, 2,6-diclorofenil, 3-cianofenil, 3-dimetilaminofenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 2,5-difluorofenil, 2-hidroxifenil, 3-hidroxifenil, 3-metanosulfonilaminofenil, 2-metoxifenil, 3-metoxifenil, 3-metoxiaminofenil, 3-metoxycarbonolfenil, 2-metilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-trifluorometilfenil, 2-trifluorometilfenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-3-tienil, 3-bromo-2-tienil, 3-piridil, 4-piridil, 2-tienil y 3-tienil,

Y^0 es seleccionado del grupo consistente de

1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benceno,

2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridino,

3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridino,

3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} , tofeno, y 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tofeno,

R^{16} y R^{17} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amino, aminometil metoxe, metilamino, hidroxide, hidroximetil, fluoruro, cloruro y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo que Q^b es Q^{bs} ,

R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, fluoruro, cloruro, hidroxide, hidroximetil, amino, carboxe, y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de Q^{bs} donde Q^{bs} es hidrógeno y $C(NR^{23})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrogeno y metil,

Q^s es CH_2

551
59
553

23 Este compuesto como citado en la Reivindicación 22 o una sal farmacéuticamente aceptable aquí, donde,

B es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butil, (R)-2-butil, (S)-2-butil, tert-butil, isobutil, 1-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2,2,2-trifluoroetil, 6-amidocarbonilhexil, 4-metil-2-pentil, 3-hidroxipropil, 3-metoxe-2-propil, 2-metoxietil, 2-metil-2-butil, 3-metil-2-butil, 2-dimetilaminopropil, 2-cianoetil, 6-hidroxihexil, 2-hidroxietil, 2-aminodinoetil, 2-guanidinoetil, 3-guanidinopropil, 4-guanidinobutil, 3-hidroxipropil, 4-hidroxibutil, 6-cianohexil, 2-dimetilaminoetil, 3-metilbutil, 2-metilbutil, (S)-2-metilbutil, 3-aminopropil, 2-hexil, y 4-aminobutil,

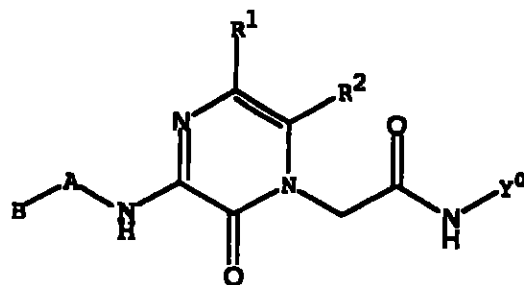
A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , CH_2CH , y CH_2CH_2 ,

R_1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno y cloruro,

R_2 es seleccionado del grupo consistente de 5-amino-2-fluorofenil, 3-anubo-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, 3-carboxifenil, 3-cianofenil, 3-metoxycarbonilfenil, fenil, y 3 piridil,

Y^0 es seleccionado del grupo consistente de 5-amidino-2-tienilmetil, 4-amidinobencil, 2-fluoruro-4-amidinobencil, y 3-fluoruro-4-amidinobencil

24 Un compuesto como citado en la Reivindicación 17 donde dicho compuesto es seleccionado del grupo con la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable, donde

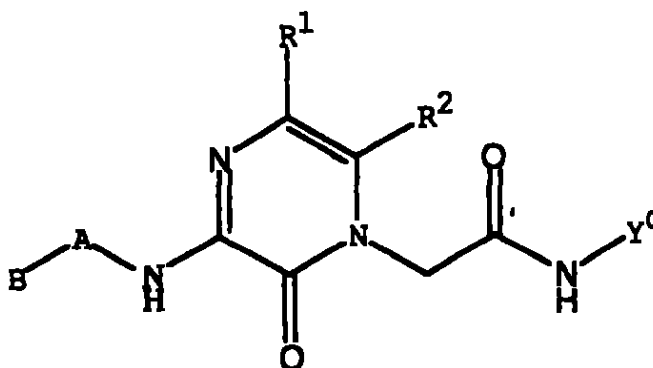
552
60
554

R^2 es 3-aminofenil, B es 2,2,2-trifluoroetil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es (S) -2-butyl, a es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 5-amino-2-fluorofenil, B es isopropil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 2-metil-3-aminofenil, B es isopropil, A es enlace unico, Y^+ es 4-amidinobencil, y R^+ es cloruro, R^+ es 3-aminofenil, B es etil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propenil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es isopropil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es isopropil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-butyl, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es (R)-2-butyl, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propinil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es -3-pentil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es hidrógeno, R^2 es 3-aminofenil, B es hidrógeno, A es CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es etil, A es CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-metilpropil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propil, a es CH_3CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es propil, a es enlace unico Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 6-amidocarbonilhexil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es tert-butyl, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobenzil, y R^1 es hidrógeno, R^2 es 3-aminofenil, B es tert-butyl, a es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobenzil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 3-hidroxipropil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-metilpropil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-2-

553
61
553

fluorobenzil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es butil, a es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 3-metoxe-2-propil, a es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 3-metoxe-2-propil, a es enlace unico, Y^0 es 4-amidnobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-metoxe-2-etil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propil, A es enlace unico, Y^0 es 5-amidino-2-tienilmetil, y R^1 es cloruro, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propil, a es enlace único, Y^0 es 4-amidino-3-fluorobencil, y R^1 es hidrógeno, R^2 es 3-carboxifenil, B es 2-propil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es hidrógeno, R^2 es 3-aminofenil, B es 2-propil, a es enlace único, Y^0 es 4-amidino-3-fluorobencil, y R^1 es cloruro

25 El compuesto como citado en la Reivindicación 2 con esta fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptada allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de C3-C7 cicloalkil, y C4-C6 heterocicil, donde cada anillo e carbono es opcionalmente sustituido con R^{33} , un anillo de carbono diferente al anillo de carbono en el punto de enlace de B a A es opcionalmente sustituible con oxo provisto que no más de uno anillo de carbono sea sustituido por oxo al mismo tiempo, anillos de carbono y u nitrógeno adyacente al átomo de carbono en le punto de contacto son opcionalmente sustituido con R^9 o R^{13} , un anillo de carbono o nitrógeno adyacente a la posición R^9 y dos átomos del lugar de enlace es opcionalmente sustituible con R^{10} , un anillo de carbono o

354
356

nitrógeno adyacente a la posición R^{13} y dos átomos desde el punto de enlace es opcionalmente sustituido con R^{12} , un anillo de carbono o nitrógeno tres átomos desde el punto de enlace y adyacente a la posición R^{10} es opcionalmente sustituida con R^{11} , un anillo de carbono o nitrógeno tres átomos desde el punto de enlace y adyacente a la posición R^{12} es opcionalmente sustituido con R^{33} , y un anillo de carbono o nitrógeno de cuatro átomos desde el punto de enlace y adyacente a las posiciones R^{11} y R^{33} es opcionalmente sustituido con R^{34} ,

R^9, R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, hidroxilo, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alquiltio, alquilsulfonamido, alquilsulfinil, alquilsulfonil, amidosulfinil, monoalquil amidosulfonil, alquil, alcoxilo, halo, haloalquil, haloalcoxilo, hidroxialquil, carboxilo y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquil, alcoxilo, hidroxilo, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquilsulfonamido, amidosulfonil, monoalquil, amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, hidroxialquil, aminoalquil, carboalcoxilo, carboxilo, carboxialquil, amidoarbonil, halo, haloalquil y ciano,

R^{33} y R^{34} son seleccionadas independientemente del grupo consistente de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alcoxilo, hidroxilo, amino, alcoxiamino, alquilamino, alquiltio, amidosulfonil, monoalquil amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, alquil, halo, haloalquil, haloalcoxilo, hidroxialquil, carboalcoxilo, carboxilo, carboxamido, ciano, y Q^b ,

