

1

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-196737- -00001-0000

Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 26

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: PI.-**ASTEX THERAPEUTICS LIMITED**.-Solicitud de Patente de Invención
en Fase Nacional PCT para "**INHIBIDORES DE PIRAZOLIL**
QUINAZOLINA CINASA".-Clase **C07D 403/04**.-Expediente número **12-**
196.737.-

1. Me refiero a mi solicitud de patente de 31 de Octubre de 2012.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial Número **658** de 17 de Diciembre de 2012, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. Por otro lado, atentamente me permito manifestar a usted que en el extracto de la solicitud arriba nombrada, publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial número 658 de 17 de Diciembre de 2012, página 605, una de las prioridades y el título aparecen publicados en forma incorrecta. Los datos correctos son:

Prioridad:

10007286.6 30/04/2010 GB

Título:

INHIBIDORES DE PIRAZOLIL QUINAZOLINA CINASA

En vista de lo anterior, muy comedidamente solicito a usted que las aclaraciones correspondientes sean incluidas en la Fe de Erratas de la próxima Gaceta de la Propiedad Industrial.

4. De otra parte, debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar, en forma voluntaria, un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza el actualmente presentado, el cual ahora consta de **30** reivindicaciones, y en el que se han realizado las siguientes modificaciones:

REIVINDICACIÓN	SUSTENTO
1 a 15	Reivindicación 1 a 15 actualmente presentada
16	Página 110 línea 22 de la descripción actualmente presentada.
17	Página 110 línea 25 de la descripción actualmente presentada.
18	Página 111 línea 4, de la descripción originalmente presentada.
19	Reivindicación 16 actualmente presentada
20	Página 308 línea 21, de la descripción actualmente presentada.
21	Página 308 línea 25, de la descripción originalmente presentada.
22	Reivindicación 17 actualmente presentada
23	Reivindicación 18 actualmente presentada
24	Reivindicación 19 actualmente presentada
25	Reivindicación 20 actualmente presentada
26	Reivindicación 21 actualmente presentada
27	Reivindicación 22 actualmente presentada
28	Reivindicación 23 actualmente presentada
29	Reivindicación 24 actualmente presentada
30	Reivindicación 25 actualmente presentada

Finalmente, en relación con las modificaciones expuestas en el presente memorial, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que estas **no amplían** de manera alguna el alcance de la presente invención, tal como fue originalmente presentada, toda vez que tienen como único propósito definir en forma más clara el objeto de la presente invención a través de sus realizaciones preferidas. Adicionalmente, dichas modificaciones se encuentran perfectamente sustentadas en el capítulo descriptivo actualmente presentado en fase nacional, tal como se expuso anteriormente.

5. Atentamente me permito allegar los recibos de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.**ABOGADOS**

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones **11 a 30** del nuevo capítulo reivindicatorio, el cual deberá ser estudiado junto con la presente solicitud.

6. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de correcciones y modificaciones;
- (b) Recibo número 13-0051019, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas;
- (c) Recibos número 13-0035168, 13-0035167, 13-0035166 y 13-0035165, expedidos por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acreditan el pago de la tasa mencionada que causan las reivindicaciones adicionales;
- (d) Recibo número 13-0045952, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que causa el examen de patentabilidad; y
- (e) Copia de las nuevas páginas 708 a 724 que corresponden al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de **30** reivindicaciones.

7. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

Dirección para Notificaciones: **notificacionespatentes@lloredacamacho.com**



Espacio reservado para el adhesivo de radicación

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

- ☐ Error material
- ☒ Modificación a una Solicitud en trámite
- ☒ Patente de Invención
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad
- ☐ Registro de Diseño Industrial
- ☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del Solicitante:

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

ASTEX THERAPEUTICS LIMITED
Nombre o Denominación / Nombre o Razón Social Completa

ALICIA LLOREDA RICAURTE
Nombre Representante Legal

Tipo de Empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☒

Documento de Identificación ☒ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número **39.690.713**

Nacionalidad / País de Constitución	Dirección y Domicilio del Titular	Ciudad
Inglaterra	436 Cambridge Science Park, Milton Road, Cambridge CB4 0QA, Inglaterra.	Cambridge
Dirección Electrónica		Número Telefónico
notificacionespatentes@lloredacamacho.com		3264270

☒ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del Apoderado:

LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apellidos y Nombre

C.C. 39.690.713
Documento de Identificación

53.215
Tarjeta Profesional

Dirección y Domicilio		Ciudad
Calle 72 No. 5-83 Piso 5º		Bogotá D.C.
Dirección Electrónica	No. Fax	Número Telefónico
notificacionespatentes@lloredacamacho.com	6069701	3264270

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general _____

4. Datos del Trámite

Corrección:

Expediente No. 12-196.737

Aparece _____

Debe ser _____

Modificación:

☒ Modificación al Capítulo Reivindicatorio.

