



No. 10-041197- -00002-0000

Clarke, M

COLO

Fecha: 2010-08-04 15:36:34 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra 11 PATENTEIYII Eve 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 78

P-2520

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Ref.: Expediente No. 10.041.197
Solicitud de Patente a nombre de
TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

Yo, DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D' ALEMAN, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la Carrera 11 No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 07089 notificado por fijación en lista el día 4 de junio de 2010, atentamente me permito presentar:

1. Documentos donde consta la cesión del derecho a la patente otorgada por los inventores a favor de mi mandante. Sobre el particular, es importante resaltar que de conformidad con las normas legales vigentes, artículo 1 de la Resolución 210 de 2001, expedida por el Superintendente de Industria y Comercio y artículo 2 de la Convención de la Haya, el documento en inglés que se pretenda aportar como parte de los trámites de propiedad industrial ante la Superintendencia de Industria y Comercio no requieren traducción. Por otro lado, la legalización consular y/o diplomática de los documentos expedidos en el extranjero no es necesaria. Por lo tanto, el documento de cesión anexo a este memorial es válidamente presentado en idioma inglés y con la correspondiente apostilla.

2. En relación con el título de la solicitud informo que cambio el título de la solicitud a: **"DERIVADOS DE DIRIMIDO-DIAZEPIN COMO INHIBIDORES DE QUINASA SIMIL POLO (PLK)".**

3. Anexo formulario de modificación de la solicitud allegando nuevo juego de reivindicaciones que reemplaza el inicialmente presentado y el recibo de la tasa de modificación correspondiente.

Espero con esto haber dado cabal cumplimiento a lo solicitado por ese despacho y de conformidad con lo indicado en los artículos 3º, inciso 3, 35 inciso 2 y 59 inciso 2 del CCA, al analizar este memorial, atentamente ruego se traten todas las cuestiones planteadas con motivo del mismo.

Señor Superintendente,

DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D' ALEMAN
C.C. 41.654.882 de Bogotá.
T.P. 20824 CSJ

A34

P. 2520

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: United States of America

This public document

2. has been signed by T. Wallace

3. acting in the capacity of Certifying Officer

4. bears the seal/stamp of U.S. Patent and Trademark Office

Certified

5. at Washington, D.C.

6. the fourth of May, 2010

7. by ~~Assistant~~ Authentication Officer, United States Department of State

8. No. 10023384-2

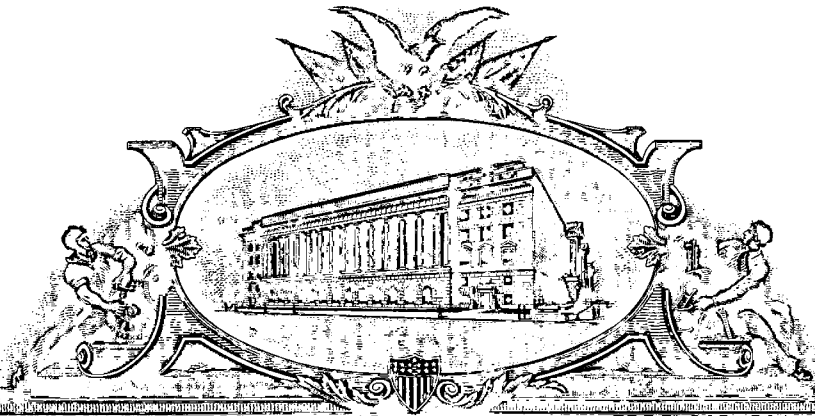
9. Seal/Stamp:

10. Signature:

Denitra T. Hawkins

Denitra T. Hawkins

735
2



UNITED STATES OF AMERICA

TO ALL TO WHOM THESE PRESENTS SHALL COME:

UNITED STATES DEPARTMENT OF COMMERCE

United States Patent and Trademark Office

April 14, 2010

THIS IS TO CERTIFY THAT ANNEXED IS A TRUE COPY FROM THE
RECORDS OF THIS OFFICE OF A DOCUMENT RECORDED ON
DECEMBER 11, 2008.

By Authority of the
Under Secretary of Commerce for Intellectual Property
and Director of the United States Patent and Trademark Office



T. Wallace
T. WALLACE

Certifying Officer

PATENT ASSIGNMENT

Electronic Version v1.1

Stylesheet Version v1.1

SUBMISSION TYPE:

NEW ASSIGNMENT

NATURE OF CONVEYANCE:

ASSIGNMENT

CONVEYING PARTY DATA

Name

Execution Date

Takashi Ichikawa

11/25/2008

RECEIVING PARTY DATA

Name:

Takeda San Diego, Inc.

Street Address:

10410 Science Center Drive

City:

San Diego

State/Country:

CALIFORNIA

Postal Code:

92121

PROPERTY NUMBERS Total: 1

Property Type

Number

Application Number:

12237306

CORRESPONDENCE DATA

Fax Number: (858)550-0992

Correspondence will be sent via US Mail when the fax attempt is unsuccessful.

Phone: (858) 622-8528

Email: mrussell@takedasd.com

Correspondent Name: Takeda San Diego, Inc.

Address Line 1: 10410 Science Center Drive

Address Line 4: San Diego, CALIFORNIA 92121

ATTORNEY DOCKET NUMBER:

PLK-5010-US

NAME OF SUBMITTER:

David Stemerick

Total Attachments: 2

source=PLK-5010-US_Assignment_02_Ichikawa-TSD_2008-12-11#page1.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_02_Ichikawa-TSD_2008-12-11#page2.tif

CH \$40.00 12237306

500728371

PATENT
REEL: 021966 FRAME: 07903 287
4

ASSIGNMENT OF PATENT APPLICATION

WHEREAS, I TAKASHI ICHIKAWA, a citizen of Japan, (hereinafter referred to as "ASSIGNOR"), have invented a certain invention entitled POLO-LIKE KINASE INHIBITORS for which an application for Letters Patent of the United States of America has been filed with the U.S. Patent and Trademark Office on September 24, 2008 and assigned Application Serial No. 12/237,306; and

WHEREAS, **TAKEDA SAN DIEGO, INC.**, a corporation organized and existing under and by virtue of the laws of the **State of Delaware** and having its place of business at **10410 Science Center Drive, San Diego, California 92121** (hereinafter referred to as "ASSIGNEE"), is desirous of acquiring the exclusive right, title and interest in, to and under said invention and in, to and under any Patent or similar legal protection to be obtained therefor in the United States of America, its territorial possessions and in any and all countries foreign thereto.

NOW, THEREFORE, for good and valuable consideration, the receipt of which is hereby acknowledged, ASSIGNOR hereby sell, assign, transfer and set over unto the said ASSIGNEE, its successors and assigns, the full and exclusive right, title and interest to said invention and to all Letters Patent or application or similar legal protection, not only in the United States and its territorial possessions, but in all countries foreign thereto to be obtained for said invention by said application, and to any continuation, division, renewal, substitute or reissue thereof or any legal equivalent thereof in the United States or a foreign country for the full term or terms for which the same may be granted, including all priority rights under the International Convention; and ASSIGNOR hereby authorize and request the United States Commissioner of Patents and Trademarks and any officials of foreign countries whose duty it is to issue patents or any legal equivalent thereof to said ASSIGNEE, its successors and assigns, in accordance with this Assignment.

ASSIGNOR hereby covenant that no assignment, sale, agreement or encumbrance has been or will be made or entered into which would conflict with this Agreement.

ASSIGNOR further covenant that ASSIGNEE will, upon its request, be provided promptly with all pertinent facts and documents relating to said application, said invention and said Letters Patent and legal equivalents as may be known and accessible to ASSIGNOR and will testify as to the same in any interference or litigation related thereto and will promptly execute and deliver to ASSIGNEE or its legal representative any and all papers, instruments or affidavits required to apply for, obtain, maintain, issue and enforce said application, said invention and said Letters Patent and said equivalents in the United States or in any foreign country, which may be necessary or desirable to carry out the purposes thereof.

WITNESS my hand at Tokyo, Japan, this 25th day of November, 2008.