A es seleccionada del grupo consistente de un solo enlace covalente y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_r$ donde r es un entero seleccionado de 0 a través de 1, pa es un entero seleccionado desde 0 a través de 3, y W^7 es seleccionado desde el grupo consistente de $(R^7)NC(O)$ y $N(R^7)$,

553
557

R^7 es seleccionado desde el grupo consistente de hidrogeno, hidrox e y alkil,

R^{15} es seleccionado desde el grupo consistente de hidrógeno, halo, alkil, y haloalkil,

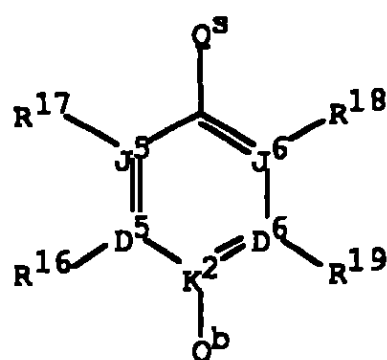
R^1 es seleccionado desde el grupo consistente de hidrógeno, alkil, ciano, haloalkil y halo,

R^2 es Z^0 -Q,

Z^0 es seleccionado desde el grupo consistente de un enlace único covalente y CH_2 ,

Q es seleccionado del grupo consistente de aril y heteroaril donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

Y^0 es fórmula (IV)



(IV)

donde D^5, D^6, J^5 y J^6 son independientemente seleccionados del grupo consistente de C,N,O,S y un enlace covalente co las provisiones de que no más de uno es un enlace covalente, K^2 es C, no más que uno de D^5, D^6, J^5 , y J^6 es O, no más de uno de D^5, D^6, J^5 y J^6 es S, uno de D^5, D^6, J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5, D^6, J^5 y J^6 son O y S, y no más de cuatro de D^5, D^6, J^5 y J^6 son N,

R^{16}, R^{17}, R^{18} , y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, haloalkiltio,

536
538

alkoxe, hidrox, amino, alquilamino, alquiltio, alquilsufinil, alquilsulfonil, alkanoil, haloalkanoil, alquil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroalkil, aminoalkil, y ciano,

R^{16} y R^{19} es opcionalmente Q^b con la provisión de que no más de uno de R^{16} y R^{19} sea Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{ba} ,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$, Q^{ba} donde Q^{ba} es hidrógeno, y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, con las provisiones de que no más de uno de R^{20} y R^{21} es hidrox al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} es hidrox al mismo tiempo,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, alquil e hidrox,

Q^a es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , y CH_2CH_2

26 El compuesto como citado en la Reivindicación 25 o la sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, tetran-3-il, ciclopentil, ciclohexil, norbornil, 7-oxabíciclo [2 2 1] heptan-2-il, bíciclo [3 1 0] hexan-6-il, cicloheptil, 2-morfolinil, 3-morfolinil, 4-morfolinil, 1-piperazinil, 2-piperazinil, 1-piperidinil, 2-piperidinil, 3-piperidinil, 4-piperidinil, 1-pirrolidinil, 2-pirrolidinil, 3-pirrolidinil, 2-dioxanil, 4H-2-piranil, 4H-3-piranil, 4H-4-piranil, 4H-piran-4-uno-2-il, tetrahidropiranil, 3-tetrahidropiranil, 4-tetrahidropiranil, 2-tetrahidroitenil, y 3-tetrahidrotienil, donde cada anillo de carbono es opcionalmente sustituido con R^{33} , anillos de carbono y un adyacente de nitrógeno al átomo de carbono en el punto de enlace son opcionalmente sustituidos con R^9 o R^{13} , un anillo adyacente de carbono nitrógeno a la posición de R^9 y dos átomos del punto de enlace es opcionalmente sustituido con R^{10} , y un

357
65 -
359

anillo adyacente de carbono o nitrógeno a la posición R^{13} y dos átomos desde el punto de enlace es opcionalmente sustituido con R^{12} ,

R^9 , R^{11} , y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, metil, etil, propil, isopropil, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxé, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo, metanesulfonamida, amidosulfonil, N-metilaminodosulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, carboximetil, metil, etil, propil, isopropil, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxé, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metanesulfonamida, amidosulfonil, N-metalamidosulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil, metoxicarbonil, etoxicarbonil, amidocarbono, N-metalamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, fluoruro, cloruro, bromo y ciano,

R^{33} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, metoxe, etoxe, isopropoxe, propoxe, hidroxé, amino, metoxiamino, etoxiamino, acetamido, trifluoroacetamido, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metalamidosulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil,

358
66
A
560

metoxycarbonil, etoxycarbonil, amidocarbonil, N-metalamidocarbonil, N,N-dimetilamidocarbonil, ciano y Qb,

A es seleccionado del grupo consistente de un enlace unico covalente, NH, N(CH₃), N(OH), CH₂, CH₃CH, CF₃CH, NHC(O), N(CH₃)C(O), C(O)NH, C(O)N(CH₃), CH₂CH₂CH₂CH₂CH=, CH₃CHCH₂, y CF₃CHCH₂,

R¹ es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoruroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, fluoruro, cloruro y bromo,

R² es Z⁰-Q,

Z⁰ es seleccionado del grupo consistente de un enlace unico covalente y CH₂,

Q es seleccionado del grupo consistente de fenil, 2-tienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 5-isoxazolil, 2-piridil, 3-piridil, 4-piridil, 2-pirazinil, 2-pirimidinil, 4-pirimidinil, 5-pirimidinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil, y 1,3,5-triazin-2-il, donde un adyacente de carbono al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R⁹, el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹³, un carbono adyacente a R⁹ y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹⁰, un carbono adyacente a R¹³ y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R¹², y cualquier carbono adyacente a ambos R¹⁰ y R¹² es opcionalmente sustituido por R¹¹,

Y⁰ es seleccionado del grupo consistente de

1-Q^b-4-Q^a-2-R¹⁶-3-R¹⁷-5-R¹⁸-6-R¹⁹ bencina,

2-Q^b-5-Q^a-6-R¹⁷-4-R¹⁸-2-R¹⁹ piridina,

3-Q^b-6-Q^a-2-R¹⁶-5-R¹⁸-4-R¹⁹ piridina, 2-Q^b-4-Q^a

-3-R¹⁶-6-R¹⁸ pirazina, 3-Q^b-6-Q^a-2-R¹⁸-5-R¹⁸

-4-R¹⁹ piridazina,

551
561

2-Q^b-5-Q^s-6-R¹⁷-4-R¹⁸ pirimidina, 5-Q^b-2-Q^s-3-R¹⁶-6-R¹⁹ pirimidina,
3-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁶-2-R¹⁹ tiofene, 2-Q^b-5-Q^s-3-R¹⁶-4-R¹⁷ tiofene
3-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁶-2-R¹⁹ furan, 2-Q^b-5-Q^s-3-R¹⁶-4-R¹⁷ furan,
3-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁶-2-R¹⁹ pirrole, 2-Q^b-5-Q^s-3-R¹⁶-4-R¹⁷ pirrole,
4-Q^b-2-Q^s-5-R¹⁹ imidazole, 2-Q^b-4-Q^s-5-R¹⁷ imidazole,
3-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁶ isoxazole, 5-Q^b-3-Q^s-4-R¹⁶ isoxazole,
2-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁶ pirazole, 4-Q^b-2-Q^s-5-R¹⁹ tiazole, y
2-Q^b-5-Q^s-4-R¹⁷ tiazole,

R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, isopropil, propil, carboxe, amidino, guanidino, metoxe, etoxe isopropoxe, propoxe, hidroxide, amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, N-etilamino, metiltio, etiltio, isopropiltio, trifluorometiltio, metilsulfinil, etilsulfinil, metilsulfonyl, etilsulfonyl, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2,3,3,3-pentafluoropropil, trifluorometoxe, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxe, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonyl, N-metilamidosulfonyl, N,N-dimetilamidosulfonyl, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, 2,2,2-trifluoruro-1-hidroxietil y ciano,