☐ Modificación al Capítulo Descriptivo.

☐ Modificación al Resumen.

☐ Modificación a los Dibujos.

☐ Modificación al Solicitante.

5. Anexos

☒ Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación.

☐ Poder, si fuere el caso.

☐ Documento que contiene las modificaciones o correcciones.

☐ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma

Nombre y apellidos

ALICIA LLOREDA RICAURTE

Representante
Apoderado

Firma

C.C. 39.690.713

Tarjeta Profesional 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 0051019

Bogotá D.C., Mayo 27 de 2013 - 16:38:19

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A. NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	534292776	27/05/2013	6.295.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION	125.000.00	125.000.00
				\$125.000.00

SON: **CIENTO VEINTICINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable:

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-196737- -00001-0000

Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Mayo 27 de 2013 - 16:38:22

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

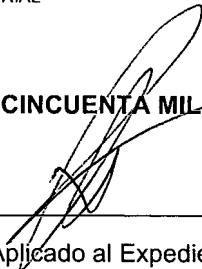
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0035168
		Bogotá D.C., Abril 15 de 2013 - 16:49:09

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A. NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	561170201	15/04/2013	15.484.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	
			Vr. UNIDITARIO Vr. CONCEPTO
			150.000.00 150.000.00
			\$150.000.00
			=====

SON: **CIENTO CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 12-196737- -00001-0000
Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0035167
		Bogotá D.C., Abril 15 de 2013 - 16:49:09

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A. NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	561170201	15/04/2013	15.484.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	VR. CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	150.000.00
			\$150.000.00

SON: **CIENTO CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 12-196737- -00001-0000
Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 0035166

Bogotá D.C., Abril 15 de 2013 - 16:49:09

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A. NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	561170201	15/04/2013	15.484.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	150.000.00	150.000.00
				\$150.000.00

SON: **CIENTO CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-196737- -00001-0000

Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Abril 15 de 2013 - 16:49:17

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0035165
		Bogotá D.C., Abril 15 de 2013 - 16:49:09

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.					NI 830.022.145
*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	561170201	15/04/2013	15.484.000.00

*** Conceptos Pagados ***					
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO	
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	150.000.00	150.000.00	
					\$150.000.00

SON: **CIENTO CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 12-196737- -00001-0000
Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 0045952

Bogotá D.C., Mayo 14 de 2013 - 14:03:00

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A. NI 830.022.145

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	534292780	14/05/2013	12.120.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILIDAD DE INVENSIÓN	505.000.00	505.000.00
				\$505.000.00

SON: **QUINIENTOS CINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-196737- -00001-0000

Fecha: 2013-06-13 16:41:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 26

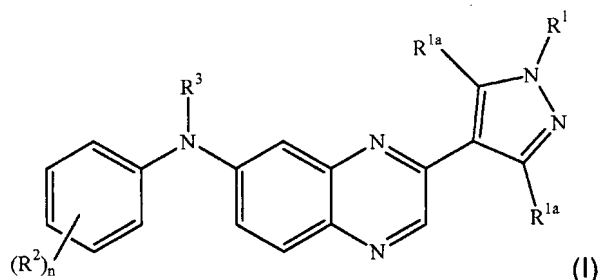
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Mayo 14 de 2013 - 14:03:22

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I):



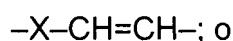
incluyendo cualquier forma tautomérica o estereoquímicamente isomérica del mismo, en donde

n representa un número entero igual a 0, 1, 2, 3 ó 4;