TAKASHI ICHIKAWA

PATENT ASSIGNMENT

Electronic Version v1.1
Stylesheet Version v1.1

SUBMISSION TYPE:	NEW ASSIGNMENT
NATURE OF CONVEYANCE:	ASSIGNMENT
CONVEYING PARTY DATA	
Name	Execution Date
Takeda San Diego, Inc.	12/11/2008
RECEIVING PARTY DATA	
Name:	Takeda Pharmaceutical Company Limited
Street Address:	1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi
City:	Osaka
State/Country:	JAPAN
Postal Code:	541-0045
PROPERTY NUMBERS Total: 1	
Property Type	Number
Application Number:	12237306
CORRESPONDENCE DATA	
Fax Number:	(858)550-0992
<i>Correspondence will be sent via US Mail when the fax attempt is unsuccessful.</i>	
Phone:	(858) 622-8528
Email:	mrussell@takedasd.com
Correspondent Name:	Takeda San Diego, Inc.
Address Line 1:	10410 Science Center Drive
Address Line 4:	San Diego, CALIFORNIA 92121
ATTORNEY DOCKET NUMBER:	PLK-5010-US
NAME OF SUBMITTER:	David Stermerick
Total Attachments: 2 source=PLK-5010-US_Assignment_03_TSD-TPC_2008-12-11#page1.tif source=PLK-5010-US_Assignment_03_TSD-TPC_2008-12-11#page2.tif	

CH \$40.00 12237306

500728413

PATENT
REEL: 021966 FRAME: 0927740
7

ASSIGNMENT OF PATENT APPLICATION

TAKEDA SAN DIEGO, INC., a corporation organized and existing under and by virtue of the laws of the State of Delaware and having its place of business at 10410 Science Center Drive, San Diego, California 92121 (hereinafter referred to as "ASSIGNOR") invented a certain invention entitled POLO-LIKE KINASE INHIBITORS for which an application for Letters Patent of the United States of America was filed with the U.S. Patent and Trademark Office on September 24, 2008 and assigned U.S. Application Serial No. 12/237,306.

TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED, a Japanese corporation having its principal office at 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045 JAPAN (hereinafter referred to as "ASSIGNEE"), is desirous of acquiring the exclusive right, title and interest in, to and under said invention and in, to and under any Patent or similar legal protection to be obtained therefor in the United States of America, its territorial possessions and in any and all countries foreign thereto.

NOW, THEREFORE, for good and valuable consideration, the receipt of which is hereby acknowledged, ASSIGNOR hereby sells, assigns, transfers and sets over unto the said ASSIGNEE, its successors and assigns, the full and exclusive right, title and interest to said invention and to all Letters Patent or application or similar legal protection, not only in the United States and its territorial possessions, but in all countries foreign thereto to be obtained for said invention by said application, and to any continuation, division, renewal, substitute or reissue thereof or any legal equivalent thereof in the United States or a foreign country for the full term or terms for which the same may be granted, including all priority rights under the International Convention; and ASSIGNOR hereby authorizes and requests the United States Commissioner of Patents and Trademarks and any officials of foreign countries whose duty it is to issue patents or any legal equivalent thereof to said ASSIGNEE, its successors and assigns, in accordance with this Assignment.

ASSIGNOR hereby covenants that no assignment, sale, agreement or encumbrance has been or will be made or entered into which would conflict with this Agreement.

ASSIGNOR further covenants that ASSIGNEE will, upon its request, be provided promptly with all pertinent facts and documents relating to said application, said invention and said Letters Patent and legal equivalents as may be known and accessible to ASSIGNOR and will testify as to the same in any interference or litigation related thereto and will promptly execute and deliver to ASSIGNEE or its legal representative any and all papers, instruments or affidavits required to apply for, obtain, maintain, issue and enforce said application, said invention and said Letters Patent and said equivalents in the United States or in any foreign country, which may be necessary or desirable to carry out the purposes thereof.

WITNESS my hand at San Diego, California, this 11 day of December, 2008.

TAKEDA SAN DIEGO, INC.

Signed: David Weitz

Name: David J. Weitz

Title: Senior Vice President
U.S. Intellectual Property Department
and General Counsel

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: United States of America

This public document

2. has been signed by P.R. Grant

3. acting in the capacity of Certifying Officer

4. bears the seal/stamp of U.S. Patent and Trademark Office

Certified

5. at Washington, D.C.

6. the fourth of May, 2010

7. by ~~Assistant~~ Authentication Officer, United States Department of State

8. No. 10023384-3

9. Seal/Stamp:

10. Signature:

Denitra T. Hawkins

Denitra T. Hawkins

A 7234253



THE UNITED STATES OF AMERICA

TO ALL TO WHOM THESE PRESENTS SHALL COME:

UNITED STATES DEPARTMENT OF COMMERCE

United States Patent and Trademark Office

April 15, 2010

**THIS IS TO CERTIFY THAT ANNEXED IS A TRUE COPY FROM THE
RECORDS OF THIS OFFICE OF A DOCUMENT RECORDED ON
DECEMBER 11, 2008.**

**By Authority of the
Under Secretary of Commerce for Intellectual Property
and Director of the United States Patent and Trademark Office**



P. R. Grant

P. R. GRANT
Certifying Officer

PATENT ASSIGNMENT

Electronic Version v1.1
 Stylesheet Version v1.1

SUBMISSION TYPE:	NEW ASSIGNMENT
NATURE OF CONVEYANCE:	ASSIGNMENT

CONVEYING PARTY DATA

Name	Execution Date
Sheldon X. Cao	10/22/2008
Victoria Feher	10/28/2008
Benjamin Jones	10/29/2008
Andre A. Kiryanov	10/22/2008
Stephen W. Kaldor	10/23/2008
Betty Lam	10/29/2008
Christopher McBride	10/15/2008
Zhe Nie	11/03/2008
Jeffrey A. Stafford	11/03/2008
Yan Liu	11/18/2008
Srinivasa Reddy Natala	11/30/2008

RECEIVING PARTY DATA

Name:	Takeda San Diego, Inc.
Street Address:	10410 Science Center Drive
City:	San Diego
State/Country:	CALIFORNIA
Postal Code:	92121

PROPERTY NUMBERS Total: 1

Property Type	Number
Application Number:	12237306

CORRESPONDENCE DATA

Fax Number: (858)550-0992
Correspondence will be sent via US Mail when the fax attempt is unsuccessful.
 Phone: (858) 622-8528
 Email: mrussell@takedasd.com
 Correspondent Name: Takeda San Diego, Inc.

500728351

PATENT
REEL: 021966 FRAME: 0721

CH \$40.00 12237306

3
12

Address Line 1: 10410 Science Center Drive
Address Line 4: San Diego, CALIFORNIA 92121

ATTORNEY DOCKET NUMBER:

PLK-5010-US

NAME OF SUBMITTER:

David Stermerick

Total Attachments: 5

source=PLK-5010-US_Assignment_01_Inventors-TSD_2008-12-11#page1.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_01_Inventors-TSD_2008-12-11#page2.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_01_Inventors-TSD_2008-12-11#page3.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_01_Inventors-TSD_2008-12-11#page4.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_01_Inventors-TSD_2008-12-11#page5.tif

PATENT
REEL: 021966 FRAME: 0722

ASSIGNMENT OF PATENT APPLICATION

WHEREAS, WE SHELDON X. CAO, a citizen of United States of America, VICTORIA FEHER, a citizen of United States of America, TAKASHI ICHIKAWA, a citizen of Japan, BENJAMIN JONES, a citizen of United States of America, STEPHEN W. KALDOR, a citizen of United States of America, ANDRE A. KIRYANOV, a citizen of United States of America, BETTY LAM, a citizen of United States of America, Yan LIU, a citizen of United States of America, CHRISTOPHER MCBRIDE, a citizen of United States of America, SRINIVASA REDDY NATALA, a citizen of India, ZHE NIE, a citizen of China, and JEFFREY A. STAFFORD, a citizen of United States of America, (hereinafter referred to as "ASSIGNORS"), have invented a certain invention entitled POLO-LIKE KINASE INHIBITORS for which an application for Letters Patent of the United States of America has been filed with the U.S. Patent and Trademark Office on September 24, 2008 and assigned Application Serial No. 12/237,306; and

WHEREAS, **TAKEDA SAN DIEGO, INC.**, a corporation organized and existing under and by virtue of the laws of the **State of Delaware** and having its place of business at **10410 Science Center Drive, San Diego, California 92121** (hereinafter referred to as "ASSIGNEE"), is desirous of acquiring the exclusive right, title and interest in, to and under said invention and in, to and under any Patent or similar legal protection to be obtained therefor in the United States of America, its territorial possessions and in any and all countries foreign thereto.

NOW, THEREFORE, for good and valuable consideration, the receipt of which is hereby acknowledged, ASSIGNORS hereby sell, assign, transfer and set over unto the said ASSIGNEE, its successors and assigns, the full and exclusive right, title and interest to said invention and to all Letters Patent or application or similar legal protection, not only in the United States and its territorial possessions, but in all countries foreign thereto to be obtained for said invention by said application, and to any continuation, division, renewal, substitute or reissue thereof or any legal equivalent thereof in the United States or a foreign country for the full term or terms for which the

same may be granted, including all priority rights under the International Convention; and ASSIGNORS hereby authorize and request the United States Commissioner of Patents and Trademarks and any officials of foreign countries whose duty it is to issue patents or any legal equivalent thereof to said ASSIGNEE, its successors and assigns, in accordance with this Assignment.

ASSIGNORS hereby covenant that no assignment, sale, agreement or encumbrance has been or will be made or entered into which would conflict with this Agreement.

