

743
532

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-031335-00008-0000

Fecha: 2007-08-08 15:20:41 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eva: 379 FASENACIONAL II
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 43

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1. SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una Solicitud

SOLICITANTE	Nombre: ARRAY BIOPHARMA, INC.	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: _____
	Dirección 3200 Walnut Street, Boulder, Colorado Nacionalidad o Domicilio Colorado, Estados Unidos, Lugar de Constitución: DELAWARE, U.S.A. Teléfono _____ Fax: _____ E-mail: _____	
3. REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☒ Cual TP Número: 17.117.818 TP: 17.402
	Dirección: Cr. 13 A No 28-38, Mz 2 Bufete 245. Parque Central Bavaria Teléfono 3419841 Fax: 3368592 E-mail: carlos.tamayo@tmtamayo.net	

4. Número de expediente:

06-31335

5. Descripción de la corrección o modificación solicitada: **EN CUANTO A MODIFICACION:**
A LAS REIVINDICACIONES, SIN EXCEDER EL NIVEL INVENTIVO NI LO

EXPUESTO EN LA MEMORIA DESCRIPTIVA, SINO QUE PRECISA EL ALCANCE DE LA PROTECCION SOLICITADA INICIALMENTE.

ESTAS MODIFICACIONES EN REEMPLAZO DE LAS 85 REIVINDICACIONES

ANTERIORES.

SE ANEXAN 58 NUEVAS REIVINDICACIONES Y EXPLICACION A LAS

MODIFICACIONES DE LAS MISMAS

6. Comprobante de pago No. _____ Fecha **JUNIO 07/2007**

7. Anexos

☒ Comprobante de pago de la tasa.

☐ Poderes, si fuere el caso

☐ Documento que acredite la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

8.

NOMBRE: **CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ**

FIRMA:

C.C. **17.117.818 TP 17.402**

2000-F03

5332

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-031335-00006-0000

Fecha: 2007-08-08 15:20:41 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evs: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 43

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 46,148
FECHA : JUNIO 7 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CARLOS TANAYO Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55094046	07/06/2007	1,418,250.00

***** CONCEPTO *****

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

SOM: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. 06-31335

EXPLICACIÓN A LAS MODIFICACIONES DE LAS REIVINDICACIONES.

La reivindicación 5 se basa en la reivindicación 72 original, incorporando en la definición de "W" el grupo -CONH(SO₂)CH₃ antes incluido en la reivindicación 76.

La reivindicación 6 se basa en la reivindicación 83 original.

La reivindicación 7 se basa en las reivindicaciones 2 y 60 originales.

La reivindicación 8 se basa en la reivindicación 3 original.

La reivindicación 9 se basa en las reivindicaciones 4, 24 y 74 originales.

La reivindicación 10 se basa en las reivindicaciones 5 y 62 originales.

La reivindicación 11 se basa en las reivindicaciones 6 y 76 originales.

Las reivindicaciones 12 a 19 se basan en las reivindicaciones 7 a 14 originales, respectivamente.

La reivindicación 20 se basa en las reivindicaciones 22 y 45 originales.

Las reivindicaciones 21 a 47 se basan en las reivindicaciones originales 23, 25 a 36, 41, 46 a 52, 61, 63, 64, 65, 73 y 75, respectivamente.

La reivindicación 48 se basa en las reivindicaciones 18, 37, 53, 66 y 77 originales.

La reivindicación 49 se basa en las reivindicaciones 15, 38, 54, 67 y 78 originales.

La reivindicación 50 se basa en las reivindicaciones 16, 39, 55, 68 y 79 originales.

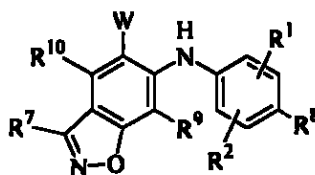
La reivindicación 51 se basa en las reivindicaciones 17, 40, 56, 69 y 80 originales.

La reivindicación 52 se basa en las reivindicaciones 19, 42, 57, 70 y 81 originales.

