

160 8/1
392

PARRA, RODRIGUEZ & CAVELIER

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 03050487 00000005 Folios: 41
Fecha (HND): 2004-08-17 16:27:34
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLET
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Bogotá, D.C., 13 de Agosto de 2004

Señora Jefe
División de Nuevas Creaciones
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Patente: INHIBIDORES DE GIRASA Y USO DE LOS MISMOS

Solicitante: VERTEX PHARMACEUTICALS INCORPORATED

Expediente: 03.050.487

Me permito informar a usted que, por un error, al radicar la solicitud de ingreso a la Fase Nacional de la patente de la referencia, se omitió la traducción al español de las páginas correspondientes a las reivindicaciones 10 a 34.

Por tal razón, anexo al presente la traducción completa de las reivindicaciones.

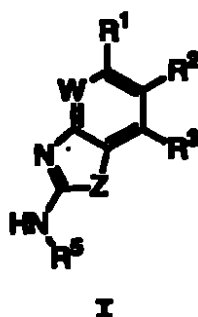
Sin embargo, le solicito tomar en consideración que estas reivindicaciones fueron modificadas mediante memorial radicado el 10 de Agosto de 2004.

De la Señora Jefe,


Helena Camargo Williamson
C.C. 35.455.268
T.P. 76985

Nosotros reivindicamos:

1. Un método para disminuir la cantidad bacteriana en una muestra biológica, que comprende la etapa de contactar dicha muestra biológica con un compuesto de la fórmula I:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

Z es O o N-R⁴;

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

R¹ es un anillo arilo o heteroarilo, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta cuatro R⁸; en donde un substituyente R⁸ en la posición orto de R¹ tomado junto con R² pueden formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que tiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de R^6 , halógeno, CN, SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $NRCO_2R^6$, $NRCON(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $NRCOR^6$, $NRN(R^6)_2$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $NRSO_2R^6$; o R^2 y R^3 son tomados juntos para formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $CON(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $(CH_2)_yR^2$;

y es 1-6;

R^5 es seleccionado a partir de R^7 , Ar, COAr, $CON(R^7)Ar$, $(CH_2)_yCO_2R$, $(CH_2)_yN(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-N(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-NRCOR$, $C(=S)-N(R^7)_2$, $CON(R^7)_2$, COR, SO_2R , o $SO_2N(R^7)_2$;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo de 5 miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN; NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , $NHCOR^8$, $NHCONHR^8$, COR^8 , $CONHR^8$, SO_2R^8 , $NHSO_2NHR^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailoxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente

substituido que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

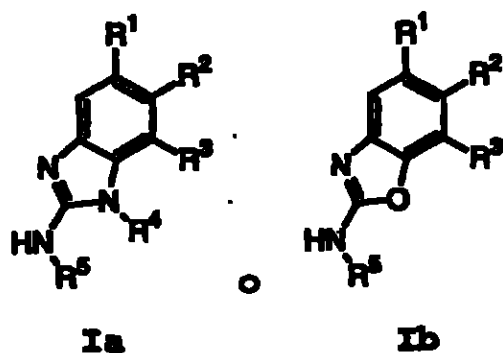
cada Q es un alquilo recto o ramificado independientemente seleccionado de C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$;

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno;

y R^{10} es seleccionado a partir de R^7 o Ar.

2. El método de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto tiene la fórmula Ia o Ib:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. El método de acuerdo con la reivindicación 2, en donde dicho compuesto tiene una o más de las características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (c) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (d) R^6 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(haloalquil)$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

4. El método de acuerdo con la reivindicación 3, en donde:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (c) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (d) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , T_n (haloalquil), $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