R¹⁶ y R¹⁹ son opcionalmente Q^b con la provisión de que no más de uno de R¹⁶ y R¹⁹ es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be},

Q^b es seleccionada del grupo consistente de Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno y C(NR²⁵) NR²³ R²⁴, con la provisión de que no más de uno de R²³ y R²⁴ es hidroxide al mismo tiempo,

R²³, R²⁴ y R²⁵ son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, e hidroxide,

562
58

Q^1 es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 y CH_2CH_2

27 El compuesto como citado en la Rivindicación 26 o una sal farmacéuticamente aceptada allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, cicloheptil, oxalan-2-il, 2-(RC)-bíciclo [2 2 1] -heptil, 1-pirrolidinil, 1-piperidinil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan -3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, 7-oxabíciclo [2 2 1]heptan-2-il, bíciclo [3 1]hexan-6-il, 2 morfolinil, 3-morfolinil, 4-morfolinil, 1-piperazinil, 2-piperazinil, 1-piperidinil, 2-piperidinil, 3-piperidinil, 4-piperidinil, 1-pirrolidinil, 2-pirrolidinil, 3-pirrolidinil, 2-dioxanil, 4H-2-piranil, 4H-3-piranil, 4H-4-piranil, 4H-piran-4-uno-2-il, 4H-piran-4-uno-3-il, 2-tetrahidrofuranil, 3-tetrahidrofuranil, 2-tetrahidrofuranil, 3-tetrahidropiranil, 4-tetrahidropiranil, 2-tetrahidrotienil y 3-tetrahidrotienil,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , $NHC(O)$, CH_2CH_2 , y $CH_2CH_2CH_2$,

R_1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluorometil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro y bromo,

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente y CH_2 ,

Q es seleccionado del grupo consistente de 5-amino-3-amidocarbonilfenil, 5-amino-2-fluorofenil, 3-amino-5-hidroximetilfenil, 5-amino-3-metoxycarbonilfenil, 3-amidinofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, benzil, 3-carboxifenil, 3-carboxe-5-aminofenil, 3-aminofenil, hidroxifenil, 3-carboximetil-5-aminofenil, 3-carboximetil-5-hidroxifenil, 3-carboximetilfenil, 3'-clorofenil, 2-

501/563

clorofenil, 2,6-diclorofenil, 3-cianofenil, 3-dimetilaminofenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 2,5-difluorofenil, 2-hidroxifenil, 3-hidroxifenil, 3-metanesulfonilaminofenil, 2-metoxifenil, 3-metoxifenil, 3-metoxiaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-trifluorometilfenil, 2-trifluorometilfenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-3-tienil, 3-romo-2-tienil, 3-piridil, 4-piridil, 2-tienil y 3-tienil,

Y^0 es seleccionado del grupo consistente de

1- Q^b -4- Q^s -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benzeno,
2- Q^b -5- Q^s -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridina,
3- Q^b -6- Q^s -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridina,
3- Q^b -5- Q^s -4- R^{16} -2- R^{19} tiofeno, y 2- Q^b -5- Q^s -3- R^{16} -4- R^{17} tiofeno,

R^{16} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amino, aminometil, metoxe, metilamino, hidroxide, hidroximetil, fluoruro, cloruro y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provision de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

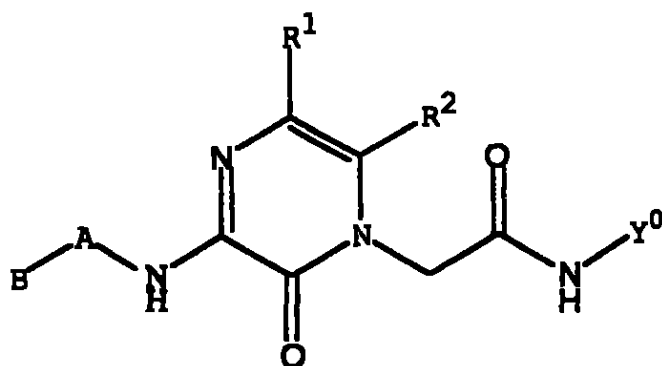
R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, fluoruro, cloruro, hidroxide, hidroximetil, amino, caroxe, y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y metil,

Q^s es CH_2

28 El compuesto como citado en la Reivindicación 25 con esta fórmula



70
56A

562

o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde,

B es seleccionado del grupo consistente de C3-C7 cicloalkil y C4-C6 heterocicli saturado, donde cada anillo e carbono es opcionalmente sustituido con R^{33} , un anillo de carbono diferente del anillo e carbono en el punto de enlace de B a A es opcionalmente sustituido con oxo provisto que no más de un anillo de carbono es sustituido por oxo al mismo tiempo, anillos adyacentes de carbono o nitrógeno al átomo de carbono en el punto de enlace son opcionalmente sustituidos con R^9 o R^{13} , un anillo anillo de carbono o nitrógeno adyacente a la posición R^9 y dos átomos desde el punto de enlace es opcionalmente sustituido con R^{10} , un anillo de carbono o nitrógeno adyacente a la posición del R^{13} y dos átomos desde el punto de enlace es opcionalmente sustituido con R^{12} , un anillo de carbono o nitrógeno tres átomos desde el punto de enlace y adyacente a la posición de R^{10} es opcionalmente sustituido con R^{11} , un anillo de carbono o nitrógeno tres átomos desde el punto de enlace y adyacente a la posición de R^{12} es opcionalmente sustituido con R^{33} Y un anillo de carbono o nitrógeno cuatro átomos desde el punto de enlace y adyacente a las posiciones de R^{11} y R^{13} es opcionalmente sustituido con R^{34} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, hidrox, amino, amidino, guanadino, alquilamino, alquiltio, alkoxe, alkilsulfinil, alkilsulfonil, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, alkil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, carboxe, carboxamido, y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, acetamido, halacetamido, amidino, guanidino, alkil, alkoxe, aloxi-amino, aminoalkil, hidrox, amino, alquilamino, alkilsulfonamido, amidosulfonil, monoalkil amidosulfonil, dialkil amidosulfonil,

563 71 563

hidroxialkyl, aminoalkyl, halo, haloalkyl, carboalkyl, carboxe, carboxialkyl, carboxiamido y ciano,

R^{33} y R^{34} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, alcoxide, hidroxide, amino, alcoxiamino, alquilamino, alkiltio, amidosulfonil, monoalkyl, amidosulfonil, dialkyl amidosulfonil, alkyl, halo, haloalkyl, haloalkoxide, hidroxialkyl, carboalkoxide, carboxe, carboxamido y ciano,

R^{33} es opcionalmente Q^b ,

A es seleccionado del grupo consistente de un enlace unico covalente y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_{rr}$ donde rr es un integral seleccionado del 0 através de 1, pa es un integral seleccionado de 0 através de 3, y W^7 es $N(R^7)$,

R^7 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno y alkyl,

R^{15} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, halo, alkyl, y haloalkyl,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, ciano, haloalkyl y halo

R^2 es Z^0-Q ,

Z^0 es un enlace unico covalente,

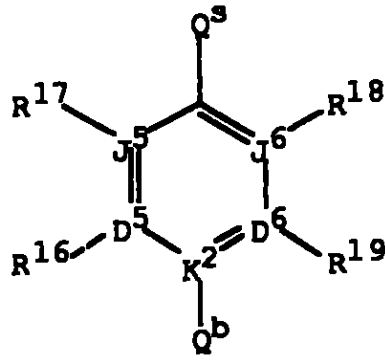
Q es seleccionado del grupo consistente de aril y heteroaril donde un carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de enlace es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, hidroxide, amino, amidino, guanidino, alquilamino, alkiltio, alcoxide, alkylsulfonil, alkylsulfonil, amidosulfonil,

monoalkilamidossulfonil, alkil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, carboxe, carboxamido y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrogeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alkil, alkoxe, alkoxiamino, aminoalkil, hidroxe, amino, alkilamino, alkilsulfonamido, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, hidroxialkil, aminoalkil, halo, haloalkil, carboalkoxe, carboxe, carboxiamido, carboxialkil, y ciano,