La reivindicación 53 se basa en las reivindicaciones 20, 43, 58, 71 y 82 originales.

4
535REIVINDICACIONES

1. Un compuesto caracterizado porque es de la fórmula (I)



I

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

R¹, R², R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, de modo independiente, hidrógeno, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -OR³, -C(O)R³, -C(O)OR³, NR⁴C(O)OR⁶, -OC(O)R³, -NR⁴SO₂R⁶, -SO₂NR³R⁴, -NR⁴C(O)R³, -C(O)NR³R⁴, -NR⁵C(O)NR³R⁴, -NR⁵C(NCN)NR³R⁴, -NR³R⁴, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilalquilo C₃-C₁₀, -S(O)_j(alquilo C₁-C₆), -S(O)_j(CR⁴R⁵)_m-arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, -O(CR⁴R⁵)_m-arilo, -NR⁴(CR⁴R⁵)_m-arilo, -O(CR⁴R⁵)_m-heteroarilo, -NR⁴(CR⁴R⁵)_m-heteroarilo, -O(CR⁴R⁵)_m-heterociclilo o -NR⁴(CR⁴R⁵)_m-heterociclilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,

heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^3 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R'''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R'''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

6
537

o R^3 y R^4 juntos, con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R' , R'' y R''' son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo y R'''' es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo, o dos de R' , R'' , R''' o R'''' junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo carbocíclicos, anillos heteroarilo o anillos heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

-7
538

R^4 y R^5 son, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , o R^4 y R^5 junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilo y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R''''$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo,

539

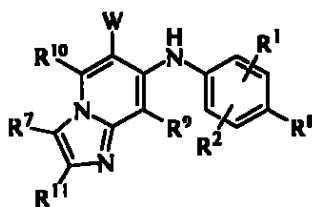
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$, $-CONH(SO_2)CH_3$ y CR^3OR^3 en donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$, $-CONH(SO_2)CH_3$ y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$, $-OR^3$, $-R^2$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} y alquinilo C_2-C_{10} , en donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} y alquinilo C_2-C_{10} están opcionalmente sustituidos con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; y

j es 0, 1 o 2.

2. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque es de la fórmula (II)



II

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

R^1 , R^2 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y R^{11} se seleccionan, de modo independiente, de hidrógeno, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_j$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo o $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro,

trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

o R^7 y R^{11} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos o heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^3 se selecciona de hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato y un residuo de aminoácido, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo,

542

arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

o R^3 y R^4 junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R' , R'' y R''' se seleccionan, de modo independiente, de hidrógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo;

72
5-13

R'''' se selecciona de alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo,

o dos de R', R'', R''' o R'''' junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, anillos heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R⁴ y R⁵ representan, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R⁶ es trifluorometilo, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, o heterociclilalquilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -NR'SO₂R''', -SO₂NR'R'', -C(O)R', -C(O)OR', -OC(O)R', -

$\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{OR}'''''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{SO}_2\text{R}'''''$, $-\text{NR}'\text{R}'$,
 $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{NCN})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{OR}'$, arilo,
 heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo y heterociclilalquilo;

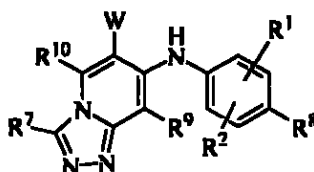
W se selecciona de heteroarilo, heterociclilo, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{OR}^3$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})(\text{cicloalquilo } \text{C}_3-\text{C}_{10})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{alquilo } \text{C}_1-\text{C}_{10})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{arilo})$, $\text{C}(\text{O})(\text{heteroarilo})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{heterociclilo})$ y $-\text{CR}^3\text{OR}^3$, en donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})(\text{cicloalquilo } \text{C}_3-\text{C}_{10})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{alquilo } \text{C}_1-\text{C}_{10})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{arilo})$, $-\text{C}(\text{O})(\text{heteroarilo})$ y $-\text{C}(\text{O})(\text{heterociclilo})$ y $-\text{CR}^3\text{OR}^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de

$-\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{OR}^3$, $-\text{R}^2$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} y alquinilo C_2-C_{10} , en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo y alquinilo están opcionalmente sustituidas con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-\text{NR}^3\text{R}^4$ y $-\text{OR}^3$;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; y

j es 0, 1 o 2.

3. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque es de la fórmula III

14
545

III

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

R^1 , R^2 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} se seleccionan, de modo independiente, de hidrógeno, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_j$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo o $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro,

26
546

trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido,
 $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$,
 $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$,
 $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo,
heteroarilalquilo, heterociclilo y heterocicliclilalquilo;

R^3 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} ,
alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} ,
cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo,
heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo,
heterocicliclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido,
en donde cualquiera de dichas porciones alquilo,
alqueno, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo,
heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y
heterocicliclilalquilo están opcionalmente sustituidas con
uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente,
de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo,
difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$,
 $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$,
 $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$,
 $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo,
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo y heterocicliclilalquilo,

o R^3 y R^4 junto con el átomo al que están unidos, forman un
anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente
saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de

dichos anillos heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR'R''$, $-NR'C(NCN)NR'R''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R' , R'' y R''' son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo o arilalquilo,

R'''' es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo o arilalquilo,

o dos de R' , R'' , R''' o R'''' junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^4 y R^5 son, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

548

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, o heterociclilalquilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R'$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$, o CR^3OR^3 , en donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$ y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$, $-OR^3$, $-R^2$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} y alquinilo C_2-C_{10} , en donde cualquiera de

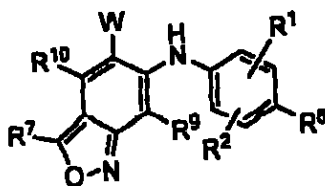
7.8
549

dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} y alquinilo C_2-C_{10} están opcionalmente sustituidos con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; y

j es 0, 1 o 2.

4. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque es de la fórmula IV



IV

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

R^1 , R^2 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, de modo independiente, hidrógeno, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_j(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_j(CR^4R^5)_m\text{-arilo}$, arilo, arilalquilo, heteroarilo,

79
533

heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, -
 $O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo,
 $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo o
 $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo, en donde cualquiera de dichas
porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo,
arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente
sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de
modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro,
trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido,
 $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$,
 $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$,
 $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo,
heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^3 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-
 C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} ,
cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo,
heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo,
heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido,
en donde cualquiera de dichas porciones alquilo,
alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo,
heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y
heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con
uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente,
de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo,

20
551

difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$,
 $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-$
 $NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$,
 $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo,
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo y heterociclilalquilo,

- o R^3 y R^4 junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R' , R'' y R''' son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo,

R'''' es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo,

- o dos de R' , R'' , R''' o R'''' junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en

donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^4 y R^5 son, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R'$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$,

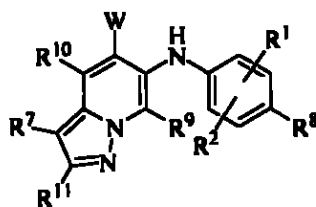
22
553

-C(O) (alquilo C₁-C₁₀), -C(O) (arilo), -C(O) (heteroarilo) y -C(O) (heterociclilo), CR³OR³, en donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, -C(O)OR³, -C(O)NR³R⁴, -C(O)NR⁴OR³, -C(O)R⁴OR³, -C(O) (cicloalquilo C₃-C₁₀), -C(O) (alquilo C₁-C₁₀), -C(O) (arilo), -C(O) (heteroarilo) y -C(O) (heterociclilo), CR³OR³ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de -NR³R⁴, -OR³, -R², alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀ y alquinilo C₂-C₁₀, en donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀ y alquinilo C₂-C₁₀ están opcionalmente sustituidos con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de -NR³R⁴ y -OR³;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; y

j es 0, 1 o 2.

5. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque es de la fórmula V



V

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

R¹, R², R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹ se seleccionan, de modo independiente, de hidrógeno, halo, ciano, nitro,

23
354

trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_j$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo y $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

o R^7 y R^{11} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos o

24
555

heterocíclicos saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^3 se selecciona de hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato y un residuo de aminoácido, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$,

arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

- o R^3 y R^4 juntos, con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos saturados, insaturados y parcialmente saturados están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R' , R'' y R''' se seleccionan, de modo independiente, de hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

R'''' se selecciona de alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

- o dos de R' , R'' , R''' o R'''' juntos, con el átomo al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, insaturado o parcialmente saturado de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos heterocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo saturados, insaturados o parcialmente saturados están opcionalmente

26
557

sustituídos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^4 y R^5 representan, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, o heterociclilalquilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R'$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W se selecciona de heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $C(O)R^4OR^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$, $-CONH(SO_2)CH_3$ y

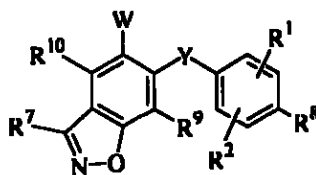
$-\text{CR}^3\text{OR}^3$, en donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})$ (cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$), $-\text{C}(\text{O})$ (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), $-\text{C}(\text{O})$ (arilo), $-\text{C}(\text{O})$ (heteroarilo), $-\text{C}(\text{O})$ (heterociclilo), $-\text{CONH}(\text{SO}_2)\text{CH}_3$ y $-\text{CR}^3\text{OR}^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de

$-\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{OR}^3$, $-\text{R}^2$, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ y alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo y alquinilo están opcionalmente sustituidas con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-\text{NR}^3\text{R}^4$ y $-\text{OR}^3$;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; y

j es 0, 1 o 2.

6. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque es de la fórmula (I)



I

y sus sales, profármacos y solvatos farmacéuticamente aceptables, en donde:

28
527

R^1 , R^2 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, de modo independiente, hidrógeno, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_j$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo o $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclilo, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^3 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo,

29
560

heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SR'$, $-S(O)R''''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

- o R^3 y R^4 junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR'SO_2R''''$, $-SO_2NR'R''$, $-C(O)R'$, $-C(O)OR'$, $-OC(O)R'$, $-NR'C(O)OR''''$, $-NR'C(O)R''$, $-C(O)NR'R''$, $-SO_2R''''$, $-NR'R''$, $-NR'C(O)NR''R'''$, $-NR'C(NCN)NR''R'''$, $-OR'$, arilo,

heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo y heterociclilalquilo;

R', R'' y R''' son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo y R'''' es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, o dos de R', R'', R''' o R'''' junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, anillos heteroarilo o anillos heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R⁴ y R⁵ son, de modo independiente, hidrógeno o alquilo C₁- C₆,
o

R⁴ y R⁵ junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, en donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilo y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halo, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi,

31
562

trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}''''$, $-\text{SO}_2\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}''''$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}'$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{OR}''''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}''$,
 $-\text{SO}_2\text{R}''''$, $-\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{NCN})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{OR}'$,
 arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^6 es trifluorometilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$,
 arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo, heterociclilalquilo, en donde cualquiera
 de dichas porciones alquilo, cicloalquilo, arilo,
 arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente
 sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de
 modo independiente, de oxo, halo, ciano, nitro,
 trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido,
 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}''''$, $-\text{SO}_2\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}'$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}'$,
 $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{OR}''''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}''$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}'\text{R}''$, $-\text{SO}_2\text{R}''''$, $-\text{NR}'\text{R}'$,
 $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{NR}'\text{C}(\text{NCN})\text{NR}''\text{R}'''$, $-\text{OR}'$, arilo,
 heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})$ (cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$),
 $-\text{C}(\text{O})$ (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), $-\text{C}(\text{O})$ (arilo), $-\text{C}(\text{O})$ (heteroarilo),
 $-\text{C}(\text{O})$ (heterociclilo) y CR^3OR^3 en donde cualquiera de
 dichos heteroarilo, heterociclilo, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^4\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})$ (cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$),