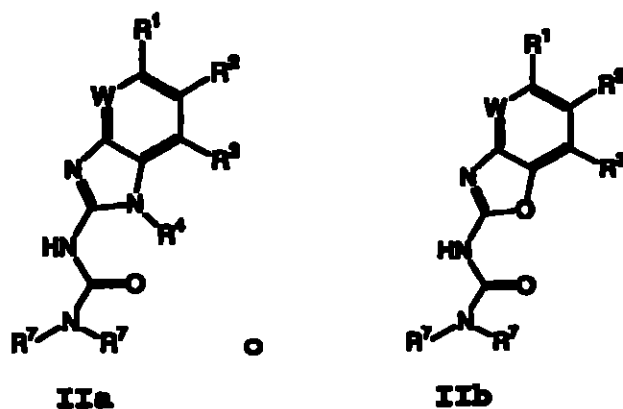
5. El método de acuerdo con la reivindicación 3, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (e) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (f) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

6. El método de acuerdo con la reivindicación 5, en donde:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente sustituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (e) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (f) R^6 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

7. El método de acuerdo a la reivindicación 1, en donde dicho compuesto tiene la fórmula **IIa** o **IIb**:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

R¹ es un anillo arilo o heteroarilo, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta cuatro R⁹; en donde un substituyente R⁹ en la posición orto de R¹ tomado junto con R² puede formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que tiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R² y R³ son cada uno independientemente seleccionados a partir de R⁶, halógeno, CN, SR⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, NRCO₂R⁶, NRCON(R⁶)₂, CON(R⁶)₂, NRCOR⁶, NRN(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, o NRSO₂R⁶; o R² y R³ son tomados juntos para formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R⁴ es seleccionado a partir de R⁶, CON(R⁶), COR⁶, CO₂R⁶, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, o (CH₂)_yR²;

y es 1-6;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo, de cinco miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN, NO₂, R⁸, OR⁸, NHR⁸, NHCOR⁸, NHCONHR⁸, COR⁸, CONHR⁸, SO₂R⁸, NHSO₂NHR⁸ o SO₂NHR⁸;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailoxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido, que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo ramificado o recto, independientemente seleccionado entre C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$; y

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno.

8. El método de acuerdo con la reivindicación 7, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

9. El método de acuerdo con la reivindicación 8, en donde:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

10. El método de acuerdo con la reivindicación 8, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

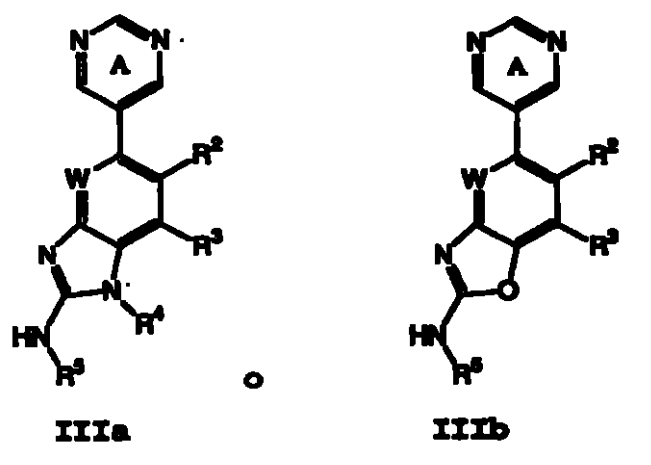
- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxí, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxí, aralcoxí, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y
- (e) R^5 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_xCO_2R^6$.

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

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxí, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxí, aralcoxí, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y

(e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

12. El método de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto tiene la fórmula IIIa o IIIb:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^a ;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, $-CF_3$, R^7 , $-OR^7$, o $-N(R^7)_2$;

El anillo A se encuentra opcionalmente substituido con hasta tres R^9 ; en donde cuando un substituyente R^9 se encuentra en la posición orto del anillo A, dicho substituyente R^9 puede ser tomado junto con R^2 para formar un anillo de 5-7 miembros, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de R^6 , halógeno, CN, SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $NRCO_2R^6$,