Y^0 es fórmula (IV)



donde D^5, D^6, J^5 y J^6 son seleccionados independientemente del grupo consistente de C, N, O, S y un enlace covalente con las provisiones de que no más de uno es un enlace covalente, K^2 es C, no más que uno de D^5, D^6, J^5 y J^6 es O, no más de uno de D^5, D^6, J^5 y J^6 es S, uno de D^5, D^6, J^5 y J^6 debe ser un enlace covalente cuando dos de D^5, D^6, J^5 y J^6 son O y S, y no más que cuatro de D^5, D^6, J^5 y J^6 son N,

R^{16}, R^{17}, R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidno, guanidino, carboxe, haloalkiltio, alkoxe, hidroxe, amino, alkilamino, alkiltio, alkilsulfinil, alkilsulfonil, alkanoil, haloalkanoil, alkil, halo, haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, aminoalkil y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión de que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$, Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno, y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

$R^{20}, R^{21}, R^{23}, R^{24}$ y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno y alkil,

48 78 2 067

Q^a es CH₂

29 El compuesto como citado en la Reivindicación 28 o la sal farmacéuticamente aceptada allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, cicloheptil, oxalan-2-il, 2-(2R)-bíciclo[2.2.1]-heptil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, bíciclo[3.1.0]hexan-6-il, 2-morfolinil, 3-morfolinil, 4-morfolinil, 1-piperazinil, 2-piperazinil, 1-piperidinil, 2-piperidinil, 3-piperidinil, 4-piperidinil, 1-pirrolidinil, 2-pirrolidinil, 3-pirrolidinil, 2-dioxanil, 2-tetrahidrofuranil, 3-tetrahidrofuranil, 2-tetrahidropirranil, 3-tetrahidropirranil, 4-tetrahidropirranil, 2-tetrahidrotienil, y 3-tetrahidrotienil, donde cada anillo de carbono es sustituido opcionalmente con R³³, los anillos de carbono y un adyacente de nitrógeno al átomo del carbono en el punto de unión son opcionalmente sustituidos con R⁹ y R¹³, un anillo de carbono o adyacente de nitrógeno a la posición de R⁹ y dos átomos desde el punto de unión son opcionalmente sustituidos con R¹⁰, y un anillo de carbono o átomo adyacente de nitrógeno a la posición R¹³ y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R¹²,

R⁹, R¹¹ y R¹³ son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxie, amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, metiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metilaminosulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metalamidocarbonil, carboxe y ciano,

R¹⁰ y R¹² son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amidocarbonil, N-metilamidocarbonil, guanidino, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxie, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, carboxe, carboximetil, amino, acetamino,

566 74 568

trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluoroacetamido, aminometil, N-metilamino, dimetilamino, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, N,N-dimetilamidossulfonil, metoxycarbonil, fluoruro, cloruro, bromo y ciano,

R^{33} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxide, carboxe, amino, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, hidroximetil, amidocarbonil, ciano y Q^b ,

A es seleccionado del grupo consistente de un enlace único covalente, NH , $N(CH_3)$, CH_2 , CH_2CH_2 , y $CH_2CH_2CH_2$,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, trifluorometil, pentafluoroetil, fluoruro y cloruro,

R^2 es seleccionado del grupo consistente de fenil, 2-tienil, 2-furil, 2-pirrolil, 2-imidazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 2-piridil, y 3-piridil, donde el carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

Y^0 es seleccionado del grupo consistente de

1- Q^b -4- Q^a -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benzeno,

2- Q^b -5- Q^a -6- R^{17} -4- R^{18} -2- R^{19} piridino, 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} tiofeno,

3- Q^b -6- Q^a -2- R^{16} -5- R^{18} -4- R^{19} piridino, 3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} tiofeno,

567
76
569

3-Q^b -3-Q^s -4-R¹⁶ -2-R¹⁹ furan, 2-Q^b -5-Q^s -3-R¹⁶ -4-R¹⁷
furan,

3-Q^b -5-Q^s -4-R¹⁶ -2-R¹⁹ pirrole, 2-Q^b -5-Q^s -3-R¹⁶ -4-R¹⁷
pirrole,

4-Q^b -2-Q^s -5-R¹⁹ tiazole, 2-Q^b -5-Q^s -4-R¹⁷ tiazole,

R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrogeno, metil, etil, amidino, guanidino, metoxe, hidroxе, amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metalamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilsufinil, metilsulfonyl, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluorometoxe, fluoruro, cloruro, amidosulfonyl, N-metilamidosulfonyl, hidroxemetil, carboxe y ciano

Q^b es seleccionado del grupo consistente de NR²⁰R²¹ y C(NR²⁵)NR²³R²⁴, con la provisión de que dicho grupo Q^b sea unido directamente al átomo de carbono,

R²⁰, R²¹, R²³, R²⁴ y R²⁵ son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil y etil,

Q^s es CH₂

30 El compuesto citado de la Reivindicación 29 o la sal farmacéuticamente aceptada allí, donde,

B es seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, oxalan -2-il, 2- (2R)-bíciclo [2 2 1]-heptil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-3-il, 1-pirrolidinil y 1-piperidinil,

A es seleccionado del grupo consistente de un enlace unico covalente, CH₂, NHC(O), CH₂CH₂ y CH₂CH₂CH₂,

R₁ es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, trifluorometil, fluoruro y cloruro,

560
75
570

R_2 es seleccionado del grupo consistente de 3-aminofenil, 2,6-diclorofenil, 2-hidroxifenil, 5-amino-2-tienil y 3-tienil,

Y_0 es seleccionado del grupo consistente de

1- Q^b -4- Q^a -2- R^{16} -3- R^{17} -5- R^{18} -6- R^{19} benzeno,

3- Q^b -5- Q^a -4- R^{16} -2- R^{19} tofeno, y 2- Q^b -5- Q^a -3- R^{16} -4- R^{17} tofeno,

R^{16} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amino, aminometil, metoxe, metilamino, hidroxide, hidroximetil, fluoruro, cloruro y ciano,

R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión de que no mas de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, fluoruro, cloruro, hidroxide, hidroximetil, amino, carboxe, y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno y metil,

Q^a es CH_2

31 El compuesto citado en la Reivindicación 30 o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, oxalan-2-il, 2-(2R)-biciclo[2.2.1]-heptil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il y 1-piperidinil,

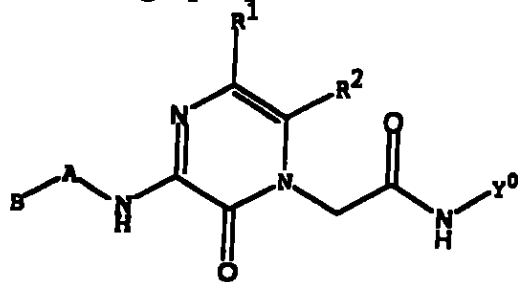
A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , CH_2CH_2 y $CH_2CH_2CH_2$,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno y cloruro,

569
77
571

R^2 es seleccionado del grupo consistente de 3-aminofenil, 2,5-diclorofenil, 2-hidroxifenil, fenil, 5-amino-2-tienil, y 3-tienil,
 Y^0 es seleccionado del grupo consistente de 5-amidino-2-tienilmetil, 4-amidinobencil, 2-fluoro-4-amidinobencil, y 3-fluoro-4-amidinobencil

32 Un compuesto como el citado en la Reivindicación 25 donde dicho compuesto es seleccionado del grupo que tiene la Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