ASSIGNORS further covenant that ASSIGNEE will, upon its request, be provided promptly with all pertinent facts and documents relating to said application, said invention and said Letters Patent and legal equivalents as may be known and accessible to ASSIGNORS and will testify as to the same in any interference or litigation related thereto and will promptly execute and deliver to ASSIGNEE or its legal representative any and all papers, instruments or affidavits required to apply for, obtain, maintain, issue and enforce said application, said invention and said Letters Patent and said equivalents in the United States or in any foreign country, which may be necessary or desirable to carry out the purposes thereof.

WITNESS my hand at San Diego, California, this 22nd day of October, 2008.

Sheldon X. Cao
SHELDON X. CAO

WITNESS my hand at San Diego, California, this 28 day of October, 2008.

Victoria Feher
VICTORIA FEHER

WITNESS my hand at _____, this _____ day of October, 2008.

TAKASHI ICHIKAWA

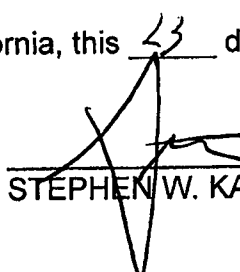
WITNESS my hand at San Diego, California, this _____ day of October, 2008.

BENJAMIN JONES

WITNESS my hand at San Diego, California, this _____ day of October, 2008.

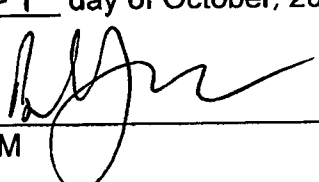
ANDRE A. KIRYANOV

WITNESS my hand at San Diego, California, this 23 day of October, 2008.



STEPHEN W. KALDOR

WITNESS my hand at San Diego, California, this 29 day of October, 2008.

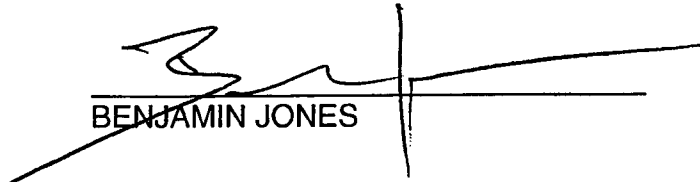


BETTY LAM

WITNESS my hand at _____, this _____ day of October, 2008.

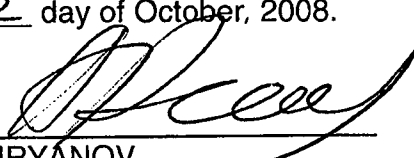
TAKASHI ICHIKAWA

WITNESS my hand at San Diego, California, this 29 day of October, 2008.



BENJAMIN JONES

WITNESS my hand at San Diego, California, this 22 day of October, 2008.

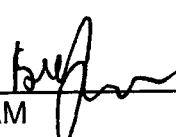


ANDRE A. KIRYANOV

WITNESS my hand at San Diego, California, this _____ day of October, 2008.

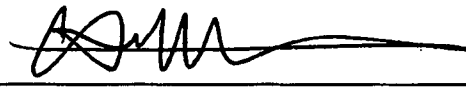
STEPHEN W. KALDOR

WITNESS my hand at San Diego, California, this 29 day of October, 2008.



BETTY LAM

WITNESS my hand at San Diego, California, this 15th day of October, 2008.


CHRISTOPHER MCBRIDE

WITNESS my hand at San Diego, California, this 30 day of October, 2008.


SRINIVASA REDDY NATALA

WITNESS my hand at San Diego, California, this 03 day of ^{November}~~October~~, 2008.


ZHE NIE

WITNESS my hand at San Diego, California, this 03 day of ^{November}~~October~~, 2008.


JEFFREY A. STAFFORD

WITNESS my hand at San Diego, California, this 18 day of ^{November}~~October~~, 2008.


YAN LIU

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: United States of America

This public document

2. has been signed by T. Wallace

3. acting in the capacity of Certifying Officer

4. bears the seal/stamp of U.S. Patent and Trademark Office

Certified

5. at Washington, D.C.

6. the fourth of May, 2010

7. by ~~Assistant~~ Authentication Officer, United States Department of State

8. No. 10023384-1

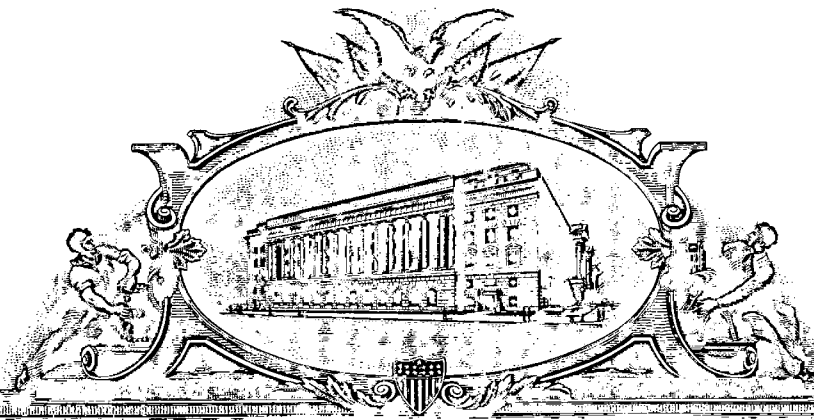
9. Seal/Stamp:

10. Signature:

Denitra T. Hawkins

Denitra T. Hawkins

A 7234253



THE UNITED STATES OF AMERICA

TO ALL TO WHOM THESE PRESENTS SHALL COME:

UNITED STATES DEPARTMENT OF COMMERCE

United States Patent and Trademark Office

April 14, 2010

**THIS IS TO CERTIFY THAT ANNEXED IS A TRUE COPY FROM THE
RECORDS OF THIS OFFICE OF A DOCUMENT RECORDED ON
DECEMBER 11, 2008.**

By Authority of the

**Under Secretary of Commerce for Intellectual Property
and Director of the United States Patent and Trademark Office**



T. Wallace
T. WALLACE

Certifying Officer

PATENT ASSIGNMENT

Electronic Version v1.1

Stylesheet Version v1.1

SUBMISSION TYPE:

NEW ASSIGNMENT

NATURE OF CONVEYANCE:

ASSIGNMENT

CONVEYING PARTY DATA

Name

Execution Date

Takeda San Diego, Inc.

12/11/2008

RECEIVING PARTY DATA

Name:

Takeda Pharmaceutical Compay Limited

Street Address:

1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi

City:

Osaka

State/Country:

JAPAN

Postal Code:

541-0045

PROPERTY NUMBERS Total: 1

Property Type

Number

Application Number:

12237306

CORRESPONDENCE DATA

Fax Number: (858)550-0992

Correspondence will be sent via US Mail when the fax attempt is unsuccessful.

Phone: (858) 622-8528

Email: mrussell@takedasd.com

Correspondent Name: Takeda San Diego, Inc.

Address Line 1: 10410 Science Center Drive

Address Line 4: San Diego, CALIFORNIA 92121

ATTORNEY DOCKET NUMBER:

PLK-5010-US

NAME OF SUBMITTER:

David Stemerick

Total Attachments: 2

source=PLK-5010-US_Assignment_03_TSD-TPC_2008-12-11#page1.tif

source=PLK-5010-US_Assignment_03_TSD-TPC_2008-12-11#page2.tif

CH \$40.00 12237306

500728413

PATENT
REEL: 021966 FRAME: 0927

3

21

ASSIGNMENT OF PATENT APPLICATION

TAKEDA SAN DIEGO, INC., a corporation organized and existing under and by virtue of the laws of the State of Delaware and having its place of business at 10410 Science Center Drive, San Diego, California 92121 (hereinafter referred to as "ASSIGNOR") invented a certain invention entitled POLO-LIKE KINASE INHIBITORS for which an application for Letters Patent of the United States of America was filed with the U.S. Patent and Trademark Office on September 24, 2008 and assigned U.S. Application Serial No. 12/237,306.

TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED, a Japanese corporation having its principal office at 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045 JAPAN (hereinafter referred to as "ASSIGNEE"), is desirous of acquiring the exclusive right, title and interest in, to and under said invention and in, to and under any Patent or similar legal protection to be obtained therefor in the United States of America, its territorial possessions and in any and all countries foreign thereto.

NOW, THEREFORE, for good and valuable consideration, the receipt of which is hereby acknowledged, ASSIGNOR hereby sells, assigns, transfers and sets over unto the said ASSIGNEE, its successors and assigns, the full and exclusive right, title and interest to said invention and to all Letters Patent or application or similar legal protection, not only in the United States and its territorial possessions, but in all countries foreign thereto to be obtained for said invention by said application, and to any continuation, division, renewal, substitute or reissue thereof or any legal equivalent thereof in the United States or a foreign country for the full term or terms for which the same may be granted, including all priority rights under the International Convention; and ASSIGNOR hereby authorizes and requests the United States Commissioner of Patents and Trademarks and any officials of foreign countries whose duty it is to issue patents or any legal equivalent thereof to said ASSIGNEE, its successors and assigns, in accordance with this Assignment.

