

# CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com  
caveller@caveller.com

EDIFICIO SISKI  
CARRERA 4 No. 72 - 35  
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

902  
Teléfono: (57-1) 347 3811  
Telefax: (57-1) 211 8850  
(57-1) 540 0880  
Fax In U.S.A.: (1-305) 381 8880

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 01-109589-00010-0000

Fecha: 2007-05-17 16:56:32 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 66

Señora Jefe de la  
**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**  
Superintendencia de Industria y Comercio  
E. S. D.

Trámite : 002  
Evento : 001  
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 01.109.589  
Asunto : Solicitud de patente para **DERIVADOS DE BENZIMIDAZOL Y PIRIDILIMIDAZOL Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE LOS COMPRENDEN.**  
Solicitante : **NEUROGEN CORPORATION AND PFIZER, INC.**  
Fecha de Solicitud : 21 de diciembre de 2001

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes Identificado, me refiero al Oficio No. **394** notificado por fijación en lista del 21 de septiembre de 2006.

2. Mediante memorial de fecha 3 de abril de 2007 solicité un plazo de 30 días para atender el Oficio No. **394**.

3. Mediante el Oficio No. **394** se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente.

Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

**3.1. CLARIDAD DE LA SOLICITUD**

Para subsanar las objeciones que sobre claridad hizo su Despacho, presento nuevo pliego reivindicatorio con 101 reivindicaciones en el cual se han hecho los cambios sugeridos por su Despacho. Para estos efectos, se han efectuado las siguientes modificaciones en el capítulo reivindicatorio:

- El nuevo pliego reivindicatorio se ha redactado especificando el número de carbonos que tienen los radicales. A saber:

| <b>RADICAL</b>         | <b>REEMPLAZO</b>                                                                           |
|------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|
| alquilo                | alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                                   |
| alcoxi                 | alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                                    |
| arilo                  | arilo(C <sub>5</sub> -C <sub>10</sub> )                                                    |
| arilalquilo            | aril(C <sub>5</sub> -C <sub>10</sub> )alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )             |
| heteroarilo            | heteroarilo(C <sub>5</sub> -C <sub>10</sub> )                                              |
| heteroarilalquilo      | heteroaril(C <sub>5</sub> -C <sub>10</sub> )alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )       |
| cicloalquilo           | cicloalquilo(C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )                                              |
| heterocicloalquilo     | heterocicloalquilo (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )                                       |
| (cicloalquil)alquilo   | cicloalquil(C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )       |
| Cicloalquilalcoxi      | cicloalquil(C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> ) alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )       |
| alquenilo              | alquenilo (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )                                                |
| alquinilo              | alquinilo(C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )                                                 |
| haloalquilo            | haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                              |
| haloalcoxi             | haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                                |
| hidroxialquilo         | hidroxialquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                           |
| aminoalquilo           | aminoalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                             |
| monoalquilaminoalquilo | monoalquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) aminoalquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) |
| dialquilaminoalquilo   | dialquilamino(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )   |
| alcanoilo              | alcanoilo                                                                                  |

|                            |                                                                                            |
|----------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|
| alcoxicarbonilo            | alcoxicarbonilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                           |
| (heterocicloalquil)alquilo | heterocicloalquil(C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) |
| alquilsulfonilo            | alquilsulfonilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                          |
| alquiltio                  | alquiltio (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                                |
| dialquilamino              | dialquilamino(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                             |
| monoalquilaminocarbonilo   | monoalquilaminocarbonilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                  |
| dialquilaminocarbonilo     | dialquilaminocarbonilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )                                    |

- Teniendo en cuenta la anterior modificación, el título de la invención ha sido modificado indicando el objeto de la invención y eliminando la referencia a su actividad farmacológica: "DERIVADOS DE BENZIMIDAZOL Y PIRIDILIMIDAZOL Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE LOS COMPRENDEN".
- La nueva reivindicación 89 y sus dependientes, reivindican un proceso para preparar un compuesto de formula A, el cual esta caracterizado por las etapas y las condiciones con las cuales es llevado a cabo dicho proceso. El soporte para estas reivindicaciones se encuentra en los Esquemas I y V, en el Ejemplo 1, Método A y en los Ejemplos 32, 44, y 48 de la descripción.
- La nueva reivindicación 90 enumera los compuestos presentes en los ejemplos específicos de la invención, los cuales están debidamente sustentados en los ejemplos 1, 2, 5, y 31, y en las tablas 6 y 7 de la descripción
- Finalmente, las reivindicaciones 181 a 183, las cuales reclaman los usos de un compuesto a sal de acuerdo con la reivindicación 1 han sido eliminadas del nuevo pliego reivindicatorio.

Con las anteriores modificaciones del capítulo reivindicatorio quedan subsanadas las objeciones que por claridad y por incluir reivindicaciones de uso hizo su Despacho al

mismo ya que ahora cumple con las disposiciones de los artículos 14, 28 y 30 de la Decisión 486.

### **3.2. UNIDAD DE INVENCION**

Su Despacho considera que la solicitud carece de unidad de invención, ya que: (i) se reclaman un número elevado de compuestos y (ii) un paquete que comprende una composición farmacéutica que no guarda unidad de invención con los compuestos objeto de la solicitud de patente.

Teniendo en cuenta la recomendación de su Despacho, los compuestos reclamados en el nuevo pliego reivindicatorio poseen características estructurales similares y abarcan derivados de benzimidazol y piridimidazol. Adicionalmente, las reivindicaciones 179 y 180, referentes al paquete que comprende una composición farmacéutica han sido eliminadas del pliego reivindicatorio.

El nuevo pliego reivindicatorio ahora cumple con el requisito de unidad de invención ya que involucra un único concepto inventivo, por lo tanto queda subsanada la objeción que sobre unidad de invención hizo ese Despacho.

### **3.3. EXCEPCIONES DE PATENTABILIDAD**

Ese Despacho considera que las reivindicaciones 166 a 178 de la presente invención se encuentran incursas en la excepción de patentabilidad del Art. 20, literal (d) de la Decisión 486. Con el fin de subsanar dicha objeción, se han efectuado las siguientes modificaciones en el capítulo reivindicatorio:

- La reivindicación 172 se ha eliminado del pliego reivindicatorio.

- Las nuevas reivindicaciones 78 a 88 (reivindicaciones originales 166-171 y 173-177) se han modificada para especificar que se tratar de procedimientos *in vitro*.

A este respecto, respetuosamente ponemos de presente al Despacho que *El Manual Para El Examen De Solicitudes De Patentes de la Comunidad Andina*<sup>1</sup>, documento en cuya preparación participaron las Oficinas de Patentes de los Países Miembros de la Comunidad Andina además de la OMPI y el IMPI y que tiene por objeto la armonización de los procedimientos y prácticas en materia de patentes además de servir como elemento de trabajo para los examinadores de las Oficinas nacionales de patentes, ha sostenido lo siguiente:

"Métodos para obtener información del cuerpo humano o animal, que por sí solos no sean suficientes para tomar una decisión del tratamiento a seguir son patentable, si pueden ser llevados a cabo sin la Intervención de un médico y solo por un técnico. Básicamente un método llevado a cabo fuera del cuerpo es poco probable que se considerado como excluido de patentabilidad"<sup>m1</sup>  
(Subrayado fuera de texto).

En este mismo sentido La Doctrina ha sostenido lo siguiente:

"Se ha entendido que no quedan comprendidos en la exclusión de patentamiento.....los métodos de diagnóstico que se efectúen sobre tejidos u otra materias separadas del cuerpo y los métodos para obtener información que luego será utilizada para la elaboración de diagnósticos. También se han entendido como no

---

<sup>1</sup> IEPI, BID. "MANUAL PARA EL EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION EN LAS FICINAS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL DE LOS PAISES DE LA COMUNIDAD ANDINA". Quito, Ecuador 2004. Pág. 51.

comprendidos en la exclusión los métodos que solo proporcionan resultados intermedios o solo parciales<sup>2</sup>.

Así entonces, solicitamos que a partir de la Interpretación que a esta norma le ha dado tanto la Doctrina como el Manual Andino de Patentes y por lo tanto del alcance dado a esta excepción de patentabilidad, se evalúe la patentabilidad de las reivindicaciones 78 a 88. Para estos efectos se debe tener en cuenta que los métodos reivindicados en las mismas son llevados a cabo en muestras de tejido o células y no en un animal o un humano y además que los mismos pueden ser llevados a cabo por un técnico sin la intervención de un médico responsable del tratamiento de un paciente. Así mismo, es importante resaltar que la información obtenida como resultado del desarrollo de este procedimiento, NO indica implícita o explícitamente la presencia de una enfermedad, ni la necesidad de un tratamiento específico.

En otras palabras, las nuevas reivindicaciones 78 a 88 se relacionan con métodos *in vitro* para determinar la presencia de un receptor GABA<sub>A</sub>, lo cual no determina la presencia de una enfermedad ni la necesidad de un tratamiento específico.

Por lo tanto, se puede concluir que los métodos reivindicados no están incursos en esta excepción de patentabilidad y que por ende el literal d) del artículo 20 no es aplicable en la misma.

4. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

---

<sup>2</sup> CABANELLAS, Guillermo. "DERECHO DE LAS PATENTES DE INVENCION". Tomo I. Editorial Helasta,

**5. Anexos:**

- 5.1. Nuevo pliego reivindicatorio con 101 reivindicaciones.
- 5.2. Formulario para modificaciones.
- 5.3. Recibo por valor de \$99.000 por concepto de modificaciones en solicitud pendiente.