$\text{NRCON}(\text{R}^6)_2$, $\text{CON}(\text{R}^6)_2$, NRCOR^6 , $\text{NRN}(\text{R}^6)_2$, COR^6 , CO_2R^6 , COCOR^6 , SO_2R^6 , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, o NRSO_2R^6 ; o R^2 y R^3 son tomados juntos para formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $\text{CON}(\text{R}^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , COCOR^6 , SO_2R^6 , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, o $(\text{CH}_2)_y\text{R}^2$;

y es 1-6;

R^5 es seleccionado a partir de R^7 , Ar , COAr , $\text{CON}(\text{R}^7)\text{Ar}$, $(\text{CH}_2)_y\text{CO}_2\text{R}$, $(\text{CH}_2)_y\text{N}(\text{R}^7)_2$, $\text{C}(=\text{NR}^{10})-\text{N}(\text{R}^7)_2$, $\text{C}(=\text{NR}^{10})-\text{NRCOR}$, $\text{C}(=\text{S})-\text{N}(\text{R}^7)_2$, $\text{CON}(\text{R}^7)_2$, COR , SO_2R , o $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^7)_2$;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo de 5 miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN , NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , NHCOR^8 , NHCONHR^8 , COR^8 , CONHR^8 , SO_2R^8 , $\text{NHSO}_2\text{NHR}^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailoxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno

opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo recto o ramificado independientemente seleccionado de C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$;

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno;

y R^{10} es seleccionado a partir de R^7 o Ar.

13. El método de acuerdo con la reivindicación 12, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;

- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$,
o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN , oxo , R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$,
 $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$,
 $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(haloalquil)$,
 $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

14. El método de acuerdo con la reivindicación 13, en donde:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN , CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$,
o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN , oxo , R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$,
 $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$,
 $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(haloalquil)$,
 $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

15. El método de acuerdo con la reivindicación 13, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN , oxo , R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$,
 $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

76
407

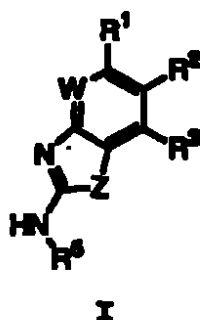
16. El método de acuerdo con la reivindicación 15, en donde:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

17. El método de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es seleccionado a partir de aquellos listados en cualesquiera de las Tablas 1 y 2.

18. El método de acuerdo con la reivindicación 1 que además comprende la etapa de contactar dicha muestra biológica con un agente que incrementa la susceptibilidad de los organismos bacterianos a los antibióticos.

19. Un método para tratar una infección bacteriana en un mamífero en necesidad del mismo, que comprende la etapa de administrar a dicho mamífero una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de la fórmula I:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

Z es O o N-R⁴;

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

R¹ es un anillo arilo o heteroarilo, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta cuatro R⁹; en donde un substituyente R⁹ en la posición orto de R¹ tomado junto con R² pueden formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que tiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R² y R³ son cada uno independientemente seleccionados a partir de R⁶, halógeno, CN, SR⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, NRCO₂R⁶, NRCON(R⁶)₂, CON(R⁶)₂, NRCOR⁶, NRN(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, o NRSO₂R⁶; o R² y R³ son tomados juntos para formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2

heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $CON(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $(CH_2)_yR^2$;

y es 1-6;

R^5 es seleccionado a partir de R^7 , Ar , $COAr$, $CON(R^7)Ar$, $(CH_2)_yCO_2R$, $(CH_2)_yN(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-N(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-NRCOR$, $C(=S)-N(R^7)_2$, $CON(R^7)_2$, COR , SO_2R , o $SO_2N(R^7)_2$;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo de 5 miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN , NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , $NHCOR^8$, $NHCONHR^8$, COR^8 , $CONHR^8$, SO_2R^8 , $NHSO_2NHR^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailoxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar , o un anillo arilo o

heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO₂, T_n(haloalquilo), R⁶, SR⁶, OR⁶, OR⁸, N(R⁶)₂, CON(R⁶)₂, CON(R)COR⁶, COR⁶, CO₂R⁶, CO₂N(R⁶)₂, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, N(R)T_nCO₂R⁶, N(R)T_nCON(R⁶)₂, N(R)T_nN(R⁶)₂, N(R)T_nNRCO₂R⁶, N(R)T_nNRCON(R⁶)₂, N(R)T_nCOR⁶, N(R)T_nNRCOR⁶, N(R)T_nSO₂N(R⁶)₂, N(R)T_nSO₂R⁶, T_nPO(OR⁷)₂, T_nOPO(OR⁷)₂, T_nSP(OR⁷)₂, T_nPO(OR⁷)₂, o T_nNPO(OR⁷)₂;

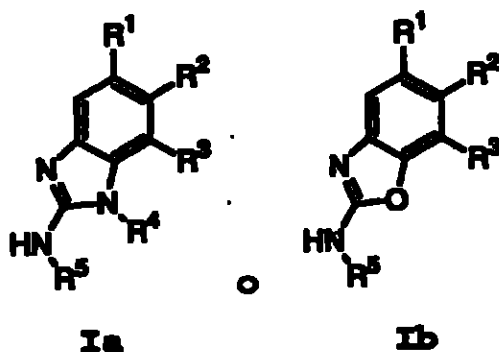
cada Q es un alquilo recto o ramificado independientemente seleccionado de C₁-C₃;

T es seleccionado a partir de -Q- o -Q_m-CH(Q_m-R²)-;

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno;

y R¹⁰ es seleccionado a partir de R⁷ o Ar.

20. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde dicho compuesto tiene la fórmula Ia o Ib:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. El método de acuerdo con la reivindicación 20, en donde dicho compuesto tiene una o más de las características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (c) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (d) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

22. El método de acuerdo con la reivindicación 21, en donde:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (c) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y

- (d) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNR^6CO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

23. El método de acuerdo con la reivindicación 21, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

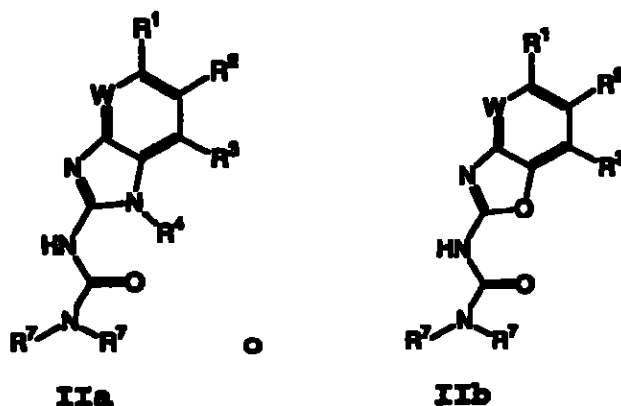
- (a) R^1 es un anillo opcionalmente sustituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (e) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (f) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

24. El método de acuerdo con la reivindicación 23, en donde:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente sustituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo,

- amino-pirimidinilo, quinolinilo,
aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (e) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (f) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

25. El método de acuerdo a la reivindicación 19, en donde dicho compuesto tiene la fórmula **IIa** o **IIb**:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^4 ;

R^4 es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, $-CF_3$, R^7 , $-OR^7$, o $-N(R^7)_2$;

R^1 es un anillo arilo o heteroarilo, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta cuatro R^9 ; en donde un substituyente R^9 en la

posición orto de R^1 tomado junto con R^2 puede formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que tiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de R^6 , halógeno, CN, SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $NRCO_2R^6$, $NRCON(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $NRCOR^6$, $NRN(R^6)_2$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $NRSO_2R^6$; o R^2 y R^3 son tomados juntos para formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $CON(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $(CH_2)_yR^2$;

y es 1-6;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo, de cinco miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , $NHCOR^8$, $NHCONHR^8$, COR^8 , $CONHR^8$, SO_2R^8 , $NHSO_2NHR^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailloxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido, que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo ramificado o recto, independientemente seleccionado entre C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$; y

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno.