ASSIGNOR hereby covenants that no assignment, sale, agreement or encumbrance has been or will be made or entered into which would conflict with this Agreement.

ASSIGNOR further covenants that ASSIGNEE will, upon its request, be provided promptly with all pertinent facts and documents relating to said application, said invention and said Letters Patent and legal equivalents as may be known and accessible to ASSIGNOR and will testify as to the same in any interference or litigation related thereto and will promptly execute and deliver to ASSIGNEE or its legal representative any and all papers, instruments or affidavits required to apply for, obtain, maintain, issue and enforce said application, said invention and said Letters Patent and said equivalents in the United States or in any foreign country, which may be necessary or desirable to carry out the purposes thereof.

WITNESS my hand at San Diego, California, this 11 day of December, 2008.

TAKEDA SAN DIEGO, INC.

Signed: David J. Weitz

Name: David J. Weitz

Title: Senior Vice President
U.S. Intellectual Property Department
and General Counsel



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de error material

☒

Modificación a una solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: TAKEDA PHARMACEUTICAL
COMPANY LIMITED

Dirección: 1-1- Doshomachi 4-chome, Chuo-ku,
Osaka-shi, Osaka 541-0045, Japón

Nacionalidad o domicilio: Osaka-shi, Osaka,
Japón

Lugar de Constitución: Japón

Teléfono:
E-mail

Fax:

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)

Nombre: DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

Dirección: CRA.11 No. 68-53 Piso 6

Teléfono: 6 18 10 88 Fax: 6 35 08 24

E-mail: Clarkemodet@clarkemodet.com.co

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 41.654.882
TP 20824 CSJ

Número del expediente: 10.041.197

5 Descripción de la corrección o modificación solicitada: Que se anote: Se reemplaza el capítulo reivindicatorio de 38 reivindicaciones originalmente presentado por un nuevo juego de reivindicaciones en donde se cancelan las antiguas cláusulas 36 y 37 referentes a uso y la reivindicación 38 dirigida a un método de tratamiento.

6 Comprobante de pago No. 10-52.411

Fecha 29 de junio de 2010

7 Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa

☐

Poderes si fuese el caso

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean Personas jurídicas.

8

NOMBRE DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

FIRMA

C.C. 41.654.882 T.P. 20824 CSJ

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 52,411
FECHA : JUNIO 29 DE 2010

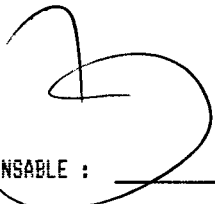
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CLARKE MODET	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325811511	28/06/2010	85,900,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LENAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

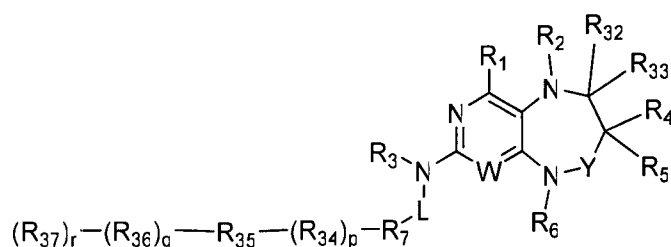
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

760
P-2520
25

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula

5



y las sales del mismo farmacéuticamente aceptables,,

10

caracterizado porque

W se selecciona del grupo que consiste de CR₈ y N;

Y es -(CR₉R₁₀)_n-;

n se selecciona del grupo que consiste de 1, 2, 3 y 4;

L está ausente o es un enlazante que proporciona una separación de 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos entre R₇ y el nitrógeno al cual se unen, en donde los átomos del enlazante que proporciona la separación se seleccionan del grupo que consiste de carbono, oxígeno, nitrógeno y azufre;

15

20

R₁ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, tio, hidroxilo, carbonilo, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo,

25

hidroxilo(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₃)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo, sulfonil(C₁₋₃)alquilo, sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,

- heteroaril (C₁₋₅) alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₈₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
5 hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
- R₂ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
carbonilo, oxicarbonil sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋
10 10), halo (C₁₋₁₀) alquilo, carbonil (C₁₋₃) alquilo,
tiocarbonil (C₁₋₃) alquilo, sulfonil (C₁₋₃) alquilo,
sulfinil (C₁₋₃) alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
imino (C₁₋₃) alquilo, (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
15 heteroaril (C₁₋₅) alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₈₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, (C₃₋₁₂) cicloalquilo,
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
20 hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido, o R₂ y R₁ o R₁₄ se toman conjuntamente para
formar un anillo sustituido o insustituido;
- R₃ es hidrógeno o un sustituyente convertible in vivo a
hidrógeno;
- 25 R₄ es halo;
- R₅ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxí, carboniloxi,
alcoxi de (C₁₋₁₀), ariloxi de (C₄₋₁₂), hetero (C₁₋₁₀) ariloxi,
carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino

(C₁₋₁₀), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo,
 alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo,
 carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
 sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, azaalquilo
 5 (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo,
 (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
 hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
 (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
 10 hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
 hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
 hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
 hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
 15 insustituido;
 R₆ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
 carbonilo, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀),
 halo(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₃)alquilo,
 tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo, sulfonil(C₁₋₃)alquilo,
 20 sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
 imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
 heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
 hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
 25 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
 hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
 hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
 hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
 insustituido;

- R_7 se selecciona del grupo que consiste de cicloalquilo (C_{3-12}), hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}), hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;
- R_8 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo, carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo, carbonil(C_{1-3})alquilo, tiocarbonil(C_{1-3})alquilo, sulfonil(C_{1-3})alquilo, sulfinil(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo, aril(C_{1-10})alquilo, heteroaril(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{8-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}), hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}), hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;
- R_9 y R_{10} son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo, carboniloxi, alcoxi de (C_{1-10}), ariloxi de (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})ariloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo, alquilo

(C₁₋₁₀), halo (C₁₋₁₀) alquilo, hidroxil (C₁₋₁₀) alquilo,
 carbonil (C₁₋₁₀) alquilo, tiocarbonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 sulfonil (C₁₋₁₀) alquilo, sulfinil (C₁₋₁₀) alquilo,
 (C₁₋₁₀) azaalquilo, imino (C₁₋₁₀) alquilo,
 5 (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₁₀) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
 hetero (C₁₋₁₀) aril (C₁₋₅) alquilo,
 (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
 10 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
 hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
 hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
 hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
 insustituido, o R₉ y R₁₀ se toman conjuntamente con el
 15 carbono al cual se unen para formar C=O, C=S, C=NR₁₁ o
 C=CR₁₂R₁₃;
 R₁₁ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
 sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo (C₁₋₁₀) alquilo,
 hidroxil (C₁₋₁₀) alquilo, carbonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 20 tiocarbonil (C₁₋₁₀) alquilo, sulfonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 sulfinil (C₁₋₁₀) alquilo, aza (C₁₋₁₀) alquilo,
 imino (C₁₋₁₀) alquilo, (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₁₀) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
 hetero (C₁₋₁₀) aril (C₁₋₅) alquilo,
 25 (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, hetero (C₁₋₁₀) alquilo,
 cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo,
 bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo
 (C₄₋₁₂), hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y

hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano,

5 oxicarbonilo, amido, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, aza(C₁₋₁₀)alquilo, oxaalquilo (C₁₋₁₀), oxoalquilo (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo,

10 (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,

hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo, 15 cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;

20 R₁₄ se selecciona del grupo que consiste de alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, aza(C₁₋₁₀)alquilo, imino(C₁₋₁₀)alquilo,

25 (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo,

(C₃₋₁₂)cicloalquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo,
bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
5 insustituido;

R₃₂ y R₃₃ se toman conjuntamente para formar X, o R₃₂ y R₃₃
son cada uno independientemente seleccionados del grupo
que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano, tio, oxi,
hidroxi, carboniloxi, alcoxi (C₁₋₁₀), ariloxi (C₄₋₁₂),
10 hetero(C₁₋₁₀)ariloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido,
amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido, imino,
sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo,
hidroxi(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo,
15 sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, aza(C₁₋₁₀)alquilo, oxaalquilo
(C₁₋₁₀), oxoalquilo (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo,
(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
20 (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo,
cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo,
bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
25 hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido; y

X se selecciona del grupo que consiste de C-R₄₀, NR₁₄, O,
y S,
o cualquiera de dos R₂, R₅, R₆, R₉, R₁₀ R₃₂ y R₃₃ se toman

conjuntamente para formar un anillo sustituido o insustituido;

p se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;

R₃₄ se selecciona del grupo que consiste de -CONJ₃₄ -, -NJ₃₄ CO -, -NJ₃₄ -, -SO₂NJ₃₄ -, -NJ₃₄ SO₂-,

J₃₄ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo (C₁₋₄);

R₃₅ se selecciona del grupo que consiste de amino, arilo (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, cicloalquilo (C₃₋₈),

hetero(C₃₋₆)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₇₋₁₂),

hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, cada uno sustituido o insustituido;

q se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;

R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de alquilo (C₁₋₄), azaalquilo (C₁₋₄), cicloalquilo (C₃₋₈), hetero(C₃₋₈)cicloalquilo, cada uno sustituido o insustituido;

r se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;

R₃₇ es cicloalquilo (C₃₋₈) opcionalmente sustituido, cuando R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de alquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido y azaalquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido;

R₃₇ es alquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido, cuando R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de cicloalquilo (C₃₋₈) opcionalmente sustituido y hetero(C₃₋₈)cicloalquilo opcionalmente sustituido; y

R₄₀ se selecciona del grupo que consiste de dihidrógeno, halo, nitro, ciano, alcoxi (C₁₋₁₀), y alquilo (C₁₋₁₀); y excluyendo el compuesto 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-

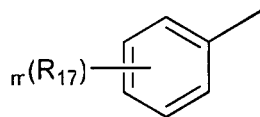
b] [1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida.

2. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque p es 0 y R_{32} y R_{33} se toman conjuntamente para formar X.

3. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, caracterizado porque n es 1 y R_9 y R_{10} son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halo, y alquilo (C_{1-10}) opcionalmente sustituido.

4. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque W es N.

5. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque R_7 es



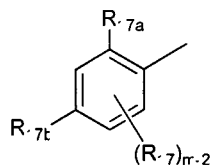
en donde

m se selecciona del grupo que consiste de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; y

cada R_{17} se selecciona independientemente del grupo que consiste de halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxil, carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi, carbamoiloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, carboxiamino, ureido, imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxil(C_{1-10})alquilo, carbonil(C_{1-3})alquilo, tiocarbonil(C_{1-3})alquilo, sulfonil(C_{1-3})alquilo, sulfinil(C_{1-3})alquilo, azaalquilo

(C₁₋₁₀), imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
5 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido, o dos R₁₇ se toman conjuntamente para
10 formar un anillo sustituido o insustituido.

6. Un compuesto de conformidad con cualquiera de
las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque R₇ es



15

en donde

m se selecciona del grupo que consiste de 2, 3, 4 y 5;

R_{17a} y R_{17b} son cada uno independientemente seleccionados

del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano,

20

tio, oxi, hidroxilo, carboniloxi, alcoxi, ariloxi,

heteroariloxi, carbamoiloxi, carbonilo, oxicarbonilo,

amido, amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido,

carboxiamino, ureido, imino, sulfonilo, aminosulfonilo,

sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo,

25

hidroxilo(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₃)alquilo,

tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo, sulfonil(C₁₋₃)alquilo,

sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),

imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,

hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,

770

- heteroaril (C₁₋₅) alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₈₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
5 hetero (C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero (C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
cada R₁₇ se selecciona independientemente del grupo que
consiste de halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo,
10 carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi,
carbamoiloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino,
alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido, carboxiamino, ureido,
imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo
(C₁₋₁₀), halo (C₁₋₁₀) alquilo, hidroxilo (C₁₋₁₀) alquilo,
15 carbonil (C₁₋₃) alquilo, tiocarbonil (C₁₋₃) alquilo,
sulfonil (C₁₋₃) alquilo, sulfinil (C₁₋₃) alquilo, azaalquilo
(C₁₋₁₀), imino (C₁₋₃) alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₃₋₁₂)cicloalquil (C₁₋₅) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
heteroaril (C₁₋₅) alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
20 hetero (C₈₋₁₂)bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero (C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero (C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
25 insustituido.

7. Un compuesto de conformidad con la
reivindicación 6, caracterizado porque

R₄ y R₅ son fluoro;

R_{17a} se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,

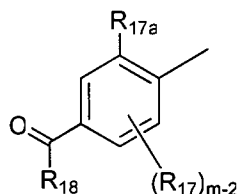
halo, y alcoxi;

R_{17b} se selecciona del grupo que consiste de amido; y

R_{17} es halo.

8. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque R_7 es

10



15

20

25

m se selecciona del grupo que consiste de 2, 3, 4 y 5;
 cada R_{17} se selecciona independientemente del grupo que
 consiste de halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxii,
 carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi,
 carbamoiloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino,
 alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, carboxiamino, ureido,
 imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo
 (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxii(C_{1-10})alquilo,
 carbonil(C_{1-3})alquilo, tiocarbonil(C_{1-3})alquilo,
 sulfonil(C_{1-3})alquilo, sulfinil(C_{1-3})alquilo, azaalquilo
 (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo,
 hetero(C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo, aril(C_{1-10})alquilo,
 heteroaril(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo,
 hetero(C_{8-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}),
 hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}),
 hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}),
 hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y
 hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o

insustituido, o dos R_{17} se toman conjuntamente para formar un anillo sustituido o insustituido; y

R_{17a} se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo, carbonilo, alcoxilo, ariloxilo, heteroariloxilo, carbamoiloxilo, carbonilo,

5 oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, carboxiamino, ureido, imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo,

10 carbonilo(C_{1-3})alquilo, tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfonilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, arilo(C_{1-10})alquilo, heteroarilo(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo,

15 hetero(C_{8-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}), hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}), hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o

20 insustituido;

cada R_{17} se selecciona independientemente del grupo que consiste de halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo, carbonilo, alcoxilo, ariloxilo, heteroariloxilo, carbamoiloxilo, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino,

25 alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, carboxiamino, ureido, imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo, carbonilo(C_{1-3})alquilo, tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfonilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo

(C₁₋₁₀), imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
5 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido; y

10 R₁₈ se selecciona del grupo que consiste de hidroxí,
alcoxi, y amino.

9. Un compuesto de conformidad con la
reivindicación 8, caracterizado porque

R₄ y R₅ son fluoro;

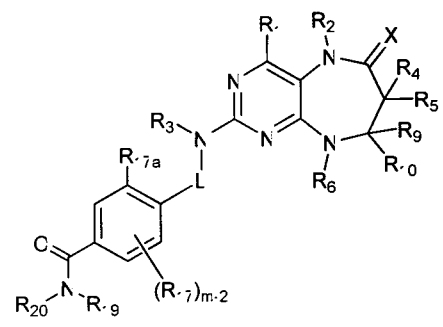
15 R_{17a} se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
halo, y alcoxi;

R_{17b} se selecciona del grupo que consiste de amido; y

R₁₇ es halo.

10. Un compuesto de la fórmula

20



25 las sales del mismo farmacéuticamente aceptable,
caracterizado porque

L está ausente o es un enlazante que proporciona una
separación de 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos entre R₇ y el
nitrógeno al cual se unen, en donde los átomos del

enlazante que proporciona la separación se seleccionan del grupo que consiste de carbono, oxígeno, nitrógeno y azufre;

5 R_1 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, tio, hidroxilo, carbonilo, alcoxilo, ariloxilo, heteroariloxilo, carbonilo, oxycarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, imino, sulfinilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo, carbonilo(C_{1-3})alquilo, 10 tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, aril(C_{1-10})alquilo, heteroaril(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, 15 hetero(C_{8-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}), hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}), hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o 20 insustituido;

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, carbonilo, oxycarbonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, carbonilo(C_{1-3})alquilo, tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, 25 sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, aril(C_{1-10})alquilo, heteroaril(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{8-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}),

- hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
5 insustituido, o R₂ y R₁ o R₁₄ se toman conjuntamente para
formar un anillo sustituido o insustituido;
R₃ es hidrógeno o un sustituyente convertible *in vivo* a
hidrógeno;
R₄ es halo;
- 10 R₅ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxí, carbonilo, oxi,
alcoxi (C₁₋₁₀), ariloxi (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)ariloxi,
carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino
(C₁₋₁₀), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo,
15 alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxí(C₁₋₁₀)alquilo,
carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, azaalquilo
(C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo,
(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
- 20 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
(C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
- 25 hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
R₆ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,

carbonilo, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀),
halo(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₃)alquilo,
tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo, sulfonil(C₁₋₃)alquilo,
sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
5 imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
10 hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
R₇ se selecciona del grupo que consiste de
15 (C₃₋₁₂)cicloalquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo,
bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
20 R₉ y R₁₀ son cada uno independientemente seleccionados
del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano,
tio, oxi, hidroxio, carboniloxi, alcoxi (C₁₋₁₀), ariloxi
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)ariloxi, carbonilo, oxicarbonilo,
amido, amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido, imino,
25 sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo,
hidroxio(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo,
sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
imino(C₁₋₁₀)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,

- hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
(C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
5 hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido, o R₉ y R₁₀ se toman conjuntamente con el
10 carbono al cual se unen para formar C=O, C=S, C=NR₁₁ o
C=CR₁₂R₁₃;
R₁₁ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo,
carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
15 sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo,
aza(C₁₋₁₀)alquilo, imino(C₁₋₁₀)alquilo,
(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
20 (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo,
cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo,
bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
25 hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente seleccionados
del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano,
oxicarbonilo, amido, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo,