Bogotá,  
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

COLO 12889-801-002-9  
NNJ/NNJ/ID-000029/WPC12889  
Cns M-2007-00005662

**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES  
2000-F03**

1

**SOLICITUD DE:**

☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud

2

**SOLICITANTE**

**Nombres: NEUROGEN CORPORATION y  
PFIZER, INC.**  
Sociedades constituidas y existentes bajo las leyes  
de Delaware, Estados Unidos de América.

**Dirección:** 35 N.E. Industrial Road,  
Branford,  
Connecticut 06405  
Estados Unidos de América, y

235 E 42<sup>nd</sup> Street, 20<sup>th</sup> Floor,  
New York,  
New York 10017-5755,  
Estados Unidos de América,

**Domicilio:** Branford,  
Connecticut  
Estados Unidos de América, y

New York,  
New York  
Estados Unidos de América,

**Teléfono:** 546 09 70 **Fax:** 547 31 70  
**E-mail:** clientes@camyp.com

**IDENTIFICACION**

C.C. ☐ NIT ☐  
C.E. ☐ Otro ☐

Número: \_\_\_\_\_

3

**REPRESENTANTE  
O APODERADO**

**Nombre:** Emilio FERRERO

**Dirección:** Carrera 4ª No. 72-35

**Teléfono:** 347 36 11 **Fax:** 211 86 50

**E-mail:** cavelier@cavelier.com

**IDENTIFICACION**

C.C. ☒ NIT ☐  
C.E. ☐ Otro ☐

Número: 438.019 TP 31.929

4

**Número de expediente:** 01.109.589

5

**Descripción de la corrección o modificación solicitada:**

Se presenta nuevo capítulo reivindicatorio con 101 reivindicaciones con el objeto de subsanar la posible falta de claridad, unidad de invención y excepciones de patentabilidad de la solicitud. De la misma forma, el título de la invención se ha modificado a **"DERIVADOS DE BENZIMIDAZ L Y PIRIDILIMIDAZOL Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE LOS COMPRENDEN"**.

6

**Comprobante de pago No.** 07-35.379 **Fecha:** 07 de mayo de 2007

7

**Anexos**

- ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$ 99.000  
☐ Poderes, si fuere el caso  
☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.



NOMBRE: EMILIO FERRERO

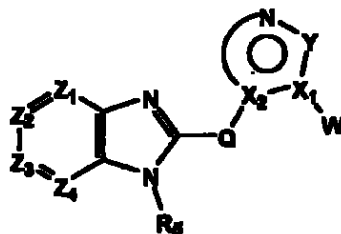
FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929

NNJ

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula



5

o una sal farmacéuticamente aceptable de estos, en donde:

$Z_1$  es nitrógeno o  $CR_1$ ;

10  $Z_2$  es nitrógeno o  $CR_2$ ;

$Z_3$  es nitrógeno o  $CR_3$ ;

$Z_4$  es nitrógeno o  $CR_4$ ;

dado que no más de dos de  $Z_1$ ,  $Z_2$ ,  $Z_3$ , y  $Z_4$  son nitrógeno;

15  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$  y  $R_4$  se seleccionan independientemente de

i) hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), y haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ).

ii) alquilo ( $C_1-C_6$ ), alcoxi ( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), alquenilo ( $C_2-C_6$ ),  
 20 alquinilo ( $C_2-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ),  $-NH(R_{10})$ ,  $-N(R_{10})(R_{11})$ ,  
 hidroxialquilo( $C_1-C_6$ ), aminoalquilo( $C_1-C_6$ ),  $(R_{10})NH(C_1-C_6)$ alquilo,  $(R_{10})$   
 $(R_{11})N(C_1-C_6)$ alquilo, alcanilo( $C_1-C_6$ ), alcóxicarbonilo( $C_1-C_6$ ),  
 heterocicloalquilo( $C_2-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), alquilsulfonilo( $C_1-C_6$ ), alquiltio( $C_1-$   
 $C_6$ ), mono- o dialquilaminocarbonilo( $C_1-C_6$ ), heterocicloalquilo ( $C_2-C_6$ ), arilo

(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), y heteroarilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>.

en donde R<sub>10</sub> y R<sub>11</sub> se seleccionan independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcanilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y mono y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); y

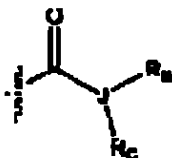
iii) un grupo de la fórmula:



en donde G es un enlace, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), -O-, -C(=O)- o CH<sub>2</sub>C(=O)-, y

R<sub>A</sub> es un carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que consiste de 1 anillo o 2 anillos fusionados, pendientes o espiro, cada anillo contiene 0, 1, o 2 heteroátomos independientemente escogidos de N, S y O, dicho carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático es opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>.

iv) un grupo de la fórmula



en donde J es N, CH, o C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo, y

R<sub>B</sub> y R<sub>C</sub> se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno,

alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-

5 C<sub>8</sub>), arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcanoilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), y mono y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por 1 o 2 sustituyentes

independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro,

alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

10 R<sub>B</sub> y R<sub>C</sub> y el átomo al cual ellos están unidos forman un anillo monocíclico o  
bicíclico de 4- a 10-miembros, que puede contener:

a) uno o más enlaces dobles,

b) uno o más de oxo, O, S, SO, SO<sub>2</sub>, o N-R<sub>D</sub> en donde R<sub>D</sub> es hidrógeno, Ar<sub>1</sub>,

15 alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), o Ar<sub>1</sub>(C<sub>1</sub>-

C<sub>8</sub>)alquilo; en donde Ar<sub>1</sub> es arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), o heteroarilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), cada uno

de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 o 2 sustituyentes

independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro,

alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y/o

20 c) uno o más sustituyentes R<sub>20</sub>;

v) -OC(=O)R<sub>E</sub>, -C(=O)OR<sub>E</sub>, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)NHR<sub>E</sub>, -C(=O)R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -

S(O)<sub>n</sub>R<sub>E</sub>, -S(O)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>, -S(O)<sub>n</sub>NHR<sub>E</sub>, -S(O)<sub>n</sub>R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -NHC(=O)R<sub>E</sub>, -C(=NR<sub>E</sub>)R<sub>F</sub>,

-HC=N-OH, -HC=N(alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)), -HC=N(alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)), -NR<sub>E</sub>C(=O)R<sub>F</sub>, -

25 NHS(O)<sub>m</sub>R<sub>E</sub>, y NR<sub>E</sub>S(O)<sub>m</sub>R<sub>F</sub>, en donde m es 0, 1, o 2, y

R<sub>E</sub> y R<sub>F</sub> se seleccionan independientemente en cada ocurrencia de alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o

dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>) cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por 1, 2, o 3 de R<sub>30</sub>;

R<sub>20</sub> se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste

5 de halógeno; hidroxí; nitro; ciano; amino; alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
opcionalmente sustituido con amino o mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>); cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); cicloalquilo(C<sub>3</sub>-  
C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>); alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>); haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
oxo; haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y  
10 mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>30</sub> se selecciona independientemente en cada ocurrencia de halógeno, hidroxí,

nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), opcionalmente sustituido  
con amino o mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
15 cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-  
C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), oxo, mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo(C<sub>1</sub>-  
C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

20 R<sub>5</sub> representa hidrógeno o haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), o cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>), cada uno de los cuales puede contener uno o más enlaces dobles o  
triples, y cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con 1, 2, o 3  
25 de R<sub>30</sub>, o

$R_5$  representa arilo ( $C_5-C_{10}$ ), arilo( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), heteroarilo ( $C_5-C_{10}$ ), o heteroarilo( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_4$ ) cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de haloalquilo( $C_1-C_8$ ), amino,  $-NH(R_{10})$ ,  $-N(R_{10})(R_{11})$ ,  $(R_{10})NH$ carbonilo,  $(R_{10})(R_{11})N$ carbonilo, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo ( $C_1-C_8$ ), alcoxilo ( $C_1-C_8$ ) opcionalmente sustituido con amino o mono- o dialquilamino( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ )alcoxilo( $C_1-C_8$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_8$ ), alquenilo ( $C_2-C_8$ ), alquinilo ( $C_2-C_8$ ), haloalquilo( $C_1-C_8$ ), haloalcoxilo( $C_1-C_8$ ), aminoalquilo( $C_1-C_8$ ) y mono- y dialquilamino( $C_1-C_8$ )alquilo( $C_1-C_8$ );

$Q$  representa  $-C(R_6)(R_7)$  u oxígeno,

con la condición que  $Q$  no es oxígeno cuando  $X_2$  es nitrógeno;

$R_6$  y  $R_7$  representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo( $C_1-C_8$ );

el grupo



representa un anillo heteroarilo de 5 a 7 miembros o heterocicloalquilo( $C_1-C_8$ ) que contiene hasta 4 heteroátomos independientemente seleccionados de nitrógeno, azufre, y oxígeno, dicho anillo heteroarilo o heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros se sustituye en cada átomo de carbono por  $R$ , y se sustituye en cada átomo de nitrógeno disponible para sustitución por  $R'$ , en donde

R se escoge independientemente en cada ocurrencia de hidrógeno, halógeno, amino, alquilo, alquenilo ( $C_2-C_6$ ), alquinilo ( $C_2-C_6$ ), alcoxi( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), haloalquilo( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi( $C_1-C_6$ ), carboxamido, y grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7- miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, que puede ser adicionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxí, alquilo, y alcoxi( $C_1-C_6$ );

10 R' se escoge independientemente en cada ocurrencia de alquilo( $C_1-C_6$ ), hidrógeno, cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_6$ ), y grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7-miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, tales grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7-miembros se suistituyen opcionalmente con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxí, alquilo( $C_1-C_6$ ), y alcoxi( $C_1-C_6$ );

$X_1$  y  $X_2$  representan independientemente nitrógeno, carbono o CH;

20 Y es nitrógeno, oxígeno, carbono, -CH-, -CH<sub>2</sub>- o ausente; y

W representa arilo ( $C_5-C_{10}$ ), o heteroarilo ( $C_5-C_{10}$ ), en donde el grupo arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de  $R_{30}$ ,  $-CO_2H$ ,  $-C(=O)R_E$ ,  $-C(=O)NHR_E$ ,  $-C(=O)R_ER_F$ ,  $-C(O)R_E-S(O)_mR_E$ , y  $OR_E$ , en donde  $R_{30}$  y  $R_E$  son como se definió anteriormente y m es 0, 1, o 2.