32
563

-C(O) (alquilo C₁-C₁₀), -C(O) (arilo), -C(O) (heteroarilo) y -C(O) (heterociclilo), CR³OR³ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de -NR³R⁴, -OR³, -R², alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀ y alquinilo C₂-C₁₀, en donde cualquiera de dichas porciones alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀ y alquinilo C₂-C₁₀ están opcionalmente sustituidos con 1 o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de -NR³R⁴ y -OR³;

m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

j es 0, 1 o 2; y

Y es un ligador.

7. El compuesto de la reivindicación 1 o 4, caracterizado porque R¹ es 2-Cl.

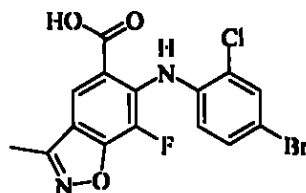
8. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque R⁷ es Me, NH₂ o H.

9. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 5, caracterizado porque R⁸ es Br o Cl.

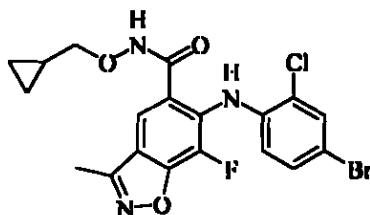
10. El compuesto de la reivindicación 1 o 4, caracterizado porque R⁹ es F.

11. El compuesto de la reivindicación 1 o 5, caracterizado porque W es $-C(O)OH$, $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$, $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$, o $CONH(SO_2)CH_3$.

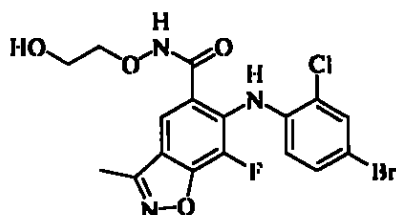
12. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula



13. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula

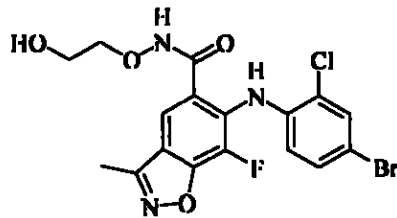


14. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula:

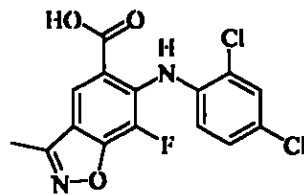


34
565

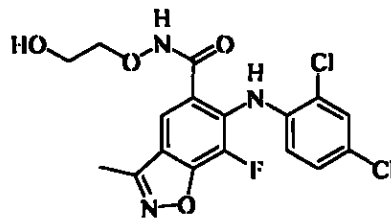
15. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula



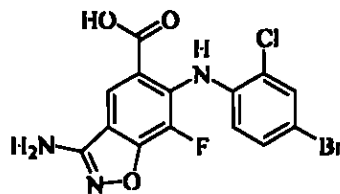
16. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula



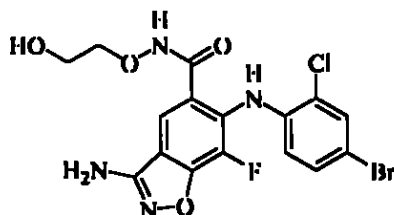
17. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque tiene la fórmula



18. El compuesto de la fórmula 1, caracterizado porque tiene la fórmula:



19. El compuesto de la fórmula 1, caracterizado porque tiene la fórmula



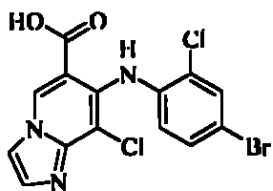
20. El compuesto de la reivindicación 2 o 3, caracterizado porque R^1 es Cl.

21. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque R^7 es H, 1-(4-metilpiperazinilo), morfolinilo, $-NMe_2$ o $-CH_2$ (piperidinilo).

22. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque R^9 es Cl o H.

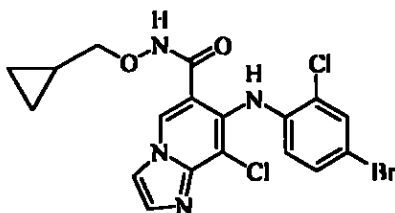
23. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque W es $-COOH$, $-C(O)NHOCH_2$ (ciclopropilo) o $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$.

24. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula

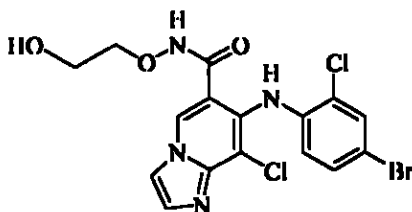


76
567

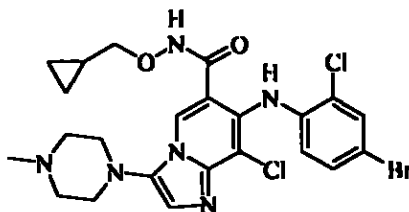
25. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



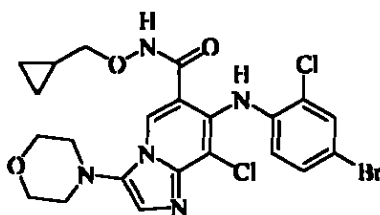
26. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



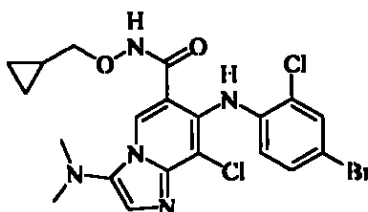
27. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



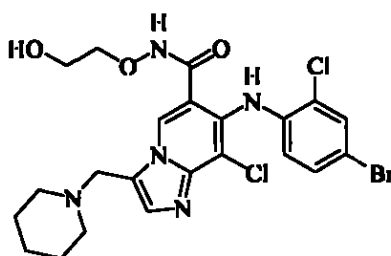
28. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



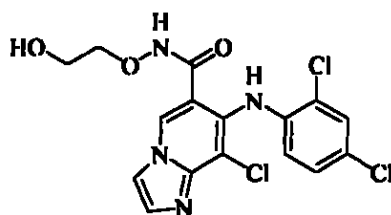
29. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



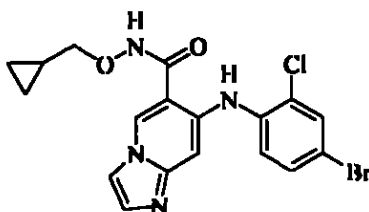
30. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



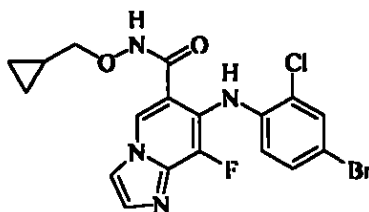
31. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



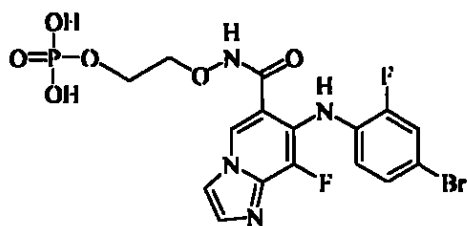
32. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



33. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



34. El compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque tiene la fórmula



38
570

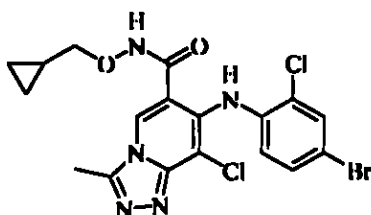
35. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque R^7 es metilo o bencilo.

36. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque R^8 es Br.