- hidroxil (C₁₋₁₀) alquilo, carbonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 tiocarbonil (C₁₋₁₀) alquilo, sulfonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 sulfinil (C₁₋₁₀) alquilo, aza (C₁₋₁₀) alquilo, oxaalquilo
 (C₁₋₁₀), oxaalquilo (C₁₋₁₀), imino (C₁₋₁₀) alquilo,
 5 (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₁₀) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
 hetero (C₁₋₁₀) aril (C₁₋₅) alquilo,
 (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, hetero (C₁₋₁₀) alquilo,
 10 cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo,
 bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo
 (C₄₋₁₂), hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
 hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
 insustituido;
- 15 R₁₄ se selecciona del grupo que consiste de alquilo
 (C₁₋₁₀), halo (C₁₋₁₀) alquilo, hidroxil (C₁₋₁₀) alquilo,
 carbonil (C₁₋₁₀) alquilo, tiocarbonil (C₁₋₁₀) alquilo,
 sulfonil (C₁₋₁₀) alquilo, sulfinil (C₁₋₁₀) alquilo,
 aza (C₁₋₁₀) alquilo, imino (C₁₋₁₀) alquilo,
 20 (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₁₀) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
 hetero (C₁₋₁₀) aril (C₁₋₅) alquilo,
 (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
 hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, hetero (C₁₋₁₀) alquilo,
 25 cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo,
 bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo
 (C₄₋₁₂), hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
 hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
 insustituido;

X se selecciona del grupo que consiste de NR_{14} , O y S
o cualquiera de dos R_2 , R_5 , R_6 , R_9 , R_{10} , R_{32} y R_{33} se toman
conjuntamente para formar un anillo sustituido o
insustituido;

- 5 m se selecciona del grupo que consiste de 2, 3, 4 y 5;
cada R_{17} se selecciona independientemente del grupo que
consiste de halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo,
carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi,
carbamoiloxi, carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino,
10 alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, carboxiamino, ureido,
imino, sulfonilo, aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo
(C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo,
carbonil(C_{1-3})alquilo, tiocarbonil(C_{1-3})alquilo,
sulfonil(C_{1-3})alquilo, sulfinil(C_{1-3})alquilo, azaalquilo
15 (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo,
hetero(C_{3-12})cicloalquil(C_{1-5})alquilo, aril(C_{1-10})alquilo,
heteroaril(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo,
hetero(C_{8-12})bicicloaril(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}),
hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}),
20 hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}),
hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y
hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido, o dos R_{17} se toman conjuntamente para
formar un anillo sustituido o insustituido; y
25 R_{17a} se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxilo, carboniloxi,
alcoxi, ariloxi, heteroariloxi, carbamoiloxi, carbonilo,
oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}),
sulfonamido, carboxiamino, ureido, imino, sulfonilo,

aminosulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀),
halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxilo(C₁₋₁₀)alquilo,
carbonil(C₁₋₃)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo,
sulfonil(C₁₋₃)alquilo, sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo
5 (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
10 hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido; y
R₁₉ y R₂₀ son cada uno independientemente seleccionados
15 del grupo que consiste de hidrógeno, oxi, hidroxilo,
carboniloxi, alcoxi, ariloxi, heteroariloxi, carbonilo,
oxicarbonilo, amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido,
imino, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀),
halo(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₃)alquilo,
20 tiocarbonil(C₁₋₃)alquilo, sulfonil(C₁₋₃)alquilo,
sulfinil(C₁₋₃)alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
imino(C₁₋₃)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
heteroaril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
25 hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o

insustituido, o R_{19} y R_{20} se toman conjuntamente para formar un anillo sustituido o insustituido, o R_{19} es un sustituyente convertible *in vivo* en hidroxilo; y excluyendo el compuesto 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida.

11. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizado porque X es O.

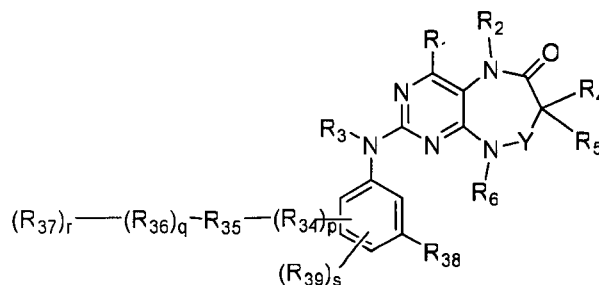
12. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizado porque R_4 es fluoro.

13. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, caracterizado porque R_5 es fluoro.

14. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 3 a 13, caracterizado porque el punto de unión de R_7 a L es la posición 1 uno de R_{17} es 3-fluoro.

15. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizado porque L está ausente.

16. Un compuesto de la fórmula



y las sales del mismo farmacéuticamente aceptable;

Y es $-(CR_9R_{10})_n-$;

n se selecciona del grupo que consiste de 1, 2, 3 y 4;

R_1 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, tio, hidroxilo, carbonilo, alcoxilo, ariloxilo,

5 heteroariloxilo, carbonilo, oxycarbonilo, amido, amino, alquilamino (C_{1-10}), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, hidroxilo(C_{1-10})alquilo, carbonilo(C_{1-3})alquilo, tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfonilo(C_{1-3})alquilo, 10 sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, arilo(C_{1-10})alquilo, heteroarilo(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{8-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}), 15 hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}), hetero(C_{3-12})bicicloalquilo, arilo (C_{4-12}), hetero(C_{1-10})arilo, bicicloarilo (C_{9-12}) y hetero(C_{4-12})bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;

20 R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, carbonilo, oxycarbonilo sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C_{1-10}), halo(C_{1-10})alquilo, carbonilo(C_{1-3})alquilo, tiocarbonilo(C_{1-3})alquilo, sulfonilo(C_{1-3})alquilo, sulfinilo(C_{1-3})alquilo, azaalquilo (C_{1-10}), 25 imino(C_{1-3})alquilo, (C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{3-12})cicloalquilo(C_{1-5})alquilo, arilo(C_{1-10})alquilo, heteroarilo(C_{1-5})alquilo, (C_{9-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo, hetero(C_{8-12})bicicloarilo(C_{1-5})alquilo, cicloalquilo (C_{3-12}), hetero(C_{3-12})cicloalquilo, bicicloalquilo (C_{9-12}),

hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido, o R₂ y R₁ se toman conjuntamente para
5 formar un anillo sustituido o insustituido;
R₃ es hidrógeno o un sustituyente convertible *in vivo* a
hidrógeno;
R₄ es halo;
R₅ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
10 halo, nitro, ciano, tio, oxi, hidroxí, carbonilo, oxi,
alcoxi (C₁₋₁₀), ariloxi (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)ariloxi,
carbonilo, oxicarbonilo, amido, amino, alquilamino
(C₁₋₁₀), sulfonamido, imino, sulfonilo, sulfinilo,
alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxí(C₁₋₁₀)alquilo,
15 carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo,
sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, azaalquilo
(C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo,
(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo,
20 hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,
(C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
25 hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
R₆ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno,
carbonilo, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀),

halo (C₁₋₁₀) alquilo, carbonil (C₁₋₃) alquilo,
tiocarbonil (C₁₋₃) alquilo, sulfonil (C₁₋₃) alquilo,
sulfinil (C₁₋₃) alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
imino (C₁₋₃) alquilo, (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
5 hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
heteroaril (C₁₋₅) alquilo, (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
10 hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero (C₄₋₁₂) bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
R₉ y R₁₀ son cada uno independientemente seleccionados
del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano,
15 tio, oxi, hidroxí, carboniloxi, alcoxi (C₁₋₁₀), ariloxi
(C₄₋₁₂), hetero (C₁₋₁₀) ariloxi, carbonilo, oxicarbonilo,
amido, amino, alquilamino (C₁₋₁₀), sulfonamido, imino,
sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo (C₁₋₁₀) alquilo,
hidroxí (C₁₋₁₀) alquilo, carbonil (C₁₋₁₀) alquilo,
20 tiocarbonil (C₁₋₁₀) alquilo, sulfonil (C₁₋₁₀) alquilo,
sulfinil (C₁₋₁₀) alquilo, azaalquilo (C₁₋₁₀),
imino (C₁₋₁₀) alquilo, (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquil (C₁₋₁₀) alquilo, aril (C₁₋₁₀) alquilo,
hetero (C₁₋₁₀) aril (C₁₋₅) alquilo,
25 (C₉₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo,
hetero (C₈₋₁₂) bicicloaril (C₁₋₅) alquilo, cicloalquilo (C₃₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂),
hetero (C₃₋₁₂) bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂),
hetero (C₁₋₁₀) arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y

hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido, o R₉ y R₁₀ se toman conjuntamente con el carbono al cual se unen para formar C=O, C=S, C=NR₁₁ o C=CR₁₂R₁₃;