26. El método de acuerdo con la reivindicación 25, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, $\cdot\text{CN}$, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN , oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{CON}(\text{R}^6)_2$, CO_2R^6 , $\text{CON}(\text{R})\text{COR}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{CO}_2\text{R}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{NRCO}_2\text{R}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{N}(\text{R}^6)_2$, NO_2 , $\text{T}_n(\text{haloalquil})$, $\text{CO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$.

27. El método de acuerdo con la reivindicación 26, en donde:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN , CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN , oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{CON}(\text{R}^6)_2$, CO_2R^6 , $\text{CON}(\text{R})\text{COR}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{CO}_2\text{R}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{NRCO}_2\text{R}^6$, $\text{N}(\text{R})\text{T}_n\text{N}(\text{R}^6)_2$, NO_2 , $\text{T}_n(\text{haloalquil})$, $\text{CO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$.

28. El método de acuerdo con la reivindicación 26, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo,

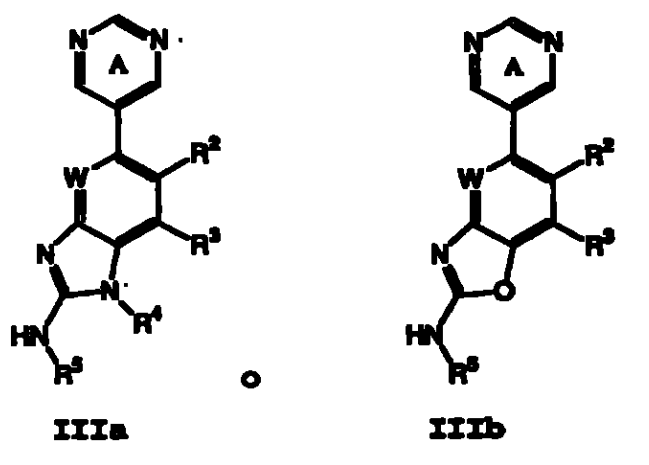
amino-pirimidinilo, quinolinilo,
aminobenzimidazol, o indolilo;

- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y
- (e) R^5 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

29. El método de acuerdo con la reivindicación 28, en donde:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y
- (e) R^5 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

30. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde dicho compuesto tiene la fórmula IIIa o IIIb:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

El anillo A se encuentra opcionalmente substituido con hasta tres R⁹; en donde cuando un substituyente R⁹ se encuentra en la posición orto del anillo A, dicho substituyente R⁹ puede ser tomado junto con R² para formar un anillo de 5-7 miembros, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R² y R³ son cada uno independientemente seleccionados a partir de R⁶, halógeno, CN, SR⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, NRCO₂R⁶, NRCON(R⁶)₂, CON(R⁶)₂, NRCOR⁶, NRN(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, o NRSO₂R⁶; o R² y R³ son tomados juntos para formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2

heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $\text{CON}(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , COCOR^6 , SO_2R^6 , $\text{SO}_2\text{N}(R^6)_2$, o $(\text{CH}_2)_yR^2$;

y es 1-6;

R^5 es seleccionado a partir de R^7 , Ar, COAr, $\text{CON}(R^7)\text{Ar}$, $(\text{CH}_2)_y\text{CO}_2R$, $(\text{CH}_2)_y\text{N}(R^7)_2$, $\text{C}(=\text{NR}^{10})-\text{N}(R^7)_2$, $\text{C}(=\text{NR}^{10})-\text{NRCOR}$, $\text{C}(=\text{S})-\text{N}(R^7)_2$, $\text{CON}(R^7)_2$, COR, SO_2R , o $\text{SO}_2\text{N}(R^7)_2$;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo de 5 miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , NHCOR^8 , NHCONHR^8 , COR^8 , CONHR^8 , SO_2R^8 , $\text{NHSO}_2\text{NHR}^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailloxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático $\text{C}_1\text{-C}_4$, en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o

heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo recto o ramificado independientemente seleccionado de C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$;

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno;

y R^{10} es seleccionado a partir de R^7 o Ar.