R^2 es 3-aminofenil, B es ciclopropil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclobutil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclobutil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclopropil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclobutil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es hidrógeno,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclobutil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidino-3-fluorobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclopentil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 5-amino-2-tienil, B es ciclobutil, A es enlace unico, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,
 R^2 es 3-aminofenil, B es ciclopropil, A es CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

570
572

R^2 es 3-aminofenil, B es 2-(2R) bíciclo [2 2 1]-heptil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 3-aminofenil, B es ciclopentil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidino-2-fluorobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 3-aminofenil, B es ciclohexil, A es CH_2CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es hidrógeno,

R^2 es 3-aminofenil, B es oxalan-2-il, A es CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es fenil, B es 1-pirrolidinil, A es CH_2CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 3-aminofenil, B es 1-piperidinil, A es CH_2CH_2 , Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 3-aminofenil, B es 1,1-dioxotolan-3-il, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 2-hidroxifenil, B es ciclobutil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

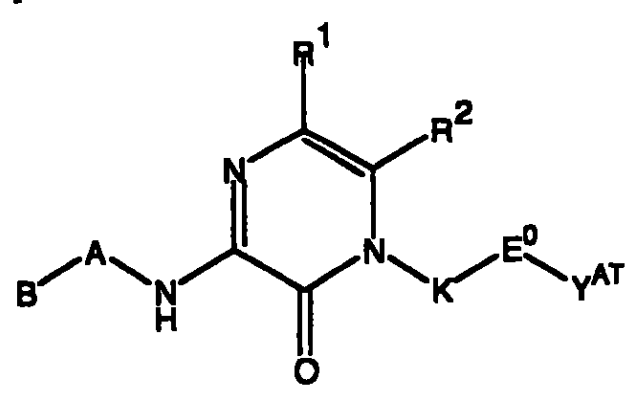
R^2 es 3-aminofenil, B es 1-pirrolidinil, A es $CH_2CH_2CH_2$, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es fenil, B es ciclobutil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

R^2 es 3-tienil, B es ciclobutil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil y R^1 es hidrógeno,

R^2 es 2,6-ciclorofenil, B es ciclobutil, A es enlace único, Y^0 es 4-amidinobencil, y R^1 es cloruro,

33 El compuesto con la Fórmula



571
73
573

o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de aril y heteroaril donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{33} , un carbono adyacente a R^{36} y dos átomos desde el carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{35} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{33} y R^{35} es sustituido por R^{34} , $R^{32}, R^{33}, R^{34}, R^{35}$ y R^{36} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, amidino, guanidino, alquenedioxe, haloalquiltio, alcanoiloxe, alkoxe, hidrox, amino, alcoxiamino, haloalkanoil, nitro, alquilamino, alquiltio, aril, aralkil, cicloalkil, cicloalkilalkil, heteriaril, heterocicil, alquilsulfonamido, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, alkil, alkenil, halo, haloalkil, haloalkenil, haloalkoxe, hidroalkil, alquilamino, carboalkoxe, carboxe, carboxamido, ciano y Q^b ,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, trialkilsilil, C2-C8 alkil, C3-C8 alquilenil, C3-C8 alkenil, C3-C8 alquil, y C2-C8 haloalkil, donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido por cualquier carbono hasta e incluyendo 6 átomos desde el punto de unión de B a A con uno o más del grupo consistente de $R^{32}, R^{33}, R^{34}, R^{35}$ y R^{36}

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de C3-C12 cicloalkil y C4-C9 heterocicil saturado, donde cada anillo de carbono es opcionalmente sustituido con R^{33} , un anillo de carbono diferente al anillo de carbono en el punto de unión de B a A es opcionalmente sustituido con oxo provisto que no más de un anillo de carbono es sustituido por oxo al mismo tiempo, el anillo de carbono y el adyacente de nitrógeno al

572
80
074

átomo de carbono en el punto de unión son opcionalmente sustituidos con R^9 y R^{13} , un anillo de carbono o adyacente de nitrógeno a la posición de R^9 y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{10} , un anillo de carbono o adyacente de nitrógeno a la posición R^{13} y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{12} , un anillo de carbono o tres átomos de nitrógeno desde el punto de unión y adyacente a la posición de R^{10} es opcionalmente sustituido con R^{11} , un anillo de carbono o tres átomos de nitrógeno desde el punto de unión y adyacente a la posición de R^{12} es opcionalmente sustituido con R^{33} , y un anillo de carbono o cuatro átomos de nitrógeno desde el punto de unión y adyacente a las posiciones de R^{11} y R^{13} es opcionalmente sustituido con R^{34} ,

R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, acetamido, haloacetamido, alcoxiamino, alkanoil, haloalkanoil, amidino, guanidino, alquilenedioxe, haloalkiltio, alkoxe, hidrox, amino, alquilamino, alkiltio, alkilsufinil, alkilsulfamido, alkilsulfonil, amidosulfonil, monoalkil, amidosulfonil, dialkil amidosulfonil, alkil, halo haloalkil, haloalkoxe, hidroxialkil, aminoalkil, carboalkoxe, carboxe, carboxialkil, carboxamido y ciano,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace y $(CH(R^{15}))_{pa}-(W^7)_{rr}$ donde rr es un integral seleccionado de 0 a través de 1, pa es un integral seleccionado de 0 a través de 3, y W^7 es seleccionado del grupo consistente de O, S, C(O), $(R^7)NC(O)$, $(R^7)NC(S)$ y $N(R^7)$,

R^7 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, hidrox y alkil,

R^{15} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, hidrox, halo, alkil y haloalkil,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, alkil, ciano, halo, haloalkil, haloalkoxe, amino, aminoalkil, alquilamino, amidino, hidrox, hidroxiamino, alkoxe, hidroxialkil, alcoxiamino, tiol y alkiltio,

R^2 es Z^0-Q ,

573
81
575
46

Z^0 es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace y $(CR^{41} R^{42})_q$ donde q es un integral seleccionado de 1 a través de 2, $(CH(R^{41}))_g - W^0 - (CH(R^{42}))_p$ donde g y p son integrales independientemente seleccionados de 0 a través de 3 y W^0 es seleccionado del grupo consistente de O, S y N(R^{41}), y $(CH(R^{41}))_e - W^{22} - (CH(R^{42}))_h$ donde e y h son integrales independientemente seleccionados de 0 a través de 1 y W^{22} es seleccionado del grupo consistente de $CR^R = CR^{42}$, 1,2-ciclopropil, 1,2-ciclobutil, 1,2-ciclohexil, 1,3-ciclohexil, 1,2-ciclopentil, 1,3-ciclopentil, 2,3-morfolinil, 2,4-morfolinil, 2,6-morfolinil, 3,4-morfolinil, 3,5-morfolinil, 1,2-piperazinil, 1,3-piperazinil, 2,3-piperazinil, 2,6-piperazinil, 1,2-piperidinil, 1,3-piperidinil, 2,3-piperidinil, 2,4-piperidinil, 2,6-piperidinil, 3,4-piperidinil, 1,2-pirrolidinil, 1,3-pirrolidinil, 2,3-pirrolidinil, 2,4-pirrolidinil, 2,5-pirrolidinil, 3,4-pirrolidinil, 2,3-tetrahidrofuránil, 2,4-tetrahidrofuránil, 2,5-tetrahidrofuránil, y 3,4-tetrahidrofuránil, con la provisión que Z^0 está directamente unido al anillo pirazinone,

R^{41} y R^{42} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, hidroxilo y amino,

Q es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno con la provisión que Z^0 es diferente al enlace único covalente, aril y heteroaril, donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

K es CHR^{4a} donde R^{4a} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, hidroxiálkil, álkil, alcoxialkil, alquiltioálkil, y haloálkil,