- 5 R₁₁ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, sulfonilo, sulfinilo, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, aza(C₁₋₁₀)alquilo, imino(C₁₋₁₀)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo, (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo, 15 cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o insustituido;
- 20 R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halo, nitro, ciano, oxicarbonilo, amido, alquilo (C₁₋₁₀), halo(C₁₋₁₀)alquilo, hidroxil(C₁₋₁₀)alquilo, carbonil(C₁₋₁₀)alquilo, tiocarbonil(C₁₋₁₀)alquilo, sulfonil(C₁₋₁₀)alquilo, 25 sulfinil(C₁₋₁₀)alquilo, aza(C₁₋₁₀)alquilo, oxaalquilo (C₁₋₁₀), oxoalquilo (C₁₋₁₀), imino(C₁₋₁₀)alquilo, (C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₃₋₁₂)cicloalquil(C₁₋₁₀)alquilo, aril(C₁₋₁₀)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)aril(C₁₋₅)alquilo,

- (C₉₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo,
hetero(C₈₋₁₂)bicicloaril(C₁₋₅)alquilo, hetero(C₁₋₁₀)alquilo,
cicloalquilo (C₃₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)cicloalquilo,
bicicloalquilo (C₉₋₁₂), hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, arilo
5 (C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, bicicloarilo (C₉₋₁₂) y
hetero(C₄₋₁₂)bicicloarilo, cada uno sustituido o
insustituido;
o cualquiera de dos R₂, R₅, R₆, R₉, y R₁₀ se toman
conjuntamente para formar un anillo sustituido o
10 insustituido;
p se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;
R₃₄ se selecciona del grupo que consiste de -CONJ₃₄ -, -
NJ₃₄ CO -, -NJ₃₄ -, -SO₂NJ₃₄ -, -NJ₃₄ SO₂-,
J₃₄ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y
15 alquilo (C₁₋₄);
R₃₅ se selecciona del grupo que consiste de amino, arilo
(C₄₋₁₂), hetero(C₁₋₁₀)arilo, cicloalquilo (C₃₋₈),
hetero(C₃₋₆)cicloalquilo, bicicloalquilo (C₇₋₁₂),
hetero(C₃₋₁₂)bicicloalquilo, cada uno sustituido o
20 insustituido;
q se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;
R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de alquilo
(C₁₋₄), azaalquilo (C₁₋₄), cicloalquilo (C₃₋₈), hetero(C<sub>3-
8</sub>)cicloalquilo, cada uno sustituido o insustituido;
25 r se selecciona del grupo que consiste de 0 y 1;
R₃₇ es opcionalmente sustituido cicloalquilo (C₃₋₈),
cuando R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de
alquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido y azaalquilo
(C₁₋₄) opcionalmente sustituido;

R₃₇ es alquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido, cuando R₃₆ se selecciona del grupo que consiste de cicloalquilo (C₃₋₈) opcionalmente sustituido y hetero(C₃₋₈)cicloalquilo opcionalmente sustituido;

5 R₃₈ es fluoro o cloro;

s se selecciona del grupo que consiste de 0, 1, 2, 3, y 4; y

R₃₉ se selecciona independientemente del grupo que consiste de amino, alcoxi (C₁₋₄) opcionalmente sustituido, alquilo (C₁₋₄) opcionalmente sustituido, amido, carboxi, ciano, cicloalquilo (C₃₋₈), halo, hidroxil, y nitro; y excluyendo el compuesto 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida.

10

15

17. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 16, caracterizado porque p es 1 y q es 1.

18. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 y 17, caracterizado porque R₃₄ es -

20 CONJ₃₄-.

19. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 18, caracterizado porque J₃₄ es hidrógeno.

20. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 y 19, caracterizado porque n es 1.

25

21. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 20, caracterizado porque cada R₉ y R₁₀ es hidrógeno.

22. Un compuesto de conformidad con cualquiera de

las reivindicaciones 16 a 21, caracterizado porque R_5 es halo.

23. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 22, caracterizado porque R_4 es
5 fluoro.

24. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 23, caracterizado porque R_5 es fluoro.

25. Un compuesto de conformidad con cualquiera de
10 las reivindicaciones 16 a 24, caracterizado porque

R_{35} se selecciona de cicloalquilo (C_{3-8}) opcionalmente sustituido;

R_{36} es hetero(C_{3-8})cicloalquilo opcionalmente sustituido;
y

15 R_{37} es alquilo (C_{1-4}) opcionalmente sustituido.

26. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 25, caracterizado porque

R_1 es hidrógeno;

R_2 es alquilo (C_{1-4}) opcionalmente sustituido;

20 R_6 se selecciona del grupo que consiste de alquilo (C_{1-10}) y cicloalquilo (C_{3-12}), cada uno sustituido o insustituido.

27. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 26, caracterizado porque uno de R_{39}
25 se selecciona del grupo que consiste de alcoxi (C_{1-4}) opcionalmente sustituido y alquilo (C_{1-4}) opcionalmente sustituido.

28. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 27, caracterizado porque s es 1 y

R₃₉ es metoxi.

29. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 16 a 28, caracterizado porque R₃₈ es fluoro.

5 30. Un compuesto, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de:

Ácido 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzoico;

10 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-ciclopropil-3-metoxibenzamida;

15 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidín-3-il)benzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-hidroxietil)piperidín-4-il)-3-metoxibenzamida;

20 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazín-1-il)benzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilpiperidín-4-il)-3-metoxibenzamida;

25 (R)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidín-3-il)benzamida;

(S)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-4-il)benzamida;

5 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-(dimetilamino)acetil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

10 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(2-(pirrolidin-1-il)acetil)piperidin-4-il)benzamida;

15 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(pirrolidin-1-il)benzamida;

N-(Azepan-4-il)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

20 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazepan-4-il)benzamida;

25 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(2-(metilamino)-2-oxoetil)piperidin-4-il)benzamida;

9-ciclopentil-2-(4-(2-(dimetilamino)etoxi)fenilamino)-7,7-difluoro-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;

6-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-

- tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-
2H-benzo[b][1,4]oxazin-3(4H)-ona;
- 9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-2-(2-oxoindolin-6-ilamino)-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-
5 6(7H)-ona;
- 2-(1H-Indol-5-ilamino)-9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-2-(3-(1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)-1H-indol-5-ilamino)-8,9-dihidro-
10 5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-fluoro-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 15 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 3-Cloro-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 20 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-3-(trifluorometoxi)-benzamida;
- 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metil-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 25 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-etil-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

- 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 5 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-etoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-metilpiperidin-4-il)-3-(trifluorometil)benzamida;
- 10 Ácido 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-5-metoxibenzoico;
- Ácido 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzoico;
- 15 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida;
- 20 4-(9-Ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida;
- 25 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilpiperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;
- (S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;

5 (R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpirrolidin-3-il)benzamida;

4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-((1r,4r)-4-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;

10 Fosfato diácido de (1R,4R)-4-(4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamido)ciclohexilo;

15 N-(azepan-4-il)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

N-(azetidin-3-il)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-

20 b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-hidroxietil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

(R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(quinuclidin-3-il)benzamida;

25 (S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(quinuclidin-3-il)benzamida;

- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-((*cis*)-2-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 5 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-((*trans*)-2-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-(dimetilamino)ciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 10 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(2,2,2-trifluoroetil)piperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(8-metil-8-azabicciclo[3.2.1]octan-3-il)benzamida;
- 15 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-ciclopentilpiperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 20 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(2-(dimetilamino)etil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(3-(dimetilamino)propil)-3-metoxibenzamida;
- 25 N-(azetidín-3-il)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(2-(pirrolidin-1-il)etil)benzamida;
- 9-ciclohexil-7,7-difluoro-2-(2-metoxi-4-(4-metilpiperazin-1-carbonil)-fenilamino)-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(3-(dimetilamino)propil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-metilbenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N',N'-dimetilbenzohidrazida;
- (R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(2-hidroxipropil)-3-metoxibenzamida;
- (S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(2-hidroxipropil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-1-il)benzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-morfolinobenzamida;

4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(tetrahidro-2H-piran-4-il)benzamida;

5 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(pirrolidin-1-il)benzamida;

10 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)benzamida;

N-(1-acetilazetidín-3-il)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

15 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-4-il)benzamida;

20 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-(dimetilamino)acetil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

(S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(pirrolidin-3-il)benzamida;

25 (R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(pirrolidin-3-il)benzamida;

(S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-3-il)benzamida;

- (R)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-3-il)benzamida;
- 5 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-ciclopropil-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperazin-1-il)benzamida;
- 10 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-etilpiperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 15 (4-isopropilpiperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- (4-(ciclopropilmetil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamidametoxibenzamida;
- 20 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-(2-(dimetilamino)acetil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- Ácido 4-(7,7-difluoro-5-metil-9-((3R)-3-metilciclopentil)-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-
- 25 pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzoico;
- 4-(7,7-difluoro-5-metil-9-((3R)-3-metilciclopentil)-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-