2. Un compuesto o sal de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

$R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$  y  $R_4$  se seleccionan independientemente de

i) hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitrógeno, ciano, amino, haloalquilo( $C_1-C_6$ ), y  
5 haloalcoxi( $C_1-C_6$ ),

ii) alquilo ( $C_1-C_6$ ), alcoxi ( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), alqueno ( $C_2-C_6$ ),  
alquino ( $C_2-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ),  $-NH(R_{10})$ ,  $-N(R_{10})(R_{11})$ ,  
hidroxialquilo( $C_1-C_6$ ), aminoalquilo( $C_1-C_6$ ),  $(R_{10})NH(C_1-C_6)$ alquilo,  $(R_{10})$   
10  $(R_{11})N(C_1-C_6)$ alquilo, alcanoilo( $C_1-C_6$ ), alcóxicarbonilo( $C_1-C_6$ ),  
alquilsulfonilo( $C_1-C_6$ ), alquiltio( $C_1-C_6$ ), mono- o dialquilaminocarbonilo( $C_1-C_6$ ),  
heterocicloalquilo ( $C_2-C_6$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), arilo  
( $C_5-C_{10}$ ), y heteroarilo ( $C_5-C_{10}$ ), cada uno de los cuales se sustituye  
opcionalmente con 1, 2, 3, o 4 de  $R_{20}$ ,

15 en donde  $R_{10}$  y  $R_{11}$  se seleccionan independientemente del grupo que  
consiste de alquilo ( $C_1-C_6$ ), alqueno ( $C_2-C_6$ ), alcoxi ( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ),  
cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), arilo ( $C_5-C_{10}$ ), arilo( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_6$ ),  
alcanoilo( $C_1-C_6$ ), y mono y dialquilaminoalquilo( $C_1-C_6$ );

20 iii) un grupo de la fórmula:



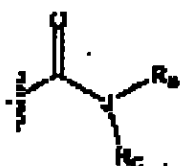
25 en donde G es alquilo ( $C_1-C_6$ ),  $-O-$ ,  $-C(=O)-$  o  $CH_2C(=O)-$ , y

$R_A$  es un carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que consiste  
de 1 anillo o 2 anillos fusionados, pendientes o espiro, cada anillo consiste

de 3 a 8 átomos por anillo, y cada anillo contiene 0, 1, o 2 heteroátomos independientemente escogidos N, S y O, dicho carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático es opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, o 4 de  $R_{20}$ , y

5

iv) un grupo de la fórmula



en donde J es N, CH, o C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo, y

- 10  $R_B$  y  $R_C$  se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcanoilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), y mono y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cada uno
- 15 de los cuales es opcionalmente sustituido por 1 o 2 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

$R_B$  y  $R_C$  y el átomo al cual ellos están unidos forman un anillo monocíclico o

20 bicíclico de 4- a 10-miembros, que puede contener:

- a) uno o más enlaces dobles,
- b) uno o más de oxo, O, S, SO, SO<sub>2</sub>, o N-R<sub>D</sub> en donde R<sub>D</sub> es hidrógeno, Ar<sub>1</sub>, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), o Ar<sub>1</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo; en donde Ar<sub>1</sub> es arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), o heteroarilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), cada uno
- 25

de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 o 2 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y/o

c) uno o más sustituyentes R<sub>20</sub>;

5

v) -OC(=O)R<sub>E</sub>, -C(=O)OR<sub>E</sub>, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)NHR<sub>E</sub>, -C(=O)R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -S(O)<sub>n</sub>R<sub>E</sub>, -S(O)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>, -S(O)<sub>n</sub>NHR<sub>E</sub>, -S(O)<sub>n</sub>R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -NHC(=O)R<sub>E</sub>, -C(=NR<sub>E</sub>)R<sub>F</sub>, -HC=N-OH, -HC=N(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), -HC=N(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), -NR<sub>E</sub>C(=O)R<sub>F</sub>, -NHS(O)<sub>m</sub>R<sub>E</sub>, y NR<sub>E</sub>S(O)<sub>m</sub>R<sub>F</sub>, en donde m es 0, 1, o 2, y

10

R<sub>E</sub> y R<sub>F</sub> se seleccionan independientemente en cada ocurrencia de alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>) cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por 1, 2, o 3 de R<sub>30</sub>;

15

R<sub>20</sub> se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de halógeno; hidroxilo; nitro; ciano; amino; alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); opcionalmente sustituido con amino o mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>); cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>); alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>); haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); oxo; mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

20

R<sub>30</sub> se selecciona independientemente en cada ocurrencia de halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), opcionalmente sustituido con amino o mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

25

cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>),  
 alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
 oxo, mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y  
 mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

5

R<sub>5</sub> representa hidrógeno o haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), o

cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cada uno de los cuales puede contener

uno o más enlaces dobles o triples, y cada uno de los cuales es opcionalmente

10 sustituido con 1, 2, o 3 de R<sub>30</sub>, o

R<sub>5</sub> representa arilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), heteroarilo (C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), o

heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) cada uno de los cuales es opcionalmente

sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste

15 de

haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), amino, -NH(R<sub>10</sub>), -N(R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>), carboxamido, NH(R<sub>10</sub>)carbonilo,

N(R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>)carbonilo, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) opcionalmente sustituido con amino o mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

20 cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>),

alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)

y mono- y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

Q representa -C(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>) u oxígeno,

25 con la condición que Q no es oxígeno cuando X<sub>2</sub> es nitrógeno;

R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

el grupo



5

representa un anillo heteroarilo o heterocicloalquilo que contiene hasta 4 heteroátomos seleccionados de nitrógeno, azufre, y oxígeno, dicho anillo heteroarilo o heterocicloalquilo de 5 a 7 miembros se sustituye en cada átomo de carbono por R, y se sustituye en cada átomo de nitrógeno disponible para sustitución por R', en donde

10

R se escoge independientemente en cada ocurrencia de hidrógeno, halógeno, amino, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), carboxamido, y grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7-miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, que pueden ser adicionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxil, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

15

20

R' se escoge independientemente en cada ocurrencia de hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>(alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7-miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, tales grupos carbocíclicos o heterocíclicos de 3- a 7-miembros que se pueden sustituir opcionalmente con uno o más sustituyentes

25

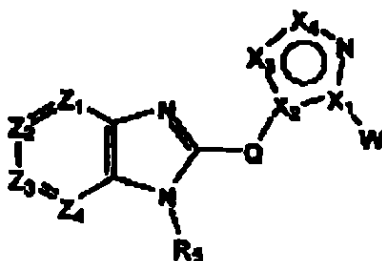
922

independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxí, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,  
y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); y

X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> W y Y son como se define en la Reivindicación 1.

5

3. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 2 de la fórmula:



10 en donde Z<sub>1</sub>, Z<sub>2</sub>, Z<sub>3</sub>, Z<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, Q, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, y W son como se define en la Reivindicación  
2;

X<sub>3</sub> y X<sub>4</sub> se seleccionan independientemente del grupo que consiste de carbono,  
CR, N, O, S, NH, y N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo;

dado que al menos uno de X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, X<sub>3</sub>, y X<sub>4</sub> es carbono o CR, en donde

15 R se escoge independientemente en cada ocurrencia de hidrógeno, halógeno,  
amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-  
C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), carboxamido, y grupos carbocíclicos o heterocíclicos de  
20 3- a 7-miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, que pueden  
ser adicionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes  
independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxí, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,  
y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

4. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1-3 en donde

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

5 5. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 48 o 68 en donde

$X_2$  es carbono; y Q es oxígeno.

6. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 48 o 68 en donde

10

$X_2$  es N; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

7. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 48 o 68 en donde

15

$X_2$  es carbono; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

8. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 48 o 68 en donde  $X_1$  es carbono;  $X_2$  es N; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

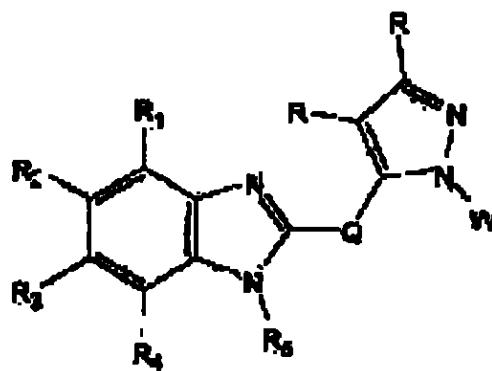
20

9. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 48 o 68 en donde  $X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

10. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 4, 11, 36, 37, 44, 60, 65, 67 o 68 en donde Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

25

11. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 4 de la fórmula



en donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, Q y W son como se define en la Reivindicación 6.

- 5 12. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 10 o la Reivindicación 28, en donde:

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

10

- i) hidrógeno, halógeno, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y

- 15 ii) fenilo y piridilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno,

20

hidroxilo, nitrilo, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o

dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

5 R<sub>5</sub> representa hidrógeno, alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), fenilo, bencilo, tiofenilo, tiazolilo, piridilo, imidazolilo, pirazolilo, o pirimidinilo;

R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); y

10 W representa fenilo, tienilo, tiazolilo, piridilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, o pirimidinilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub> independientemente seleccionados.

15 13. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 10, en donde R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
20 cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

25 Q es CH<sub>2</sub>; y

W representa fenilo, furanilo, tienilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, pirimidinilo, bencimidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos  $R_{30}$ .

5

14. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 13 o Reivindicación 31 en donde

$R_1$ ,  $R_3$ , y  $R_4$ , se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, trifluorometilo, alquilo  $C_1-C_2$  y ciano; y

10

W es fenilo, piridilo, o tiazolilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, ciano, hidroxí, oxo, haloalquilo  $C_1-C_2$ , alquilo  $C_1-C_2$ , y alcoxi  $C_1-C_2$ .

15

15. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 14 o Reivindicación 23 en donde W es 2-tiazolilo, 2-pirimidinilo, 3-fluorofenilo o 6-fluoro-2-piridinilo.

20

16. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 23, 52, o 72 en donde R,  $R_1$ ,  $R_4$  son hidrógeno.

17. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 23, 52, o 72 en donde  $R_5$  es etilo o n-propilo.

25

18. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 52, o 72 en donde  $R_2$  se escoge de

i) hidrógeno, halógeno, hidroxí, nítro, ciano, amino, haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), y haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),

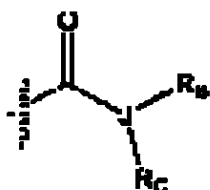
5 ii) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, -NH(R<sub>10</sub>), -N(R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>), (R<sub>10</sub>)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y heterocicloalquilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>.

10

19. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 52, o 72 en donde

R<sub>2</sub> es un grupo de la fórmula

15



en donde J es N, CH, o C-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, y

R<sub>8</sub> y R<sub>9</sub> se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), y cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o

20

R<sub>8</sub> y R<sub>9</sub> y el átomo al cual ellos están unidos forman un anillo monocíclico o bicíclico de 4- a 10-miembros, que puede contener:

25

a) uno o más enlaces dobles,

- b) uno o más de oxo, O, S, SO, SO<sub>2</sub>, o N-R<sub>D</sub> en donde R<sub>D</sub> es hidrógeno, o alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- c) uno o más sustituyentes R<sub>20</sub>.

- 5 20. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 18 o 72, en donde

R<sub>2</sub> es un grupo de fórmula:



10

en donde G es un enlace, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>; y

R<sub>A</sub> es un carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que consiste de 1 anillo o 2 anillos fusionados, pendientes o espiro, cada anillo contienen 0, 1, o 2 heteroátomos independientemente escogidos N, S y O, dicho carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático es opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>,

15

21. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 20, 26 o 52, en donde R<sub>A</sub> se escoge de fenilo, pirrolilo, pirazolilo, tiazolilo, isoxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, y oxazolilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>,

20

22. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 10, en donde

- 25 R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

$R_1$ ,  $R_2$ , y  $R_4$ , se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxí, nitro, ciano, amino, alquilo ( $C_1-C_6$ ), alcoxi ( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_6$ ), haloalquilo( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi( $C_1-C_6$ ), mono- o dialquilamino( $C_1-C_6$ ), aminoalquilo ( $C_1-C_6$ ) y mono- y dialquilamino ( $C_1-C_6$ )alquilo( $C_1-C_6$ );

$R_5$  representa alquilo ( $C_1-C_6$ );

Q es  $CH_2$ ; y

10 W representa fenilo, furanilo, tienilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, pirimidinilo, bencimidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos  $R_{30}$ .

15 23. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 22 o Reivindicación 33, en donde

$R_1$ ,  $R_2$ , y  $R_4$ , se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, trifluorometilo, alquilo  $C_1-C_2$  y ciano; y

20

W es fenilo, piridilo, o tiazolilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, ciano, hidroxí, oxo, haloalquilo  $C_1-C_2$ , alquilo  $C_1-C_2$ , y alcoxi  $C_1-C_2$ .

25 24. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicación 23, 52, o 72, en donde

$R_3$  se escoge de

i) hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitrógeno, ciano, amino, haloalquilo( $C_1-C_6$ ), y haloalcoxi( $C_1-C_6$ ),

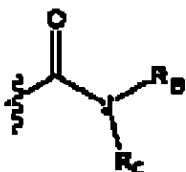
5 ii) alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alqueno  $C_2-C_6$ , alquino  $C_2-C_6$ , (cicloalquilo  $C_3-C_6$ )alquilo  $C_1-C_4$ ,  $-NH(R_{10})$ ,  $-N(R_{10})(R_{11})$ ,  $(R_{10})NH(C_1-C_6)$ alquilo,  $(R_{10})(R_{11})N(C_1-C_6)$ alquilo, heterocicloalquilo( $C_2-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), y heterocicloalquilo ( $C_2-C_6$ ), cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, o 4 de  $R_{20}$ .

10

25. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 23, 52, o 72 en donde

$R_3$  es un grupo de la fórmula

15



en donde J es N, CH, o C-( $C_1-C_6$ )alquilo, y

$R_B$  y  $R_C$  se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno,

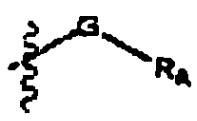
20 alquilo ( $C_1-C_6$ ), alqueno ( $C_2-C_6$ ), alquino ( $C_2-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), y (cicloalquilo  $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), o

$R_B$  y  $R_C$  y el átomo al cual ellos están unidos forman un anillo monocíclico o bicíclico de 4- a 10-miembros, que puede contener:

25 a) uno o más enlaces dobles,

- b) uno o más de oxo, O, S, SO, SO<sub>2</sub>, o N-R<sub>D</sub> en donde R<sub>D</sub> es hidrógeno, o alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- c) uno o más sustituyentes R<sub>20</sub>.

5 26. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 23, 52 o 72, en donde  
R<sub>3</sub> es un grupo de fórmula:



10

en donde G es un enlace, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>; y

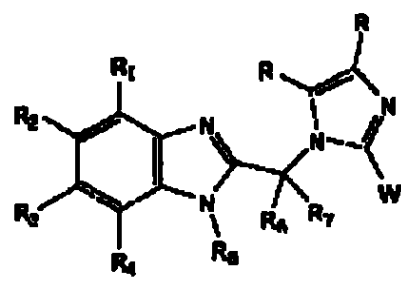
R<sub>A</sub> es un carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático, que consiste de 1 anillo o 2 anillos fusionados, pendientes o espiro, cada anillo contiene 0, 1, o 2 heteroátomos independientemente escogidos N, S y O, dicho carbociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático es opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>.

15

27. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 14 o Reivindicación 23, en donde R<sub>3</sub> es -HC=N-OH o -HC=N(alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)).

20

28. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 4 de la fórmula



en donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, y W son como se define en la Reivindicación 6.

5 29. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 28, en donde:

W representa grupos arilo o heteroarilo de 6 miembros, en donde los grupos arilo o heteroarilo de 6 miembros se sustituyen opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de R<sub>30</sub>, -CO<sub>2</sub>H, -C(=O)OR<sub>E</sub>, -C(=O)NHR<sub>E</sub>, -C(=O)R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -C(O)R<sub>E</sub>-S(O)<sub>m</sub>R<sub>E</sub>, y OR<sub>E</sub>, m es 0, 1, o 2.

10

30. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 28, en donde:

W representa un grupo heteroarilo de 5 miembros, en donde el grupo heteroarilo de 5 miembros se sustituye opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de R<sub>30</sub>, -CO<sub>2</sub>H, -C(=O)OR<sub>E</sub>, -C(=O)NHR<sub>E</sub>, -C(=O)R<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -C(O)R<sub>E</sub>-S(O)<sub>m</sub>R<sub>E</sub>, y OR<sub>E</sub>, m es 0, 1, o 2.

15

31. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 28, en donde:

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

20

R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

25

**R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);**

**R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> son hidrógeno; y**

**W representa fenilo, furanilo, tienilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, pirimidinilo, bencimidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.**

**32. Un compuesto o sal de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 14, 52, o 72, en donde**

**R<sub>2</sub> es -HC=N-OH o -HC=N(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>).**

**33. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 28, en donde:**

**R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);**

**R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);**

**R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);**

**R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> son hidrógeno; y**

W representa fenilo, furanilo, tienilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, pirimidinilo, bencimidazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos  $R_{30}$ .