574
82
576

E^0 es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, $C(O)N(H)$, $(H)NC(O)$, $(R^7)NS(O)_2$, y $S(O)_2N(R^7)$,

Y^{AT} es $Q^b - Q^a$,

Q^a es $(CR^{37}R^{38})_b$ donde b es un integral seleccionado de 1 a través de 4, R^{37} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, alquil, y haloalquil, y R^{38} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, alquil, y haloalquil, y R^{38} es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, alquil, haloalquil, aroil, y heteroaroil, con las provisiones que hay al menos un aroil o heteroaroil sustituto, que no más de un aroil o heteroaroil está unido a $(CR^{37}R^{38})_b$ al mismo tiempo, que dicho aroil y dicho heteroaroil son opcionalmente sustituidos de uno a través de tres de los anillos de carbono con un sustituto seleccionado del grupo consistente de R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} , que dicho aroil y dicho heteroaroil están unidos al $CR^{37}R^{38}$ que está directamente unido a E^0 , que no es más que un alquil o un haloalquil unido a $CR^{37}R^{38}$ al mismo tiempo, y dicho alquil y haloalquil están unidos al carbono diferente a aquél uniendo el aroil o heteroaroil,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} están seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, carboxe, haloalquiltio, alkoxe, hidroxe, amino, alkoxiamino, alquilamino, alquiltio, alkilsufinil, alkilsulfonil, alkanoil, haloalkanoil, alquil, halo, haloalquil, haloalkoxe, hidroxiálkil, aminoalquil, y ciano,

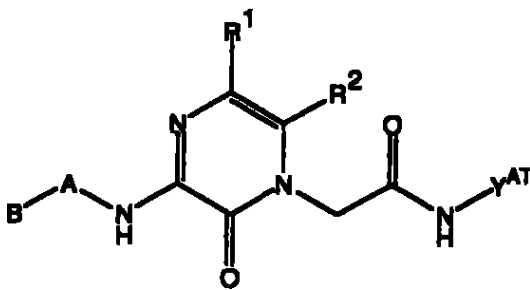
R^{16} y R^{19} son opcionalmente Q^b con la provisión que no más de uno de R^{16} y R^{19} es Q^b al mismo tiempo y que Q^b es Q^{be} ,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$, Q^{be} donde Q^{be} es hidrógeno, $N(R^{26})C(NR^{25})N(R^{23})(R^{24})$ y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, con las provisiones de que no más de uno de R^{20} y R^{21} es hidroxe, amino, alquilamino o dialkilamino al mismo tiempo y que no más de uno de R^{23} y R^{24} es hidroxe, amino, alquilamino o dialkilamino al mismo tiempo,

575
83
577

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} , R^{25} y R^{26} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, alquil, hidrox, amino, alquilamino y dialquilamino

34 El compuesto como citado en la Reivindicación 33 con la fórmula



o la sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de fenil, 2-tienil, 3-tienil, 2-furil, 3-furil, 2-pirrolil, 3-pirrolil, 2-imidazolil, 4-imidazolil, 3-pirazolil, 4-pirazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, y 5-isoxazolil, donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{32} , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{36} , un carbono adyacente a R^{32} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{33} , un carbono adyacente a R^{36} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{35} , y cualquier carbono adyacente a ambos R^{33} y R^{35} es opcionalmente sustituido por R^{34} ,

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, guanidino, metil, etil, metox, etox, hidrox, amino, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metilamidossulfonil, hidroximetil, amidocarbonil, carbox, ciano y Q^b ,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butenil, 2-butinil, sec-butil, tert-butil, isobutil, 2-metilpropenil, 1-pentil, 2-pentenil, 3-

pentenil, 2-pentinil, 3-pentinil, 2-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2-metil-2-butenil, 3-metilbutil, 3-metil-2-butenil, 1-hexil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 2-hexinil, 3-hexinil, 4-hexinil, 2-hexil, 1-metil-2-pentenil, 1-metil-3-pentenil, 1-metil-2-pentinil, 1-metil-3-pentinil, 3-hexil, 1-etil-2-butenil, 1-heptil, 2-heptenil, 3-heptenil, 4-heptenil, 5-heptenil, 2-heptinil, 3-heptinil, 4-heptinil, 5-heptinil, 2-heptil, 10-metil-2-hexenil, 1-metil-3-hexenil, 1-metil-4-hexenil, 1-metil-2-hexinil, 1-metil-3-hexinil, 1-metil-4-hexinil, 3-heptil, 1-etil-2-pentenil, 1-etil-3-pentenil, 1-etil-2-pentinil, 1-etil-3-pentinil, 2,2,2-trifluoroetil, 2,2-difluoropropil, 4-trifluorometil - 5,5,5-trifluoropentil, 4-trifluorometilpentil, 5,5,6,6,6-pentafluorohexil, y 3,3-trifluoropropil, donde cada miembro del grupo B es opcionalmente sustituido a cualquier carbono hasta e incluyendo 5 átomos desde el punto de unión de B a A con uno o más del grupo consistente de R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} y R^{36} ,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, cicloheptil, oxalan-2-yl, 2-(2R)-biciclo [2 2 1]-heptil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, biciclo[3 1 0] hexan-6-il, 2-morfolinil, 3-morfolinil, 4-morfolinil, 1-piperazinil, 2-piperazinil, 1-piperidinil, 2-piperidinil, 3-piperidinil, 4-piperidinil, 1-pirrolidinil, 2-pirrolidinil, 3-pirrolidinil, 2-dioxanil, 2-tetrahidrofuranil, 3-tetrahidrofuranil, 2-tetrahidropiranil, 3-tetrahidropiranil, 4-tetrahidropiranil, 2-tetrahidrotienil, y 3-tetrahidrotienil, donde cada anillo de carbono es opcionalmente sustituido con R^{33} , los anillos de carbono y un adyacente de nitrógeno al átomo de carbono en el punto de enlace son opcionalmente sustituidos con R^9 o R^{13} , un anillo de carbono o adyacente de nitrógeno a la posición R^9 y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{10} , y un anillo de carbono o adyacente de nitrógeno a la posición de R^{13} y dos átomos desde el punto de unión es opcionalmente sustituido con R^{12} ,

572
100572

R^9 , R^{11} y R^{13} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxé amino, N-metilamino, N,N-dimetilamino, metiltio, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,-trifluoroetil, fluoruro, cloruro, bromo, amidosulfonil, N-metalamidósulfonil, N-N-dimetilamidósulfonil, hidroximetil, 1-hidroxietil, amidocarbonil, N-metalamidocarbonil, carboxe y ciano,

R^{10} y R^{12} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amidocarbonil, N-metalamidocarbonil, guanidino, metil, etil, metoxe, etoxe, hidroxé, hidroximetil, 1-hidroxietil, 2-hidroxietil, carboxe, carboximetil, amino, acetamido, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluoroacetamido, aminometil, N-metilamino, dimetilamino, amidosulfonil, N-metalamidósulfonil, N,N-dimetilamidósulfonil, metoxícarbonil, fluoruro, cloruro, bromo y ciano,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, NH , $N(CH_3)$, CH_2 , CH_3CH , CH_2CH_2 , y $CH_2CH_2CH_2$,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de fenil, 2-tienil, 2-furil, 2-pirrolil, 2-imidazolil, 2-tiazolil, 3-isoxazolil, 2-piridil y 3-piridil, donde un carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^9 , el otro carbono adyacente al carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{13} , un carbono adyacente a R^9 y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{10} , un carbono adyacente a R^{13} y dos átomos del carbono en el punto de unión es opcionalmente sustituido por R^{12} , y cualquier carbono a ambos R^{10} y R^{12} es opcionalmente sustituido por R^{11} ,