31. El método de acuerdo con la reivindicación 30, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

32. El método de acuerdo con la reivindicación 31, en donde:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

33. El método de acuerdo con la reivindicación 31, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

34. El método de acuerdo con la reivindicación 33, en donde:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;

- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_xCO_2R^6$.

35. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde dicho compuesto es seleccionado a partir de aquellos listados en cualesquiera de las Tablas 1 y 2.

36. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde la enfermedad en los mamíferos es aliviada por medio de la administración de un inhibidor de girasa.

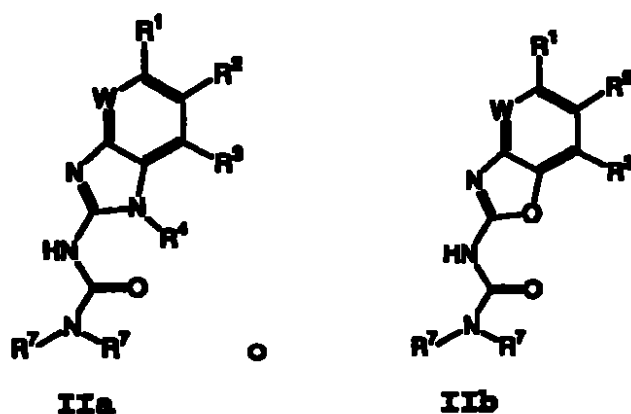
37. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde la infección bacteriana a ser tratada está caracterizada por la presencia de una o más de las siguientes: *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyrogenes*, *Enterococcus faecalis*, *Enterococcus faecium*, *Klebsiella pneumoniae*, *Enterobacter* sps. *Proteus* sps. *Pseudomonas aeruginosa*, *E. coli*, *Serratia marcescens*, *S. aureus*, o Coag. Neg. Staph.

38. El método de acuerdo con la reivindicación 19, en donde la infección bacteriana a ser tratada es seleccionada a partir de una o más de las siguientes: infecciones del tracto urinario, neumonía, prostatitis, infecciones de la piel y de tejido blando, infecciones intra-abdominales, o infecciones de pacientes neutropénicos febriles.

39. El método de acuerdo con la reivindicación 19 que además comprende la etapa de administrar a dicho paciente un agente terapéutico adicional ya sea como parte de una forma de dosificación múltiple junto con dicho compuesto, o como una forma de dosificación separada.

40. El método de acuerdo con la reivindicación 19 que además comprende la etapa de administrar a dicho paciente un agente que incrementa la susceptibilidad de los organismos bacterianos a los antibióticos.

41. Un compuesto de fórmula IIa o IIb:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

R¹ es un anillo arilo o heteroarilo, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por

hasta cuatro R^9 ; en donde un sustituyente R^9 en la posición orto de R^1 tomado junto con R^2 puede formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente sustituido, que tiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de R^6 , halógeno, CN, SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $NRCO_2R^6$, $NRCON(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $NRCOR^6$, $NRN(R^6)_2$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $NRSO_2R^6$; o R^2 y R^3 son tomados juntos para formar un anillo fusionado de 5-8 miembros, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente sustituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno, o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $CON(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $(CH_2)_yR^2$;

y es 1-6;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo, de cinco miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente sustituido por hasta tres sustituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , $NHCOR^8$, $NHCONHR^8$, COR^8 , $CONHR^8$, SO_2R^8 , $NHSO_2NHR^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi,

ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo,
heteroaralcoxi, o heteroarailoxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido, que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^8 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo ramificado o recto, independientemente seleccionado entre C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$; y

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno.

42. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 41, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

43. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 42, en donde:

- (a) R^1 es un anillo arilo o heteroarilo opcionalmente substituido;
- (b) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

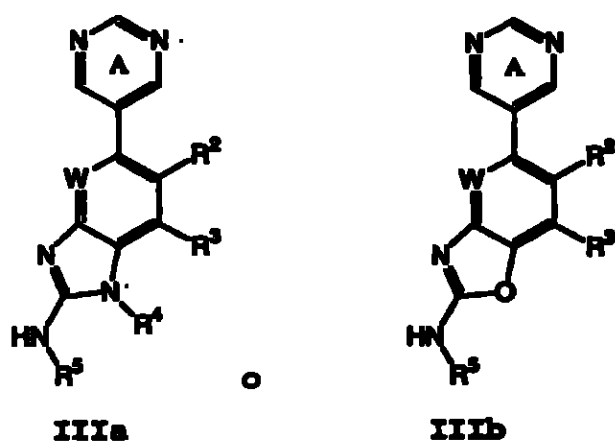
44. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 42, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y
- (e) R^5 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

45. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 44, en donde:

- (a) R^1 es un anillo opcionalmente substituido seleccionado a partir de fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, tienilo, pirimidilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, pirazol-1-ilo, amino-pirimidinilo, quinolinilo, aminobenzimidazol, o indolilo;
- (b) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (c) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (d) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$; y
- (e) R^5 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

46. Un compuesto de fórmula IIIa o IIIb:



o un derivado o profármaco farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

W es nitrógeno o CR^a;

R^a es seleccionado a partir de hidrógeno, halógeno, -CF₃, R⁷, -OR⁷, o -N(R⁷)₂;

El anillo A se encuentra opcionalmente substituido con hasta tres R⁹; en donde cuando un substituyente R⁹ se encuentra en la posición orto del anillo A, dicho substituyente R⁹ puede ser tomado junto con R² para formar un anillo de 5-7 miembros, opcionalmente substituido, que contiene 0-2 heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R² y R³ son cada uno independientemente seleccionados a partir de R⁶, halógeno, CN, SR⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, NRCO₂R⁶, NRCON(R⁶)₂, CON(R⁶)₂, NRCOR⁶, NRN(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, COCOR⁶, SO₂R⁶, SO₂N(R⁶)₂, o NRSO₂R⁶; o R² y R³ son tomados juntos para formar un anillo de 5-8 miembros fusionado, insaturado o parcialmente insaturado, opcionalmente substituido, que contiene 0-2

heteroátomos en el anillo seleccionados a partir de nitrógeno, oxígeno o azufre;

R^4 es seleccionado a partir de R^6 , $CON(R^6)$, COR^6 , CO_2R^6 , $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, o $(CH_2)_yR^2$;

y es 1-6;

R^5 es seleccionado a partir de R^7 , Ar, COAr, $CON(R^7)Ar$, $(CH_2)_yCO_2R$, $(CH_2)_yN(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-N(R^7)_2$, $C(=NR^{10})-NRCOR$, $C(=S)-N(R^7)_2$, $CON(R^7)_2$, COR, SO_2R , o $SO_2N(R^7)_2$;

Ar es un anillo heteroarilo, heterociclilo, o carbociclilo de 5 miembros, en donde dicho anillo se encuentra opcionalmente substituido por hasta tres substituyentes seleccionados a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , R^8 , OR^8 , NHR^8 , $NHCOR^8$, $NHCONHR^8$, COR^8 , $CONHR^8$, SO_2R^8 , $NHSO_2NHR^8$ o SO_2NHR^8 ;

cada R^6 es independientemente seleccionado a partir de R^7 o un grupo opcionalmente substituido seleccionado a partir de alcoxi, hidroxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, aralquilo, aralcoxi, ariloxialquilo, heteroarilo, heteroaralquilo, heteroaralcoxi, o heteroarailloxialquilo;

cada R^7 es independientemente seleccionado a partir de hidrógeno o un grupo alifático opcionalmente substituido que tiene de uno a seis carbonos, o dos R^7 en el mismo nitrógeno tomados junto con el nitrógeno opcionalmente forman un anillo heterocíclico de cuatro a seis miembros, saturado o insaturado, que tiene de uno a tres heteroátomos;