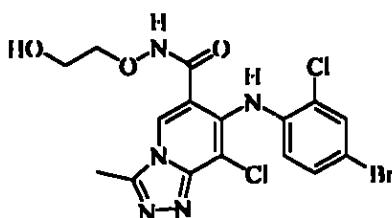
37. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque R^9 es Cl.

38. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque W es $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$ o $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$.

39. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque tiene la fórmula

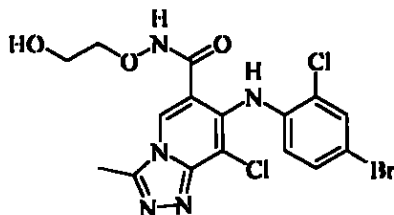


40. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque tiene la fórmula



49
571

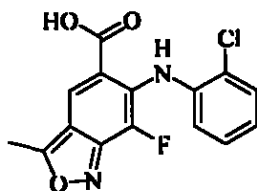
41. El compuesto de la reivindicación 3, caracterizado porque tiene la fórmula



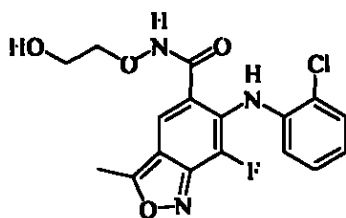
42. El compuesto de la reivindicación 4, caracterizado porque R^7 es metilo.

43. El compuesto de la reivindicación 4, caracterizado porque W es $-\text{COOH}$ o $-\text{C}(\text{O})\text{NHO}(\text{CH}_2)_2\text{OH}$.

44. El compuesto de la reivindicación 4, caracterizado porque tiene la fórmula



45. El compuesto de la reivindicación 4, caracterizado porque tiene la fórmula



41
572

46. El compuesto de la reivindicación 5, caracterizado porque R^1 es 2-Cl, 2H, o 2-F.

47. El compuesto de la reivindicación 5, caracterizado porque R^9 es H, F o Cl.

48. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-47 y un portador farmacéuticamente aceptable.

49. El profármaco de cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, caracterizado porque o comprende el compuesto de la Fórmula I, II, III, IV o V, respectivamente, unido covalentemente a un residuo de aminoácido.

50. El profármaco de la reivindicación 49, caracterizado porque el residuo de aminoácido es valina.

51. El profármaco de la reivindicación 1, 2, 3, 4 o 5, caracterizado porque el profármaco es un éster de fosfato del compuesto de la Fórmula I, II, III, IV o V, respectivamente.

52. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, caracterizado porque es para

42
573

la preparación de un medicamento útil para inhibir la actividad de MEK en un mamífero.

53. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, caracterizado porque es para la preparación de un medicamento útil para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo en un mamífero.

54. Un compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque:

R^1 es 2-Cl;

R^7 es Me, NH_2 o H;

R^8 es Br o Cl;

R^9 es F; y

W es $C(O)OH$, $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$, $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$, o $-CONH(SO_2)CH_3$.

55. Un compuesto de la reivindicación 2, caracterizado porque:

R^1 es 2-Cl;

R^7 es H, 1-(4-metilpiperazinilo), morfolinilo, $-NMe_2$ o $-CH_2(\text{piperidinilo})$;

R^8 es Cl o Br;

R^9 es Cl o H; y

W es $C(O)OH$, $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$, $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$.

56. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque:

43
534

R^1 es Cl;

R^7 es metilo o bencilo;

R^8 es Br;

R^9 es Cl; y

W es $C(O)OH$, $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$, $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$.

57. El compuesto de la reivindicación 4, caracterizado porque

R^1 es 2-Cl;

R^7 es metilo;

R^9 es F; y

W es $C(O)OH$ o $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$.

58. El compuesto de la reivindicación 5, caracterizado porque:

R^1 es 2-Cl, 2-H o 2F;

R^8 es Cl o Br;

R^9 es H, F o Cl; y

W es $C(O)OH$, $-C(O)NHOCH_2-(\text{ciclopropilo})$, $-C(O)NHO(CH_2)_2OH$, o $-CONH(SO_2)CH_3$.