Y^{AT} es Q^b-Q^c ,

Q^c es seleccionado del grupo consistente de

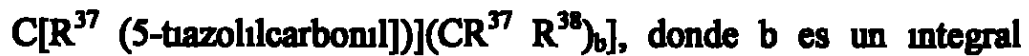
$C[R^{37}(\text{benzoil})](CR^{37}R^{38})_b$,

$C[R^{37}(2\text{-piridilcarbonil})](CR^{37}R^{38})_b$,

$C[R^{37}(3\text{-piridilcarbonil})](CR^{37}R^{38})_b$

$C[R^{37}(4\text{-piridilcarbonil})](CR^{37}R^{38})_b$

578
86
16
38



seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, alquil, y haloalquil, con las provisiones que dicho aroil, y dicho heteroaroil son opcionalmente sustituidos de uno através de tres de los anillos de carbono con un sustituo seleccionado del grupo consistente de R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} con la provisión que R^{17} y R^{18} son opcionalmente sustituidos de un carbono seleccionado de otro diferente a los carbonos meta y para relativos al carbonil del benzoyl sustituto y el heteroaroil sustituto, que dicho benzoyl y dicho heteroaroil están unidos directamente al carbono directamente enlazado al nitrógeno amido del grupo 1-(amidocarbonimetileno), y esto es no mas de un alquil o u haloalquil unido a $CR^{37} R^{38}$ al mismo tiempo,

R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, amidino, guanidino, metoxe, hidrox, amino, aminometil, 1-aminoetil, 2-aminoetil, N-metilamino, dimetilamino, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilsulfinil, metilsulfonyl, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, trifluorometoxe, fluoruro, cloruro, amidosulfonyl, N-metilamidosulfonyl, hidroximetil, carboxe y ciano,

Q^b es seleccionado del grupo consistente de $NR^{20}R^{21}$ y $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$, con la provision que dicho grupo Q^b está ligado directamente al átomo de carbono,

R^{20} , R^{21} , R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, metil, y etil

35 El compuesto citado en la Reivindicación 34 o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

57
87
2020

B es seleccionado del grupo consistente de 2-aminofenil, 3-aminofenil, 3-amidinofenil, 4-amidinofenil, 3-carboxifenil, 3-carboxe-5-hidroxifenil, 3-clorofenil, 4-clorofenil, 3,4-diclorofenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 3,4-difluorofenil, 3-hidroxifenil, 4-hidroxifenil, 3-metoxiaminofenil, 3-metoxifenil, 4-metoxifenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluorometilfenil, 2-imidazol, 2-piridil, 3-piridil, 5-cloro-3-trifluorometil, 2-piridil, 4-piridil, 2-tienil, 3-tienil, y 3-trifluorometil-2-piridil,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, (R)-2-butil, (S)-2-butil, tert-butil, isobutil, 1-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2,2,2-trifluoroetil, 6-amidocarbonilhexil 4-metil-2-pentil, 3-hidroxipropil, 3-metoxe-2-propil, 2-metoxeetil, 2-metil-2-butil, 3-metil-2-butil, 2-dimetilaminopropil, 2-cianoetil, 6-hidroxihexil, 2-hidroxiethyl, 2-amidinoetil, 2-guanidinoetil, 3-guanidinopropil, 4-guanidinobutil, 3-hidroxipropil, 4-hidroxibutil, 6-cianohexil, 2-dimetilaminoetil, 3-metilbutil, 2-metilbutil, (S)-2-metilbutil, 3-aminopropil, 2-hexil y 4-aminobutil,

B es seleccionado opcionalmente del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, oxalan-2-il, 2-(2R)-bíciclo [2 2 1]- heptil, 1,1-dioxotiolan-3-il, oxetan-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, 1-pirrolidinil y 1-piperidinil,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , CH_3CH , CH_2CH_2 y $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$,

R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, metil, etil, propil, trifluorometil, pentafluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil, fluoruro, cloruro y bromo,

R^2 es seleccionado del grupo consistente de 5-amino-3-amidocarbonilfenil, 5-amino-2,2-fluorofenil, 3-amino-5-hidroximetilfenil, 5-amino-3-metoxycarbonilfenil, 3-amidinofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-

amino-2-metiltiofenil, 3-aminofenil, benzil, 3-carbonoxifenil, 5-aminofenil, 3-carboxe-5-hidroxifenil-3-carboximetil, -5-aminofenil, 3-carboximetil-5-hidroxifenil, 3-carboximetilfenil, 3-clorofenil, 2-clorofenil, 2,6-diclorofenil, 3-cianofenil, 3-dimetilaminofenil, 2-fluorufenil, 3-fluorofenil, 2,5 difluorofenil, 2-hidroxifenil, 3-hidroxifenil, 3-metoxiaminofenil, 3-metoxiacarbonilfenil, 2-metilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, fenil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-trifluorometilfenil, 2-trifluorometilfenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-3-tienil, 3-bromo-2-tienil, 3-piridil, 4-piridil, 2-tienil y 3-tienil;

Y^{AT} es $Q^b - Q^s$;

Q^s es seleccionado del grupo consistente de :

$[CH(\text{benzoil})](CH_2)_b$, $[CH(2\text{-piridilcarbonil})](CH_2)_b$,

$[CH(3\text{-piridilcarbonil})](CH_2)_b$, $[CH(4\text{-piridilcarbonil})](CH_2)_b$,

$[CH(2\text{-tienilcarbonil})](CH_2)_b$, $[CH(3\text{-tienilcarbonil})](CH_2)_b$,

$[CH(2\text{-tiazolilcarbonil})](CH_2)_b$, $[CH(4\text{-tiazolicarbonil})](CH_2)_b$,

y $[CH(5\text{-tiazolilcarbonil})](CH_2)_b$, donde b es un integral seleccionado de 1 através de 3, con las provisiones que dicho aroil y dicho heteroaroil son opcionalmente sustituidos de uno através de tres de los anillos de carbono con un sustituto seleccionado del grupo consistente de R^{16} , R^{17} , R^{18} y R^{19} con la provisión que R^{17} y R^{18} son opcionalmente sustituidos de un carbono seleccionado de otro diferente a los carbonos de meta y para relativos al carbonil del benzoil sustituto y del heteroaroil sustituto, y que dicho benzoil y dicho heteroaroil sustituto están ligados al carbono directamente unido al amido nitrógeno del grupo 1-(amidocarbonimetileno);

R^{16} y R^{19} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, amidino, amino, aminometil, metoxe, metilamino, hidroxide, hidroximetil, fluoruro, cloruro y ciano;

89

R^{17} y R^{18} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno, fluoruro, cloruro, hidroxide, hidroximetil, amino, carboxe, y ciano,

Q^b es $C(NR^{25})NR^{23}R^{24}$,

R^{23} , R^{24} y R^{25} son seleccionados independientemente del grupo consistente de hidrógeno y metil

36 El compuesto como citado en la Reivindicación 35 o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

B es seleccionado del grupo consistente de 3-aminofenil, 3-amidinofenil, 4-amidinofenil, 3-clorofenil, 4-clorofenil, 3,4-diclorofenil, 2-fluorofenil, 4-metilfenil, fenil, 2-imidazolil, 3-piridil, 4-piridil, y 3-trifluorometil-2-piridil,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de hidrógeno, etil, 2-propenil, 2-propinil, propil, isopropil, butil, 2-butil, (R)-2-butil, (S)-2-butil, tert-butil, isobutil, 1-pentil, 3-pentil, 2-metilbutil, 2,2,2-trifluoroetil, 6-amidocarbonilhexil, 4-metil-2-pentil, 3-hidroxipropil, 3-metoxe-2-propil, 2-metoxietil, 2-metil-2-butil, 3-metil-2-utíl, 3-dimetilaminopropil, 2-cianoetil, 6-hidroxihexil, 2-hidroxietil, 2-amidoetil, 2-guanidinoetil, 3-guanidinopropil, 4-guanidinobutil, 3-hidroxipropil, 4-hidroxibutil, 6-cianohexil, 2-dimetilaminoetil, 3-metilbutil, 2-metilbutil, (S)-2-metilbutil, 3-aminopropil, 2-hexil, y 4-aminobutil,