- 2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 5 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-
 (trifluorometil)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-
 b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-
 4-il)benzamida;
 4-(9-Ciclopentil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-
 10 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 15 4-(9-Ciclopentil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida;
 4-(9-Ciclohexil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 20 metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-Ciclohexil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida;
 (R)-4-(9-ciclopentil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-
 25 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-
 ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-Ciclopentil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
 metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

- (R)-4-(9-ciclopentil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 5 (S)-4-(9-ciclopentil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-Ciclopentil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidín-3-il)benzamida;
- 10 4-(9- Ciclohexil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-Ciclohexil-7-etil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidín-3-il)benzamida;
- 15 Ácido 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzoico;
- 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 20 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidín-3-il)benzamida;
- 25 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-((R)-piperidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

5 (S)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilpiperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-hidroxietil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

15 4-((R)-9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-((R)-piperidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-

20 ilamino)-N-(1-(2-(dimetilamino)acetil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida;

25 (S)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida;

Fosfato diácido de (R)-2-(4-(4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-

pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
metoxibenzamido) piperidin-1-il)etilo;

Ácido (R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-
vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-

5 b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-5-metoxibenzoico;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-
6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-
ilamino)-2-fluoro-5-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-
il)benzamida;

10 N-(1-(2-amino-2-oxoetil)piperidin-4-il)-4-(9-
ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
metoxibenzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
15 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
(1-(2-(dimetilamino)-2-oxoetil) piperidin-4-il)-3-
metoxibenzamida;

4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-
20 fluoro-N-(1-(2-hidroxietil)piperidin-4-il)-5-
metoxibenzamida;

4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
(1-(2-(dimetilamino)acetil)piperidin-4-il)-2-fluoro-5-
25 metoxibenzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-
fluoro-5-metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;
9-Ciclopentil-7,7-difluoro-2-(5-fluoro-2-

metoxifenilamino)-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;

Ácido 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-fluoro-5-metoxibenzoico;

5

4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-fluoro-5-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

Ácido 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-3-metoxibenzoico;

10

4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

15

4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-isopropilazetidin-3-il)-3-metoxibenzamida;

4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilazetidin-3-il)-3-metoxibenzamida;

20

N-(azetidin-3-il)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-5-metoxibenzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilazetidin-3-il)-3-metoxibenzamida;

25

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-isopropilazetidin-3-il)-3-metoxibenzamida;

68

803

- N-(azetidin-3-il)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-5-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-etilazetidin-3-il)-2-fluoro-5-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-N-(1-isopropilazetidin-3-il)-5-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-ciclopentilazetidin-3-il)-2-fluoro-5-metoxibenzamida;
- 9-ciclopentil-2-(4-(4-(ciclopropilmetil)piperazin-1-carbonil)-2-metoxifenilamino)-7,7-difluoro-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 9-ciclopentil-2-(4-(4-(ciclopropilmetil)piperazin-1-carbonil)-5-fluoro-2-metoxifenilamino)-7,7-difluoro-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 9-ciclopentil-2-(2,2-difluorobenzo[d][1,3]dioxol-4-ilamino)-7,7-difluoro-5-metil-8,9-dihidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-6(7H)-ona;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(2-(pirrolidin-1-il)etil)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-

- tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(2-(dimetilamino)etil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 5 (2-hidroxietil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-etil-3-metoxibenzamida
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 10 (3-(dimetilamino)propil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-metilbenzamida;
- 15 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N',N'-dimetilbenzohidrazida;
- (S)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 20 (2-hidroxipropil)-3-metoxibenzamida;
- (R)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(2-hidroxipropil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 25 ((1S,2S)-2-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-((1S,2RS)-2-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;

70

80

- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-1-il)benzamida;
- 5 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-morfolinobenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(tetrahidro-2H-piran-4-il)benzamida;
- 10 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-(dimetilamino)ciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- 15 (4-(2-hidroxietil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(2-oxoazepan-3-il)benzamida;
- (R)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
- 20 metoxi-N-(quinuclidin-3-il)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- (1-isopropilpiperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;
- 25 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-
- (4-(2-hidroxietil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-((1R,5S)-8-metil-8-azabicciclo[3.2.1]octan-3-il)benzamida;

N-(1-acetilpiperidin-4-il)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-

5 pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)benzamida;

10 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-ciclopentilpiperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;

(S)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

15 metoxi-N-(quinuclidin-3-il)benzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(2,2,2-trifluoroetil)piperidin-4-

20 il)benzamida; y las sales del mismo farmacéuticamente aceptable.

31. Un compuesto, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de:

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

25 metoxi-N-(2-(pirrolidin-1-il)etil)benzamida;

4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-

metoxi-N-(1-(2,2,2-trifluoroetil)piperidin-4-il)benzamida;

72
807

- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)benzamida;
- 5 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-((1S,2RS)-2-hidroxiciclohexil)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidín-3-il)benzamida;
- 10 (R)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;
- (S)-4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
- 15 metoxi-N-(piperidin-3-il)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-
- 20 tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-(dimetilamino)acetil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-
- 25 fluoro-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-

- tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida;
- 4-(9-Ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida
- 5 N-(azetidin-3-il)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(1-(2-idroxi-etil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;
- 10 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-(2,2,2-trifluoroetil)piperidin-4-il)benzamida;
- 15 (S)-4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(pirrolidin-3-il)benzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(piperazin-1-il)benzamida;
- 20 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-etilpiperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;
- 25 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-(ciclopropilmetil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamidametoxibenzamida;
- 4-(9-ciclohexil-7,7-difluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-

tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-N-(4-(2-(dimetilamino)acetil)piperazin-1-il)-3-metoxibenzamida;

4-(9-Ciclohexil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-vinil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(4-metilpiperazin-1-il)benzamida; y

las sales del mismo farmacéuticamente aceptable.

32. Un compuesto, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de:

(R)-4-(9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclohexil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclobutil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilazetidin-3-il)benzamida;

4-((R)-9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-fluoro-N-((R)-piperidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-

75
810

ilamino)-N-(1-(2-hidroxietil)piperidin-4-il)-3-metoxibenzamida;

4-((R)-9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-

5 ilamino)-3-metoxi-N-((R)-quinuclidin-3-il)benzamida;

(R)-4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-7-(prop-1-inil)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-

b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

10 (S)-4-(9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(S)-4-(9-ciclohexil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-

15 ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

(S)-4-(9-ciclobutil-7-etinil-7-fluoro-5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

N-(azepan-4-il)-4-((R)-9-ciclopentil-7-etinil-7-fluoro-

20 5-metil-6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-

b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxibenzamida; y las sales del mismo farmacéuticamente aceptable.

33. Un compuesto, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de:

25 4-(5-ciclopentil-7,7-difluoro-6,7-dihidro-5H-imidazo[1,2-d]pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-3-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;

4-(5-ciclopentil-7-fluoro-7-metil-6,7-dihidro-5H-imidazo[1,2-d]pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-3-ilamino)-3-

- metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(6-ciclopentil-4,4-difluoro-5,6-dihidro-4H-pirimido[4,5-b][1,2,4]triazolo[4,3-d][1,4]diazepin-8-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 5 4-(6-ciclopentil-4-fluoro-4-metil-5,6-dihidro-4H-pirimido[4,5-b][1,2,4]triazolo[4,3-d][1,4]diazepin-8-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 10 4-(6-ciclopentil-4,4-difluoro-5,6-dihidro-4H-pirimido[4,5-b][1,2,4]triazolo[1,5-d][1,4]diazepin-8-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 15 4-(6-ciclopentil-4-fluoro-4-metil-5,6-dihidro-4H-pirimido[4,5-b][1,2,4]triazolo[1,5-d][1,4]diazepin-8-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 20 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-6-(hidroxiimino)-5-metil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 25 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-6-(hidroxiimino)-5,7-dimetil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(6-(cianoimino)-9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
- 4-(6-(cianoimino)-9-ciclopentil-7-fluoro-5,7-dimetil-

- 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-6-(metoxiimino)-5-metil-
 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 5 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-6-(metoxiimino)-5,7-dimetil-
 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6-(nitroimino)-
 10 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida;
 (4-(9-ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxifenil)metanol;
 15 4-(9-ciclopentil-7-fluoro-5,7-dimetil-6-(nitroimino)-
 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[5,4-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-3-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida; y
 las sales del mismo farmacéuticamente aceptable.
 34. El compuesto 4-(9-Ciclopentil-7,7-difluoro-5-metil-
 20 6-oxo-6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirimido[4,5-b][1,4]diazepin-2-ilamino)-2-fluoro-5-metoxi-N-(1-metilpiperidin-4-il)benzamida y las sales del mismo
 farmacéuticamente aceptable.

35. Una composición farmacéutica, caracterizada
 25 porque comprende cualquiera de las reivindicaciones 1 a 34 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.