5

34. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es nitrógeno;  $X_3$  es CR;  $X_4$  es nitrógeno; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

10

35. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es nitrógeno;  $X_3$  es nitrógeno;  $X_4$  es CR; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

36. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

15

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

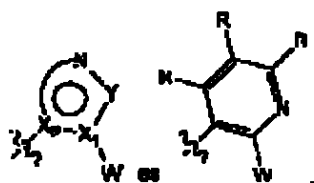
$X_1$  es carbono;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es S; y  $X_4$  es CR.

37. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 2 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

20

y el grupo



38. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

25

$X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es nitrógeno; y  $X_4$  es CR.

39. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es NH o N(alquilo  $C_1-C_6$ ); y  $X_4$  es CR.

5

40. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

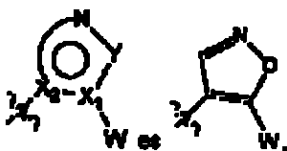
$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es nitrógeno;  $X_3$  es nitrógeno;  $X_4$  es nitrógeno; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

10 41. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 2 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

y el grupo



15 42. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es CR; y  $X_4$  es nitrógeno.

43. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 42 en donde Q es

20  $C(R_6)(R_7)$ .

44. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde:

$Z_1$  es  $CR_1$ ;  $Z_2$  es  $CR_2$ ;  $Z_3$  es  $CR_3$ ; y  $Z_4$  es  $CR_4$ .

$X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es nitrógeno; y  $X_4$  es nitrógeno.

25

45. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1 en donde uno y solo uno de  $Z_1$ ,  $Z_2$ ,  $Z_3$ , y  $Z_4$  es nitrógeno.

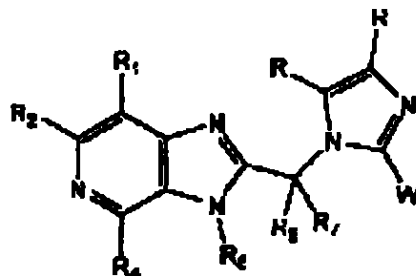
46. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 2 en donde uno y solo uno de  $Z_1$ ,  $Z_2$ ,  $Z_3$ , y  $Z_4$  es nitrógeno.

47. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 3 en donde uno y solo uno de  $Z_1$ ,  $Z_2$ ,  $Z_3$ , y  $Z_4$  es nitrógeno.

48. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 47 en donde cada  $Z_2$  o  $Z_3$  es nitrógeno; y

W representa un grupo heteroarilo de 5 miembros, el grupo heteroarilo de 5 miembros se sustituye opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de  $R_{30}$ ,  $-\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_E\text{R}_F$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}_E-\text{S}(\text{O})_m\text{R}_E$ , y  $\text{OR}_E$ , en donde  $R_{30}$  y  $R_E$  son como se definió anteriormente y m es 0, 1, o 2.

49. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 de la fórmula



en donde R,  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$ ,  $R_7$ , y W son como se define en la Reivindicación 76.

50. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 49, en donde:

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

i) hidrógeno, halógeno, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
5 cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), y

ii) fenilo y piridilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con  
hasta 3 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo,  
10 alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo,  
nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
15 heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), mono- o  
dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R<sub>5</sub> representa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-  
20 C<sub>6</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, bencilo, tiofenilo, tiazolilo, piridilo, imidazolilo,  
pirazolilo, o pirimidinilo;

R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y

W representa tienilo, tiazolilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo,  
25 o isoxazolilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta  
4 grupos R<sub>30</sub>.

51. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 49 o Reivindicación 55, en donde

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste  
5 de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

R<sub>1</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxí,  
nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
10 mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino  
(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> son hidrógeno; y

15 W representa furanilo, tienilo, tiazolilo, imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo,  
pirazolilo, o isoxazolilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido  
con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.

20 52. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 51 en donde

R<sub>1</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno,  
trifluorometilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y ciano; y

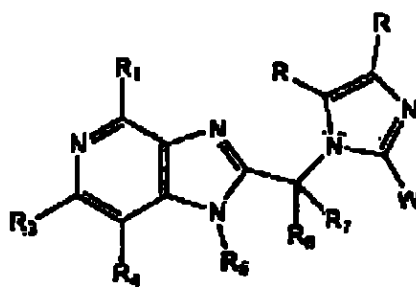
25 W es tiazolilo, el cual es opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes  
independientemente escogidos de halógeno, ciano, hidroxí, oxo, haloalquilo  
C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

53. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 52 en donde W es 2-tiazolilo.

5 54. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 18 o 52, en donde

R<sub>2</sub> se escoge de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>).

10 55. Un compuesto o sal de acuerdo con la reivindicación 48 de la fórmula



en donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, y W son como se define en la Reivindicación

15 76.

56. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 47 en donde:

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

20 i) hidrógeno, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y

ii) fenilo y piridilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

5 R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>5</sub> representa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), fenilo, bencilo, tiofenilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, pirazolilo, o pirimidinilo;

15 R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>; y

W representa tienilo, tiazolo, Imidazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, o isoxazolilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.

20

57. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 24, en donde R<sub>3</sub> se escoge de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>).

25 58. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

X<sub>1</sub> es carbono; X<sub>2</sub> es nitrógeno; X<sub>3</sub> es CR; X<sub>4</sub> es nitrógeno; y Q es C(R<sub>8</sub>)(R<sub>7</sub>).

59. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es nitrógeno;  $X_3$  es nitrógeno;  $X_4$  es CR; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

5

60. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es S; y  $X_4$  es CR.



10 61. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o la Reivindicación 68 en donde

$X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es nitrógeno; y  $X_4$  es CR.

62. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

15

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es NH o N(alquilo  $C_1-C_6$ ); y  $X_4$  es CR.

63. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

20  $X_1$  es carbono;  $X_2$  es nitrógeno;  $X_3$  es nitrógeno;  $X_4$  es nitrógeno; y Q es  $C(R_6)(R_7)$ .

64. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 46 en donde  
cada  $Z_2$  o  $Z_3$  es nitrógeno;  
y el grupo

25



W representa un grupo heteroarilo de 5 miembros, el grupo heteroarilo de 5 miembros se sustituye opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de  $R_{30}$ ,  $-\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_E\text{R}_F$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}_E-\text{S}(\text{O})_m\text{R}_E$ , y  $\text{OR}_E$ , en donde  $R_{30}$  y  $R_E$  son como se definió anteriormente y  $m$  es 0, 1, o 2.

65. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 en donde  $X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es CR; y  $X_4$  es nitrógeno.

66. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

$X_1$  es carbono;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es NH o  $\text{NCH}_3$ ; y  $X_4$  es CR.

67. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 48 o Reivindicación 68 en donde

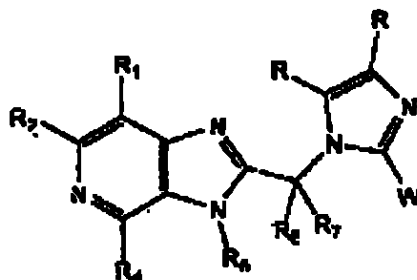
$X_1$  es nitrógeno;  $X_2$  es carbono;  $X_3$  es nitrógeno; y  $X_4$  es nitrógeno.

68. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 47 en donde

cada  $Z_2$  o  $Z_3$  es nitrógeno; y

W representa un grupo arilo o heteroarilo de 6 miembros, el grupo arilo o heteroarilo de 6 miembros se sustituye opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de  $R_{30}$ ,  $-\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_E\text{R}_F$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}_E-\text{S}(\text{O})_m\text{R}_E$ ,  $\text{OR}_E$ , en donde  $R_{30}$  y  $R_E$  son como se definió anteriormente y  $m$  es 0, 1, o 2.

69. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 68 de la fórmula



en donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, y W son como se define en la Reivindicación 68.

5

70. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 69 en donde:

R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

- 10 i) hidrógeno, halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y
- ii) fenilo y piridilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);
- 15

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o

20 dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

**R<sub>6</sub> representa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), fenilo, bencilo, tiofenilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, pirazolilo, o pirimidinilo;**

**R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>; y**

5

**W representa fenilo, pirimidinilo, piridilo, piridizinilo, o pirazinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.**

**71. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 69 o Reivindicación**  
**75, en donde**

10

**R se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, y alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);**

**15 R<sub>1</sub>, y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxí, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);**

20

**R<sub>5</sub> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);**

**R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> son hidrógeno; y**

**W representa fenilo, pirimidinilo, piridilo, piridizinilo, o pirazinilo cada uno de los**  
**25 cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.**

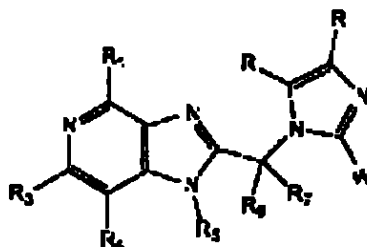
**72. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 71 en donde**

$R_1$ , y  $R_4$ , se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, trifluorometilo, alquilo  $C_1-C_2$  y ciano; y

W es fenilo o pirídilo, cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, ciano, hidroxí, oxo, haloalquilo  $C_1-C_2$ , alquilo  $C_1-C_2$ , y alcoxi  $C_1-C_2$ .

73. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 72 en donde W es 2-pirimidinilo, 3-fluorofenilo, o 6-fluoro-piridinilo.

74. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 68 de la fórmula



en donde  $R$ ,  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$ ,  $R_7$ , y  $W$  son como se define en la Reivindicación 68.

75. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 74 en donde:

$R$  se selecciona independientemente en cada ocurrencia del grupo que consiste de

i) hidrógeno, halógeno, alquilo ( $C_1-C_6$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), cicloalquilo( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_6$ ), alcoxi( $C_1-C_6$ ), haloalquilo( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi( $C_1-C_6$ ), y

W representa un grupo arilo o heteroarilo de 6 miembros, en donde los grupos arilo o heteroarilo de 6 miembros se sustituyen opcionalmente con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de  $R_{30}$ ,  $-\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_E$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_E\text{R}_F$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}_E-\text{S}(\text{O})_m\text{R}_E$ , y  $\text{OR}_E$ , en donde  $R_{30}$  y  $R_E$  son como se definió anteriormente y  $m$  es 0, 1, o 2.

77. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1 combinada con al menos un portador o excipiente farmacéuticamente aceptable.

78. Un método para alterar la actividad de transducción de señal de un receptor  $\text{GABA}_A$ , dicho método comprende poner en contacto una célula que expresa tal un receptor *in vitro* con una cantidad de un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1 suficiente para alterar de forma detectable la electrofisiología de la célula, en donde una alteración detectable de la electrofisiología de la célula indica una alteración de la actividad de transducción de señal de receptores  $\text{GABA}_A$ .

79. Un método para alterar la actividad de transducción de señal de un receptor  $\text{GABA}_A$ , dicho método comprende poner en contacto una célula que expresa tales receptores *in vitro* con una cantidad de un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1 para alterar de forma detectable la conductancia del cloruro *in vitro* de la célula que expresa receptores  $\text{GABA}_A$ .

80. El método de la Reivindicación 79 en donde la célula expresa recombinantemente un receptor  $\text{GABA}_A$  heterólogo y la alteración de la

ii) fenilo y piridilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y -O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

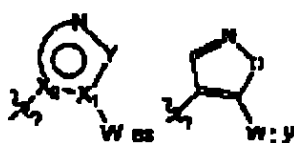
5 R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, se seleccionan independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), mono- o  
10 dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) y mono- y dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>5</sub> representa hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), fenilo, bencilo, tiofenilo, tiazolo, piridilo, imidazolilo, pirazolilo, o pirimidinilo;

15 R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> representan independientemente hidrógeno, fluor, o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>; y

W representa fenilo, piridilo, piridizinilo, pirimidinilo, o pirazinilo cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos R<sub>30</sub>.

20 76. Un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 67 en donde cada Z<sub>2</sub> o Z<sub>3</sub> es nitrógeno y el grupo



electrofisiología de la célula se detecta por registro intracelular o registro de pinzamiento de zonal de membrana.

5 81. El método de la Reivindicación 79 en donde la célula es una célula de neurona y la célula se pone en contacto con el compuesto o sal disuelta en un fluido corporal.

82. El método de la Reivindicación 81 en donde la célula de neurona es una célula de cerebro y el fluido corporal es fluido cerebroespinal.

10

83. Un método para alterar la actividad de transducción de señal de un receptor  $GABA_A$  *in vitro*, el método comprende exponer una célula que expresa receptor  $GABA_A$  con una cantidad de un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1 suficiente para inhibir la unión RO15-1788 *in vitro* de a  
15 células que expresan un receptor  $GABA_A$  humano.

84. Un método para demostrar la presencia de receptor  $GABA_A$  en una muestra de célula o tejido, dicho método comprende:

20

poner en contacto *in vitro* una muestra de célula o tejido con un compuesto etiquetado o una sal de acuerdo con la Reivindicación 1;

lavar la muestra de célula o tejido para remover el compuesto etiquetado desunido o sal; y

detectar la presencia del compuesto etiquetado o sal en la muestra de  
25 célula o tejido.

85. El método de la Reivindicación 84 en el que la muestra de célula o tejido es una sección de tejido.

86. El método de la Reivindicación 84 en el que el compuesto etiquetado o sal  
5 contiene una etiqueta radioactiva o una etiqueta directa o indirectamente luminiscente.

87. El método de la Reivindicación 84 en el que la muestra de célula o tejido es una sección de tejido, el compuesto etiquetado o sal contiene una etiqueta  
10 radioactiva o una etiqueta directa o indirectamente luminiscente y el compuesto etiquetado o sal se detecta autoradiográficamente para generar un autoradiograma.

88. Un método para detectar la presencia de un receptor GABA<sub>A</sub> en una  
15 sección de tejido que comprende:

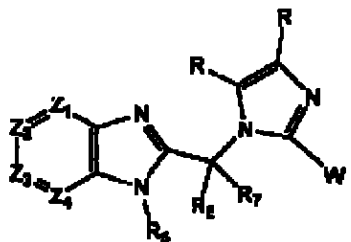
poner en contacto *in vitro* una sección de tejido con un compuesto radioetiquetado o luminiscentemente etiquetado o una sal de acuerdo con la Reivindicación 1 para producir una sección de tejido puesta en contacto;  
20 lavar la sección de tejido para remover el compuesto etiquetado desunido o sal;

detectar el compuesto etiquetado o sal en la sección de tejido; y

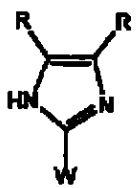
comparar la densidad de exposición de la sección de tejido con

la densidad de exposición de una segunda sección de tejido que no ha sido  
25 puesta en contacto con un compuesto o sal de acuerdo con la Reivindicación 1.

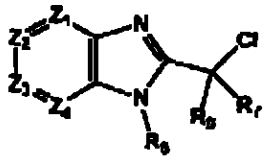
89. Un proceso para preparar un compuesto de Fórmula A



Que comprende hacer reaccionar un compuesto de Fórmula B



5 Con un compuesto de Fórmula C



En la presencia de una base y un solvente:

En donde:

Z<sub>1</sub> es nitrógeno o CR<sub>1</sub>;

10 Z<sub>2</sub> es nitrógeno o CR<sub>2</sub>;

Z<sub>3</sub> es nitrógeno o CR<sub>3</sub>;

Z<sub>4</sub> es nitrógeno o CR<sub>4</sub>;

Siempre y cuando no más de dos Z<sub>1</sub>, Z<sub>2</sub>, Z<sub>3</sub>, y Z<sub>4</sub> sean nitrógeno;

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub> son independientemente seleccionados de

15

i) hidrógeno, halógeno, hidroxilo, nitro, ciano, amino, haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),

ii) alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>),

20

alquinilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -NH(R<sub>10</sub>), -N(R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>),

hidroxialquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), NH(R<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
 N(R<sub>10</sub>)(R<sub>11</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcanilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxycarbonilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
 heterocicloalquil(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquiltio(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
 mono o dialquilaminocarbonilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-  
 5 C<sub>10</sub>), y heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), cada uno de los cuales es opcionalmente  
 sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>,

en donde R<sub>10</sub> y R<sub>11</sub> son independientemente seleccionados del grupo que  
 consiste de alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>),  
 cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), aril(C<sub>5</sub>-  
 10 C<sub>10</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcanilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y mono y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>8</sub>); y

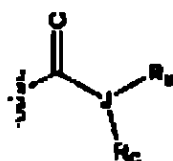
iii) un grupo de fórmula:



En donde G es un enlace, alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), -O-, -C(=O)-, o -CH<sub>2</sub>C(=O)- y

R<sub>A</sub> es un carbociclo saturado, parcialmente insaturado, o aromático, que consiste  
 de 1 anillo o 2 anillos fusionados, pendientes, o espiro, cada anillo contiene  
 0, 1, o 2 heteroatomos independientemente escogidos de N, S, y O, dicho  
 carbociclo saturado, parcialmente insaturado, o aromático es opcionalmente  
 20 sustituido con 1, 2, 3, o 4 de R<sub>20</sub>, y

iv) un grupo de la fórmula



Donde J es N, CH, o C-alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y

$R_B$  y  $R_C$  son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo( $C_1-C_8$ ), alqueno( $C_2-C_8$ ), alquino( $C_2-C_8$ ), alcoxi( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ ), cicloalquil( $C_3-C_8$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_8$ ), arilo( $C_5-C_{10}$ ), aril( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), alcanilo( $C_1-C_8$ ), heteroarilo( $C_5-C_{10}$ ), y mono y dialquilamino( $C_1-C_8$ )alquilo( $C_1-C_8$ ), cada uno de los cuales está

5 opcionalmente sustituido por 1 o 2 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alcoxi( $C_1-C_8$ ), y alquilo( $C_1-C_8$ );

$R_B$  y  $R_C$  y el átomo al cual ellos están unidos forman un anillo monocíclico o

10 bicíclico de 4 a 10 miembros, el cual puede contener:

a) uno o más enlaces dobles,

b) uno o más de oxo, O, S, SO, SO<sub>2</sub> o N- $R_D$  en donde  $R_D$  es hidrógeno,  $Ar_1$ , alquilo( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_8$ ), o  $Ar_1$ alquilo( $C_1-C_8$ ); en donde  $Ar_1$  es arilo( $C_5-C_{10}$ ) o heteroarilo( $C_5-C_{10}$ ),

15 cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por 1 o 2 sustituyentes independientemente escogidos de halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alcoxi( $C_1-C_8$ ), y alquilo( $C_1-C_8$ ), y/o

c) uno o más sustituyentes  $R_{20}$ :