B es opcionalmente seleccionado del grupo consistente de ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, oxalan-2-il, 2-(2R)-bíciclo[2,2,1] heptil, 1,1-dioxitolan-3-il, oxeta-3-il, azetidín-1-il, azetidín-2-il, azetidín-3-il, y piperidinil,

A es seleccionado del grupo consistente de un solo enlace covalente, CH_2 , CH_2CH_2 , y $CH_2CH_2CH_2$,

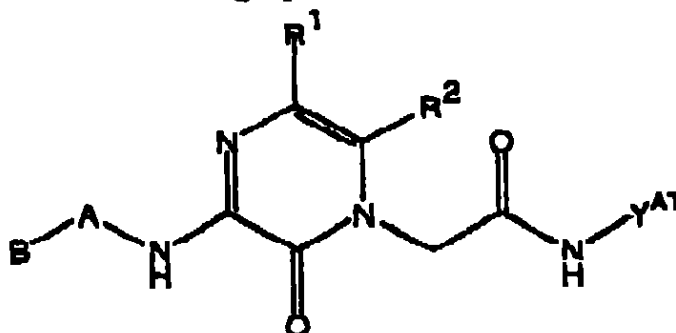
R^1 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno y cloruro,

582
90
584

R^2 es seleccionado del grupo consistente de 3-aminofenil, benzil, 2,6-diclorofenil, 5-amino-2-tienil, 5-amino-2-fluorofenil, 3-amino-2-metilfenil, 5-amino-2-metiltiofenil, 3-carboxifenil, 3-cianofenil, 3-clorofenil, 2-hidroxifenil, 3-hidroxifenil, 3-metabesulfonilaminofenil, 3-metoxycarbonilfenil, 3-dimetilaminofenil, 3-metilaminofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, fenil, 3-piridil, 3-trifluoroacetamidofenil, 3-bromo-2-tienil, 2-tienil y 3-tienil,

Y^{AT} es seleccionado del grupo consistente de 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-2-pentil, 5-guanidino-1-oxo-1-(4-tiazolil)-2-pentil, 5-guanidino-1-oxo-1-(5-tiazolil)-2-pentil, 5-guanidino-1-oxo-1-(4-amino-2-tiazolil)-2-pentil, y 5-guanidino-1-oxo-1-fenil 1-2-pentil

37 Un compuesto como citado de la Reivindicación 33 donde dicho compuesto es seleccionado del grupo con la fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable allí, donde

R^2 es 3-aminofenil, B es fenil, A es CH_2 , Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-2-pentil, y R^1 es cloruro,

R^2 es fenil, B es fenil, A es CH_2CH_2 , Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-2-pentil, y R^1 es hidrógeno,

R^2 es benzil, B es fenil, A es CH_2CH_2 , Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-1-pentil, y R^1 es hidrógeno,

R^2 es fenil, B es fenil, A es CH_2CH_2 , Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-2-pentil, y R^1 es cloruro,

R^2 es benzil, B es fenil, A es CH_2CH_2 , Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo(2-tiazolil)-2-pentil y R^1 es cloruro,

33
91
385

R^2 es fenil, B es fenil, A es CH_2CH_2 Y^{AT} es 5-guanidino-1-oxo-1-(2-tiazolil)-2-pentil y R_1 es hidrógeno

38 Una composición para inhibir condiciones trombóticas en la sangre comprendiendo un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 8, 16, 24, 32 y 37 y un portador farmacéuticamente aceptable

39 Una composición para inhibir condiciones trombóticas en la sangre comprendiendo un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7, Reivindicaciones 1 a 7, Reivindicaciones 9 a 15, Reivindicaciones 17 a 23, Reivindicaciones 25 a 31 y Reivindicaciones 33 a 36 y un portador farmacéuticamente aceptable

40 Un método para inhibir las condiciones trombóticas en la sangre que comprende adicionar a la sangre una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

41 Un método para inhibir la formación de agregados de plaquetas de sangre en la sangre que comprende adicionar a la sangre una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

42 Un método para inhibir la formación de trombosis en la sangre que comprende adicionar a la sangre una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

3834
92
586

⁴³
43 Un método para tratar y prevenir el tromboembolismo venoso y la embolia pulmonar en los mamíferos que comprende administrar al mamífero una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

⁴⁴
44 Un método para tratar o prevenir la trombosis venosa profunda en un mamífero que comprende en administrar al mamífero la cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

⁴⁵
45 Un método para tratar o prevenir el tromboembolismo cardiogénico en un mamífero que comprende en administrar al mamífero una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

⁴⁶
46 Un método para tratar o prevenir el infarto por tromboembolismo en humanos y otros mamíferos que comprende en administrar al mamífero una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

⁴⁷
47 Un método para tratar o prevenir la trombosis asociada con el cancer y la quimioterapia del cancer en humanos y otros mamíferos que comprende en administrar al mamífero la cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

⁴⁸
48 Un método para el tratamiento o prevención de la angina inestable en los humanos y otros mamíferos que comprende administrar al mamífero una cantidad terapéutica efectiva de una composición de cualquiera de las Reivindicaciones 38 y 39

585
93
287

49^e Un metodo para inhibir la formación de trombosis en la sangre que comprende adicionar a la sangre una cantidad terapeutica efectiva de un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 37 con una cantidad terapeutica efectiva de receptor antagonista fibrinogen

586
94
9/588

**Arilo policíclico y pirazinonas de heteroarilo sustituidos útiles para la
inhibición selectiva de la cascada de coagulación**

Extracto

La invención se relaciona con los compuestos de arilo policíclico y pirazinona útiles como inhibidores de las proteasas de serina de la cascada de coagulación y los compuestos, composiciones y métodos en la terapia anticoagulante para el tratamiento y prevención de una variedad de estados trombóticos, incluyendo enfermedades cerebrovasculares y de arteria coronaria

2do EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 589

Radicación no 00-39628

Concepto Técnico no 494

Clasificación Internacional de Patentes A 61 K 31/495

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención

- SI ☒ NO ☐ Contiene un resumen de la invención (Art.26-e)
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción de la invención (Art.26-b)
- SI ☒ NO ☐ NO ES APLICABLE ☐ Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones (Art.26-c)
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen (Art. 26- h)
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-i)
- SI ☐ NO ☒ La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-J)
- SI ☐ NO ☐ La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI ☒ NO ☐ CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS

OBSERVACIONES Y OTROS SI ☐ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

- 1 Se presentan nuevos párrafos 41, 50, 51, 53, 70 81 y 82 de la descripción (Folio 487 a 493) y nuevo capítulo reivindicatorio (Folio 494 a 508)
- 2 Se adjunta el extracto para publicación, la tarjeta de archivo temático y los artes finales de la estructura química principal (2 de 12 x 12 cm y 1 de 6 x 6 cm)

EXAMINADOR TÉCNICO
202040

Bogotá D C, Marzo 20, 2002

2020
Bogotá, D C

Doctor(a)
RAMIRO CASTRO DUQUE
Apoderado(a)

REFERENCIA.	Radicación No	00-39628
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	663
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la comunidad andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión

Cúmplase

Dado en Bogotá, D C , a los

15 de ABR. 2002


ALIX CÉSPEDES DE VERGEL

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, D C , 20-04-02 El extracto de esta solicitud fue publicado en el número 517 de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha 23-06-02 El término hábil señalado por la ley expiró el 24-09-02 y SI ☒ NO ☐ se presentaron oposiciones por parte de terceros.

202038

Carrera 13 No 27-00 Pisos 5 7 y 10
Conmutador 382 0840
Fax. 382 2695
E-mail Info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D C , Colombia