R^8 es un grupo alifático C_1-C_4 , en donde dos R^8 en posiciones adyacentes de Ar, o un anillo arilo o

heteroarilo, pueden ser tomados junto con sus átomos intervinientes para formar un anillo fusionado de tres a seis miembros;

cada R^9 es independientemente seleccionado a partir de oxo, halógeno, CN, NO_2 , $T_n(\text{haloalquilo})$, R^6 , SR^6 , OR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, $CON(R)COR^6$, COR^6 , CO_2R^6 , $CO_2N(R^6)_2$, $COCOR^6$, SO_2R^6 , $SO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nCON(R^6)_2$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCON(R^6)_2$, $N(R)T_nCOR^6$, $N(R)T_nNRCOR^6$, $N(R)T_nSO_2N(R^6)_2$, $N(R)T_nSO_2R^6$, $T_nPO(OR^7)_2$, $T_nOPO(OR^7)_2$, $T_nSP(OR^7)_2$, $T_nPO(OR^7)_2$, o $T_nNPO(OR^7)_2$;

cada Q es un alquilo recto o ramificado independientemente seleccionado de C_1-C_3 ;

T es seleccionado a partir de $-Q-$ o $-Q_m-CH(Q_m-R^2)-$;

cada m y n son independientemente seleccionados a partir de cero o uno;

y R^{10} es seleccionado a partir de R^7 o Ar.

47. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

48. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, en donde:

- (a) R^2 y R^3 son cada uno independientemente seleccionados a partir de halógeno, CN, CO_2R^6 , OR^6 , o R^6 ;
- (b) R^5 es CO_2R , $COAr$, COR , $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (c) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, $N(R)T_nCO_2R^6$, $N(R)T_nNRCO_2R^6$, $N(R)T_nN(R^6)_2$, NO_2 , $T_n(\text{haloalquil})$, $CO_2N(R^6)_2$, COR^6 , SO_2R^6 , o $SO_2N(R^6)_2$.

49. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, en donde dicho compuesto tiene una o más características seleccionadas a partir del grupo que consiste de:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;
- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar , $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

50. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 49, en donde:

- (a) R^2 es hidrógeno, alcoxi, aminoalquilo, o halógeno;
- (b) R^3 es hidrógeno, alcoxi, aralcoxi, o halógeno;

- (c) R^4 es hidrógeno o $(CH_2)_yR^2$;
- (d) R^5 es $CON(R^7)_2$, Ar, $(CH_2)_yCO_2R$, o $(CH_2)_yN(R^7)_2$; y
- (e) R^9 es halógeno, CN, oxo, R^6 , SR^6 , OR^6 , $N(R^6)_2$, $CON(R^6)_2$, CO_2R^6 , $CON(R)COR^6$, o $N(R)T_nCO_2R^6$.

51. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualesquiera de las reivindicaciones 41 a 50; y un portador farmacéuticamente aceptable.

52. La composición de acuerdo con la reivindicación 51, en donde dicho compuesto es formulado en una manera farmacéuticamente aceptable para la administración a un paciente.

53. La composición de acuerdo con la reivindicación 51 que además comprende un agente terapéutico adicional.

54. La composición de acuerdo con la reivindicación 52 que además comprende un agente terapéutico adicional.

55. La composición de acuerdo con la reivindicación 51 que además comprende un agente que incrementa la susceptibilidad de los organismos bacterianos a los antibióticos.

56. La composición de acuerdo con la reivindicación 53 que además comprende un agente que incrementa la susceptibilidad de los organismos bacterianos a los antibióticos.