20 v)  $-OC(=O)R_E$ ,  $-C(=O)OR_E$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-C(=O)NHR_E$ ,  $-C(=O)NR_ER_F$ ,  $-S(O)_nR_E$ ,  $-S(O)_nNH_2$ ,  $-S(O)_nNHR_E$ ,  $-S(O)_nNR_ER_F$ ,  $-NHC(=O)R_E$ ,  $-C(=NR_E)R_F$ ,  $-HC=N-OH$ ,  $-HC=N((alcoxi(C_1-C_8)))$ ,  $-HC=N((alquilo(C_1-C_8)))$ ,  $NR_EC(=O)R_F$ ,  $-NHS(O)_mR_E$ , y  $-NR_ES(O)_mR_F$ , donde m es 0, 1 o 2, y

$R_E$  y  $R_F$  son independientemente seleccionados en cada ocurrencia de alquilo( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_8$ ), alcoxi( $C_1-C_8$ ), mono o dialquilamnio( $C_1-C_8$ ), arilo( $C_5-C_{10}$ ), o heteroarilo( $C_5-C_{10}$ )

25

cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por 1, 2, o 3 de  $R_{30}$ ;

$R_{20}$  es independientemente seleccionado en cada ocurrencia del grupo que consiste de: halógeno; hidroxil; nitro; ciano; amino; alquilo( $C_1-C_8$ ); alcoxil( $C_1-C_8$ ) opcionalmente sustituido con amino o mono o dialquilamino( $C_1-C_8$ ); cicloalquilo( $C_3-C_8$ ); cicloalquil( $C_3-C_8$ )alquilo( $C_1-C_4$ ); cicloalquil( $C_3-C_8$ )alcoxil( $C_1-C_8$ ); alquenilo( $C_2-C_8$ ); alquinilo( $C_2-C_8$ ); haloalquilo( $C_1-C_8$ ); oxo; haloalcoxil( $C_1-C_8$ ); mono y dialquilamino( $C_1-C_8$ ); aminoalquilo( $C_1-C_8$ ); y mono y dialquilamino( $C_1-C_8$ )alquilo( $C_1-C_8$ );

$R_{30}$  es independientemente seleccionado en cada ocurrencia de halógeno, hidroxil, nitro, ciano, amino, alquilo( $C_1-C_8$ ), alcoxil( $C_1-C_8$ ) opcionalmente sustituido con amino o mono o dialquilamino( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ ), cicloalquil( $C_3-C_8$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), cicloalquil( $C_3-C_8$ ), alcoxil( $C_1-C_8$ ), heterocicloalquilo( $C_2-C_8$ ), alquenilo( $C_2-C_8$ ), alquinilo( $C_2-C_8$ ), haloalquilo( $C_1-C_8$ ), haloalcoxil( $C_1-C_8$ ), oxo, mono y dialquilamino( $C_1-C_8$ ), aminoalquilo( $C_1-C_8$ ), y mono y dialquilamino( $C_1-C_8$ )alquilo( $C_1-C_8$ );

$R_5$  representa hidrógeno o haloalquilo( $C_1-C_8$ ); o

$R_5$  representa alquilo( $C_1-C_8$ ), cicloalquilo( $C_3-C_8$ ), o cicloalquil( $C_3-C_8$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), cada uno de los cuales puede contener uno o más dobles o triples enlaces, y cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2, o 3 de  $R_{30}$ , o

$R_5$  representa arilo( $C_5-C_{10}$ ), aril( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_4$ ), heteroarilo( $C_5-C_{10}$ ), o heteroaril( $C_5-C_{10}$ )alquilo( $C_1-C_4$ ) cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2, o 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de haloalquilo( $C_1-C_8$ ), amino,  $-NH(R_{10})$ ,  $-N(R_{10})(R_{11})$ , carboxamido,  $(R_{10})NH$ carbonilo,  $(R_{10})(R_{11})N$ carbonilo, halógeno, hidroxil, nitro, ciano, amino, alquilo( $C_1-C_8$ ), alcoxil( $C_1-C_8$ )

opcionalmente sustituidos con amino o mono o dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), heterocicloalquilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquenilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), aminoalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), y mono y dialquilamino(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sub>6</sub> y R<sub>7</sub> independientemente representan hidrógeno, fluor, o alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R es independientemente escogido en cada ocurrencia de hidrógeno, halógeno, amino, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alquinilo(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxiC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), (cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), carboxamido, y grupos carbocíclicos y heterocíclicos de 3 a 7 miembros que son saturados, insaturados, o aromáticos, que pueden ser además sustituidos con uno o más sustituyentes Independientemente seleccionados de halógeno, oxo, hidroxí, alquiloC<sub>1-4</sub>, y -O(alquiloC<sub>1-4</sub>); y

W representa arilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>) o heteroarilo(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>), en donde el grupo arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con hasta 4 grupos independientemente seleccionados de R<sub>30</sub>, CO<sub>2</sub>H, -C(=O)OR<sub>E</sub>, -C(=O)NHR<sub>E</sub>, -C(=O)NR<sub>E</sub>R<sub>F</sub>, -C(O)R<sub>E</sub>, y -S(O)<sub>m</sub>R<sub>E</sub>, -OR<sub>E</sub>, donde R<sub>30</sub> y R<sub>E</sub> son como se definió anteriormente y m es 0, 1, o 2.

90. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que es

1-Propil-2-[[2-(2-fluoropid-6-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-ciano-1H-bencimidazol;

1-Etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-pirazol-3-il]metil]-5-ciano-1H-bencimidazol;

1-Etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-pirazol-3-il]metil]-5-acetil-1H-bencimidazol;

2-[[2-(2,5-di-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-[4,5-b]pirimidina;

2-[[2-(2,5-di-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-[4,5-b]pirimidina;

2-[2-(6-fluoro-piridin-2-il)-imidazol-1-ilmetil]-1-propil-1-H-imidazo[4,5-c]piridina;

3-Etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

3-etil-6-isopropil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

5 1-etil-6-isopropil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

3-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-propil-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6(trifluorometil)-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

10 3-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-(3-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridin-6-il)etanona;

1-Etil-2-(2-tiazol-2-il-2H-pirazol-3-ilmetil)-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

15 1-[3-Etil-2-(2-tiazol-2-il-imidazol-1-ilmetil)-3H-benzoimidazol-5-il]-etanona;

4-[1-Etil-2-(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil)-1H-benzoimidazol-5-il]-2-metilbutan-2-ol;

8-[[2-(6-Fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-2,9-dimetil-9H-purina;

2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

20 2-[[2-(2-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

6-cloro-2-[[2-(2-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

6-cloro-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

6-cloro-2-[[2-(4-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

25 6-cloro-2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;

2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

- 6-cloro-2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol;  
 6-cloro-1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;  
 6-cloro-2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;  
 5 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-etil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;  
 2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-(2,2,2-trifluoroetil)-3H-imidazo[4,5-  
 10 b]piridina;  
 2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-(2,2,2-trifluoroetil)-3H-imidazo[4,5-  
 b]piridina;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-5(morfolin-4-ilmetil)-1H-  
 bencimidazol;  
 15 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-(morfolin-4-ilmetil)-1H-  
 bencimidazol;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-[(4-metilpiperidin-1-il)metil]-1H-  
 bencimidazol;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-fluoro-1-propil-1H-bencimidazol;  
 20 5-fluoro-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol;  
 5-cloro-2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol;  
 2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-5-fluoro-1H-bencimidazol;  
 5-cloro-2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5carbonitrilo;  
 25 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-5-fluoro-1H-bencimidazol;  
 1-etil-5-fluoro-2-[[2-(2-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;  
 5-bromo-1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

- 2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 3-{1-[(1-etil-5-fluoro-1H-bencimidazol-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}benzonitrilo;  
 2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 5 2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 1-etil-5-(3-fluorofenil)-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-il]metil]-1H-bencimidazol;  
 2-[[2-(3-cianofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 5-cloro-1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;  
 10 3-{1-[(5-bromo-1-etil-1H-bencimidazol-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}benzonitrilo;  
 1-(1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)etanona;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5,6-dicarbonitrilo;  
 3-{1-[(5-acetil-1-etil-1H-bencimidazol-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}benzonitrilo;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)-1H-  
 15 bencimidazol;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-bencimidazol;  
 1-(2-[[2-(3-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-il)etanona;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-6-carbonitrilo;  
 20 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-5(5-metil-1,3-oxazol-2-il)-1H-bencimidazol;  
 1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 25 1-(1-etil-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)propan-1-ona;  
 3-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-(1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)etanona;

1-etil-2[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

5 2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazo-1-il]metil]-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-(2-fluoroetil)-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

3-propil-2-[[2-(pirimidin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(2-fluoro-5-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]imetil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(2-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]imetil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

10 2-[[2-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-etil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(2-metoxifenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

15 2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-metil-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(2,3,5-trifluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-{1-[(3-etil-3H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il]metil]-1H-imidazol-2-il}-4-fluorobenzonitrilo;

2-[[2-(2-fluoro-5-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

20

1-etil-2[[2-(2-fluoro-5-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

2-[[2-(3-cloro-2,6-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

6-cloro-1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

25 1-etil-2[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1H-bencimidazol;

6-cloro-1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

5 1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1H-bencimidazo[4,5-c]piridina;

1-(-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5il)etanona;

1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

10 1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

5-cloro-1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

1-etil-5-fluoro-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;

9-etil-8-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-2-metil-9H-purina;

15 3-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

6-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-il]metil]-1-metil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

9-etil-8-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-il]metil]-2-metil-9H-purina;

1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

20 3-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-tien-3-il-1H-bencimidazol;

11-(1-propil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)etanona;

1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

25 1-etil-2-[[2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il]metil]-6-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-5-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

1-etil-2-[[2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il]metil]-5-(trifluorometil)-1H-bencimidazol;

5,6-dicloro-1-etil-2-[(2-(pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil)-1H-bencimidazol];

1-etil-6-metil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

3-etil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-5-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

5 1-etil-5-fluoro-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

1,6-dietil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-6-isobutil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

3-etil-6-isobutil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-3H-imidazo[4,5-

10 c]piridina;

1-etil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol-6-carbonitrilo;

1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol-6-carbonitrilo;

1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-6-(trifluorometil)-1H-imidazo[4,5-

15 c]piridina;

3-etil-6-metil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-6-metil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

6-cloro-1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

20 1-etil-6-metil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

1-etil-5-fluoro-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

5-cloro-1-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

3-etil-6-propil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-6-propil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

25 3,6-dietil-2-[(2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il)metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-5-fluoro-6-metil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;

1-etil-6-metil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

- 3-etil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;  
1-etil-6-isopropil-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
1-etil-6-fluoro-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol;  
5 1-etil-6-fluoro-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol;  
6-isopropil-3-propil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;  
6-isopropil-1-propil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
10 3(2-fluoroetil)-2-[(2-pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;  
3-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-isopropil-3H-imidazo[4,5-c]piridina  
1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-isopropil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
15 3-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-propil-3H-imidazo[4,5-c]piridina;  
3-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
20 1-(2-[[2-(2,5-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-il)etanona;  
1-(2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-bencimidazo[4,5-b]piridin-6-il)etanona;  
2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
25 2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

6-{1-[(1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridin-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}piridina-2-carbonitrilo;

6-{1-[(3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}piridina-2-carbonitrilo;

5 3-(2-fluoroetil)-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

2-[[2-(2-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

2-[[2-(2-clorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

3-etil-2-[[2-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

10 6-{1-[(3-etil-3H-imidazo[4,5b]piridin-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}piridina-2-carbonitrilo;

1-(2-fluoroetil)-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

3-propil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

2-[[2-(2,6-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-(2-fluoroetil)-3H-imidazo[4,5-

15 b]piridina;

6-(1-[[3-(2-fluoroetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il]metil]-1H-imidazol-2-il}piridina-2-carbonitrilo;

3-(2-fluoroetil)-2-[[2-(5-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

20 1-propil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

2-[[2-(3fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

25 2-{1-[(3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridin-2-il)metil]-1H-imidazol-2-il}benzonitrilo;

1-(1-etil-2-[[2-(1,3-tiazol-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)etanona;

2-[[2-(5-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

2-[[2-(2-fluoro-5-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

5 2-[[2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;

1-etil-2-[[2-(5-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

2-[[2-(2,6-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

10 2-[[2-(2,6-difluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-etil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

2-[[2-(5-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1-propil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[[2-(5-fluoro-2-metilfenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-3-(2,2,2-trifluoroetil)-3H-

15 imidazo[4,5-b]piridina;

1-Propil-2-(2-pirimidin-2-il-imidazol-1-ilmetil)-1H-benzoimidazol-5-carbonitrilo;

1-{1-etil-2-[[2-(pirimidin-2-il-1H-imidazol-1-il)metil]-1H-bencimidazol-5-il]etanona;

1-etil-2-[[2-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

20 1-etil-2-[[2-(3-fluorofenil)-1H-imidazol-1-il]metil]-6-metil-1H-imidazo[4,5-c]piridina;

1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-5-(morfolin-4-ilmetil)-1H-bencimidazol;

2-[[1-(3-clorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-etil-5-(morfolin-4-ilmetil)-1H-bencimidazol;

25 1-etil-5-fluoro-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-bencimidazol;

5-cloro-1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-bencimidazol;

2-[[1-(2,5-difluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;

- 2-[[1-(3-clorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-carbonitrilo;  
 1-(2-[[1-(3-clorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-etil-1H-bencimidazol-5-il)etanona;  
 1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-imidazo[4,5-c]piridina;  
 1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-bencimidazol-6-carbonitrilo;  
 5 1-(1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-bencimidazol-5-il)propan-1-  
 ona;  
 1-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-(3-fluoropropil)-1H-bencimidazol;  
 1-(2-fluoroetil)-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1H-bencimidazol;  
 10 3-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[1-(2,5-difluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-3-etil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[1-(2,5-difluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-1-propil-1H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-5-metil-3-propil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 15 3-etil-2-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-5-metil-3H-imidazo[4,5-b]piridina;  
 3-etil-2-[[1-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-5-metil-3H-imidazo[4,5-  
 b]piridina;  
 8-[[1-(3-fluorofenil)-1H-pirazol-5-il]metil]-2,9-dimetil-9H-purina;  
 9-etil-8-[[1-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-2-metil-9H-purina;  
 20 3-etil-2-[[1-(6-fluoropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina;  
 1-etil-2-[[1-(3-fluoropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-6-metil-1H-imidazo[4,5-  
 c]piridina;  
 1-etil-2-[[1-(1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-6-(trifluorometil)-1H-imidazo[4,5-  
 c]piridina;  
 25 3-etil-2-[[1-(1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil]-3H-imidazo[4,5-c]piridina; o  
 una sal farmacéuticamente aceptable de estos.

91. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 89, en donde la base es un alcóxido de metal alcalino y el solvente es un solvente aprótico polar.

5 92. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 91, en donde la base es t-BuOK.

93. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 92, en donde la base es t-BuOK y el solvente es THF.

10

94. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 89, en donde la base es un hidruro de metal y el solvente es un solvente aprótico polar.

15 95. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 94, en donde la base es hidruro de sodio y el solvente es DMF.

96. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 95, en donde se agrega yoduro de sodio.

20 97. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 95, en donde la reacción se lleva a cabo entre 0°C y temperatura ambiente.

98. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 89, en donde la base es un carbonato de metal alcalino y el solvente es un solvente aprótico polar.

25

99. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 98, en donde la base es  $K_2CO_3$ .

9/6

100. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 99, en donde la base es  $K_2CO_3$  y el solvente es DMF.

5            101. Un proceso de acuerdo a la reivindicación 100, en donde la reacción se lleva a cabo a temperatura ambiente.

967

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 80017608

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 01-109589-00010-0000

Fecha: 2007-05-17 16:58:32 Dep. 2020 NUECREACION:  
Tra. 2 PATENTES Ene: 1 REGDEPOSITO  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 68

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 35,379  
FECHA : MAYO 7 DE 2007

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE       | TIPO PAGO    | BANCO         | CUENTA      | No. PAGO | FECHA PAGO | Vr. PAGO      |
|-------------------|--------------|---------------|-------------|----------|------------|---------------|
| CAVELIER ABOGADOS | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 55800353 | 07/05/2007 | 43,849,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO                       | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|--------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-03 | CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA |                |
|       |             | 12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES  | 99,000.00      |
|       |             | TOTAL :                        | 99,000.00      |

SOM: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

6060 12889 801 002 9

968

| EXAMEN TÉCNICO DE FONDO |              |                       |            |
|-------------------------|--------------|-----------------------|------------|
| Nº Radicación           | 01109589     | Fecha de presentación | 21-12-2001 |
| Nº Prioridad            | US 60/257492 | Fecha de Prioridad    | 21-12-2000 |

|                |  |
|----------------|--|
| Palabras clave |  |
|----------------|--|

| CLASIFICACIONES INTERNACIONALES DE BÚSQUEDA |
|---------------------------------------------|
| A81K 31/4184<br>C07D 233/54                 |

| DOCUMENTOS CORRESPONDIENTES EN OTROS PAÍSES |          |
|---------------------------------------------|----------|
| WO0250062                                   | UA 75902 |
| OA 12539                                    |          |
| EP 1368342                                  |          |
| Patente Original                            |          |

| BASES DE DATOS CONSULTADAS    |
|-------------------------------|
| ESPACENET<br>EPOLINE<br>USPTO |

| INFORMES DE EXÁMENES EN OTRAS OFICINAS |       |                  |
|----------------------------------------|-------|------------------|
| Oficina                                | Fecha | Reivindicaciones |
| EUROPEA                                |       |                  |

| ANTERIORIDADES ENCONTRADAS                                                                                                |            |                            |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------|----------------------------|
| Documento                                                                                                                 | Relevancia | Reivindicaciones afectadas |
| WO 0059905<br>EP082369<br>WO8834923<br>WO8633182<br>WO0059886<br>WO 0059887<br>WO 0059888<br>WO 0078728<br>WO 0118000 (P) |            |                            |

| LITERATURA NO PATENTES |            |                 |
|------------------------|------------|-----------------|
| Documento no Patentes  | Relevancia | Relv. afectadas |
|                        |            |                 |

|               |  |
|---------------|--|
| Observaciones |  |
|---------------|--|

|                  |                     |
|------------------|---------------------|
| Fecha del examen | Art. 45: 28-12-2006 |
|------------------|---------------------|