R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₄, hidroxialquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆, cianoalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, en donde cada alquilo C₁₋₆ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR⁴R⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-NR⁴R⁵, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹²-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-R⁶, hidroxialquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con -Si(CH₃)₃, alquilo C₁₋₆ sustituido con -P(=O)(OH)₂ o alquilo C₁₋₆ sustituido con -P(=O)(O-alquilo C₁₋₆)₂;

cada R^{1a} se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C₁₋₄, hidroxialquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ sustituido con amino o mono- o di(alquil C₁₋₄)amino o -NH(cicloalquilo C₃₋₈), cianoalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄-alquilo C₁₋₄ y alquilo C₁₋₄ sustituido con uno o varios átomos de flúor;

cada R^2 se selecciona independientemente de hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_{1-4} , alqueno C_{2-4} , alquino C_{2-4} , alcoxi C_{1-4} , hidroxialquilo C_{1-4} , hidroxialcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , hidroxihaloalquilo C_{1-4} , hidroxihaloalcoxi C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} -alquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} -alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} -alquilo C_{1-4} , en donde cada alquilo C_{1-4} puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, hidroxihaloalcoxi C_{1-4} -alquilo C_{1-4} , R^{13} , alquilo C_{1-4} sustituido con R^{13} , alquilo C_{1-4} sustituido con $-C(=O)-R^{13}$, alcoxi C_{1-4} sustituido con R^{13} , alcoxi C_{1-4} sustituido con $-C(=O)-R^{13}$, $-C(=O)-R^{13}$, alquilo C_{1-4} sustituido con $-NR^7R^8$, alquilo C_{1-4} sustituido con $-C(=O)-NR^7R^8$, alcoxi C_{1-4} sustituido con $-NR^7R^8$, alcoxi C_{1-4} sustituido con $-C(=O)-NR^7R^8$, $-NR^7R^8$ y $-C(=O)-NR^7R^8$; o cuando dos grupos R^2 están unidos a átomos de carbono adyacentes, se pueden tomar juntos para formar un radical de la fórmula:



$-X-CH=N-$; en donde R^{17} representa hidrógeno o flúor, p representa 1 ó 2 y X representa O o S;

R^3 representa hidroxilo, alcoxi C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con $-NR^{10}R^{11}$, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con $-O-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, hidroxialquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con $-O-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, hidroxialqueno C_{2-6} , hidroxialquino C_{2-6} , hidroxihaloalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con carboxilo, alquilo C_{1-6} sustituido con $-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-C(=O)-O-alquilo C_{1-6}$, alquilo C_{1-6} sustituido con alcoxi C_{1-6} -alquilo $C_{1-6}-O-C(=O)-$, alquilo C_{1-6} sustituido con alcoxi C_{1-6} -alquilo $C_{1-6}-C(=O)-$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-O-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, alcoxi C_{1-6} -alquilo C_{1-6} , en donde cada alquilo C_{1-6} puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo o con $-O-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, alqueno C_{2-6} sustituido con alcoxi C_{1-6} , alquino C_{2-6} sustituido con alcoxi C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con R^9 y opcionalmente sustituido con $-O-C(=O)-alquilo C_{1-6}$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-C(=O)-R^9$, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo y R^9 , alqueno C_{2-6} sustituido con R^9 , alquino C_{2-6} sustituido con R^9 , alquilo C_{1-6} sustituido con -

NR¹⁰R¹¹, alqueno C₂₋₆ sustituido con -NR¹⁰R¹¹, alqueno C₂₋₆ sustituido con -NR¹⁰R¹¹, alquilo C₁₋₆ sustituido con hidroxilo y -NR¹⁰R¹¹, alquilo C₁₋₆ sustituido con uno o dos halógenos y -NR¹⁰R¹¹, -alquilo C₁₋₆-C(R¹²)=N-O-R¹², alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-NR¹⁰R¹¹, alquilo C₁₋₆ sustituido con -O-C(=O)-NR¹⁰R¹¹, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹²-S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹²-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, R¹³, alquilo C₁₋₆ sustituido con -P(=O)(OH)₂ o alquilo C₁₋₆ sustituido con -P(=O)(O-alquilo C₁₋₆)₂;

R⁴ y R⁵ representan cada uno, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, en donde cada alquilo C₁₋₆ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, R¹³ o alquilo C₁₋₆ sustituido con R¹³;

R⁶ representa cicloalquilo C₃₋₈, cicloalqueno C₃₋₈, fenilo, heterociclilo monocíclico de 4 a 7 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O o S; estando dicho cicloalquilo C₃₋₈, cicloalqueno C₃₋₈, fenilo, heterociclilo monocíclico de 4 a 7 miembros, opcionalmente, y cada uno de manera independiente, sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, cada sustituyente independientemente seleccionado de ciano, alquilo C₁₋₆, cianoalquilo C₁₋₆, hidroxilo, carboxilo, hidroxialquilo C₁₋₆, halógeno, haloalquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆-O-C(=O)-, -NR¹⁴R¹⁵, -C(=O)-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-NR¹⁴R¹⁵, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo

C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆ o alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵;

R⁷ y R⁸ representan, cada uno de manera independiente, hidrógeno, alquilo C₁₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆ o alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆;

R⁹ representa cicloalquilo C₃₋₈, cicloalquenilo C₃₋₈, fenilo, naftilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico de 3 a 12 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O o S, estando dicho cicloalquilo C₃₋₈, cicloalquenilo C₃₋₈, fenilo, naftilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico de 3 a 12 miembros opcional e independientemente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, cada sustituyente independientemente seleccionado de =O, alquilo C₁₋₄, hidroxilo, carboxilo, hidroxialquilo C₁₋₄, ciano, cianoalquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₄-O-C(=O)-, alquilo C₁₋₄ sustituido con alquilo C₁₋₄-O-C(=O)-, alquilo C₁₋₄-C(=O)-, alcoxi C₁₋₄-alquilo C₁₋₄, en donde cada alquilo C₁₋₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, halógeno, haloalquilo C₁₋₄, hidroxihaloalquilo C₁₋₄, -NR¹⁴R¹⁵, -C(=O)-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₄ sustituido con -NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₄ sustituido con -C(=O)-NR¹⁴R¹⁵, alcoxi C₁₋₄, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₄, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₄, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₄ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₄ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ sustituido con -NH-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, R¹³, -C(=O)-R¹³, alquilo C₁₋₄ sustituido con R¹³, fenilo opcionalmente sustituido con R¹⁶, fenil-alquilo C₁₋₆, en donde el fenilo está opcionalmente sustituido con R¹⁶, un heterociclilo monocíclico aromático de 5 ó 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O o S en donde dicho heterociclilo está opcionalmente sustituido con R¹⁶; o cuando dos de los sustituyentes de R⁹ están unidos al mismo átomo, se pueden tomar juntos para formar un heterociclilo monocíclico saturado de 4 a 7 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O o S;

R¹⁰ y R¹¹ representan, cada uno independientemente, hidrógeno, carboxilo, alquilo C₁₋₆, cianoalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹⁴R¹⁵,

alquilo C₁₋₆ sustituido con $-C(=O)-NR^{14}R^{15}$, haloalquilo C₁₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, en donde cada alquilo C₁₋₆ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶, $-C(=O)-R^6$, $-C(=O)-alquilo\ C_{1-6}$, $-C(=O)-hidroxialquilo\ C_{1-6}$, $-C(=O)-haloalquilo\ C_{1-6}$, $-C(=O)-hidroxihaloalquilo\ C_{1-6}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-Si(CH_3)_3$, $-S(=O)_2-alquilo\ C_{1-6}$, $-S(=O)_2-haloalquilo\ C_{1-6}$, $-S(=O)_2-NR^{14}R^{15}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-S(=O)_2-alquilo\ C_{1-6}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-S(=O)_2-haloalquilo\ C_{1-6}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-S(=O)_2-NR^{14}R^{15}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-NH-S(=O)_2-alquilo\ C_{1-6}$, alquilo C₁₋₆ sustituido con $-NH-S(=O)_2-haloalquilo\ C_{1-6}$ o alquilo C₁₋₆ sustituido con $-NH-S(=O)_2-NR^{14}R^{15}$;

R¹² representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido con alcoxi C₁₋₄;

R¹³ representa cicloalquilo C₃₋₈ o un heterociclilo monocíclico saturado de 4 a 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O o S, en donde dicho cicloalquilo C₃₋₈ o heterociclilo monocíclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₆, $-C(=O)-alquilo\ C_{1-6}$, alcoxi C₁₋₆ o $-NR^{14}R^{15}$;

R¹⁴ y R¹⁵ representan, cada uno independientemente, hidrógeno o haloalquilo C₁₋₄ o alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado de hidroxilo, alcoxi C₁₋₄, amino o mono- o di(alquil C₁₋₄)amino;

R¹⁶ representa hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, $-NR^{14}R^{15}$ o $-C(=O)NR^{14}R^{15}$;

un N-óxido de los mismos, una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos o un solvato de los mismos.

2. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi

C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, en donde cada alquilo C₁₋₆ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR⁴R⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-NR⁴R⁵, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-R⁶, hidroxialquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶ o alquilo C₁₋₆ sustituido con -Si(CH₃)₃; en donde cada R^{1a} es hidrógeno; en donde R¹⁰ y R¹¹ representan cada uno, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁₋₆, cianoalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -C(=O)-NR¹⁴R¹⁵, haloalquilo C₁₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, hidroxihaloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆, en donde cada alquilo C₁₋₆ puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, R⁶, alquilo C₁₋₆ sustituido con R⁶, -C(=O)-R⁶, -C(=O)-alquilo C₁₋₆, -C(=O)-hidroxialquilo C₁₋₆, -C(=O)-haloalquilo C₁₋₆, -C(=O)-hidroxihaloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -Si(CH₃)₃, -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-haloalquilo C₁₋₆ o alquilo C₁₋₆ sustituido con -NH-S(=O)₂-NR¹⁴R¹⁵.

3. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde cada R^{1a} es hidrógeno.

4. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R¹ representa alquilo C₁₋₆.

5. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R¹ representa CH₃- o CD₃.

6. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R² se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄, hidroxialquilo C₁₋₄, hidroxialcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄-alquilo C₁₋₄, R¹³, alcoxi C₁₋₄ sustituido con R¹³, -C(=O)-R¹³, alquilo C₁₋₄ sustituido con NR⁷R⁸, alcoxi C₁₋₄

sustituido con NR^7R^8 , $-\text{NR}^7\text{R}^8$ y $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^7\text{R}^8$;

7. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 6, en donde R^2 representa alquilo C_{1-6} .

8. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 6 o la reivindicación 7, en donde R^2 representa $\text{CH}_3\text{O}-$ o $\text{CD}_3\text{O}-$.

9. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R^3 representa alquilo C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxihaloalquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{C}(=\text{O})-$ alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} -alquilo C_{1-6} , en donde cada alquilo C_{1-6} puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, alquilo C_{1-6} sustituido con R^9 , alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo y $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, alquilo C_{1-6} sustituido con uno o dos halógenos y $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}$ -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, alquilo C_{1-6} sustituido con carboxilo, alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{NR}^{12}-\text{S}(=\text{O})_2$ -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{NR}^{12}-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NR}^{14}\text{R}^{15}$, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo y R^9 , -alquilo $\text{C}_{1-6}-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{N}-\text{O}-\text{R}^{12}$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^9$, alquinilo C_{2-6} sustituido con R^9 , hidroxialcoxi C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , C_{2-6} alquinilo o R^{13} .

10. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde R^1 representa alquilo C_{1-6} , cada R^{1a} es hidrógeno, n representa un número entero igual a 2 y cada R^2 representa alcoxi C_{1-4} y R^3 representa alquilo C_{1-6} sustituido con $-\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$.

11. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 10, en donde R^{10} representa hidrógeno o alquilo C_{1-6} y R^{11} representa hidrógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-\text{C}(=\text{O})$ -alquilo C_{1-6} , $-\text{S}(=\text{O})_2$ -alquilo C_{1-6} , $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NR}^{14}\text{R}^{15}$, hidroxialquilo C_{1-6} , $-\text{C}(=\text{O})$ -hidroxihaloalquilo C_{1-6} , $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^6$, cianoalquilo C_{1-6} , R^6 , alquilo C_{1-6} sustituido con R^6 , $-\text{C}(=\text{O})$ -haloalquilo C_{1-6} o

alquilo C₁₋₆ sustituido con -Si(CH₃)₃.

12. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 10, en donde R¹⁰ representa hidrógeno, -CH₃, -CH₂CH₃ o -CH(CH₃)₂ y R¹¹ representa hidrógeno, -CH₃, -CH₂CH₃ o -CH(CH₃)₂, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂ o -CH₂CH₂F, -C(=O)-CH₃, -S(=O)₂-CH₃, -S(=O)₂-CH₂CH₃, -S(=O)₂-CH(CH₃)₂, -S(=O)₂-N(CH₃)₂, -CH₂CH₂OH, -C(=O)-C(OH)(CH₃)CF₃, -C(=O)-ciclopropilo, -CH₂CH₂CN, ciclopropano, ciclopentano, 2,2,6,6-tetrametil-piperidina, -CH₂C₃H₅, -CH₂-tetrahidrofurano, -C(=O)-(1-metil-piperidin-3-ilo), -C(=O)-CF₃, -CH₂Si(CH₃)₃ o -CH₂-C₆H₅.

13. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 10, en donde R¹ representa -CH₃, cada R^{1a} es hidrógeno, n representa un número entero igual a 2 y cada R² representa CH₃O- y R³ representa -CH₂-CH₂NHCH(CH₃)₂.

14. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 10, en donde R¹ representa -CH₃, cada R^{1a} es hidrógeno, n representa un número entero igual a 2 y cada R² representa CH₃O-, R³ representa -CH₂CH₂-CH₂-NHCH₂CF₃.

15. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 10, en donde R¹ representa -CH₃, cada R^{1a} es hidrógeno, n representa un número entero igual a 2 y cada R² representa CH₃O-, R³ representa -CH₂CH₂NH₂.

16. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto es N-(3,5-dimetoxifenil)-N-[3-(1-metil-1H-pirazol-4-il)quinoxalin-6-il]-N'-(2,2,2-trifluoroetil)propano-1,3-diamina.

17. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto es N-(3,5-dimetoxifenil)-N'-(1-metiletil)-N-[3-(1-metil-1H-pirazol-4-il)quinoxalin-6-il]etano-1,2-diamina.

18. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto es N-(3,5-dimetoxifenil)-N-[3-(1-metil-1H-pirazol-4-il)quinoxalin-6-il]etano-1,2-diamina.

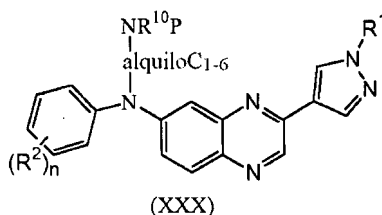
19. Un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

20. Una combinación de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes con otro agente anti cáncer.

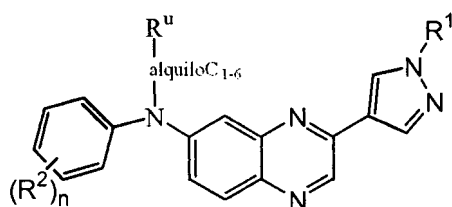
21. Un producto que contiene como primer ingrediente activo un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 y como ingrediente activo adicional uno o más agentes anti cáncer, como una preparación combinada para uso simultáneo, separado o secuencial en el tratamiento de pacientes que sufren de cáncer.

22. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, caracterizado porque comprende:

(i) desprotección de un compuesto de fórmula (XXX), en donde P representa un grupo protector apropiado, en presencia de un ácido apropiado,



(ii) la reacción de un compuesto de fórmula (IX) o (IX'):



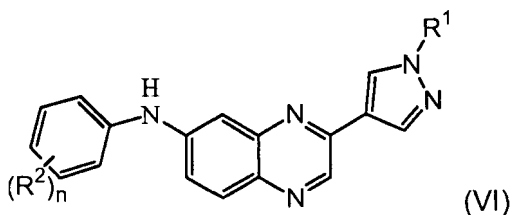
(IX) : R^u es $-O-S(=O)_2-CH_3$

(IX') : R^u es Cl

o un forma protegida del mismo, con una amina apropiadamente sustituida o un derivado reactivo de la misma, tal como, por ejemplo, $NHR^{10}R^{11}$ (X), $NHR^{10}P$ (X-a) o un anillo adecuado que contiene nitrógeno dentro de la definición de

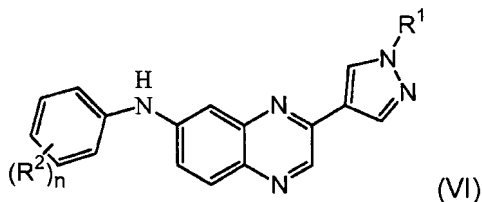
R^9 : $H-N$ (XI), por ejemplo, en un recipiente sellado, en presencia de una base apropiada y/o en presencia o ausencia de un solvente; o

(iii) la reacción de un compuesto de la fórmula (VI):



o una forma protegida del mismo, con un compuesto de fórmula W_6 -alquilo C_{1-6} - $NR^{10}P$, en donde P representa un grupo protector apropiado y W_6 representa un grupo saliente apropiado, en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado, seguido de la remoción de P y opcionalmente la remoción de cualquier otro grupo protector presente; o

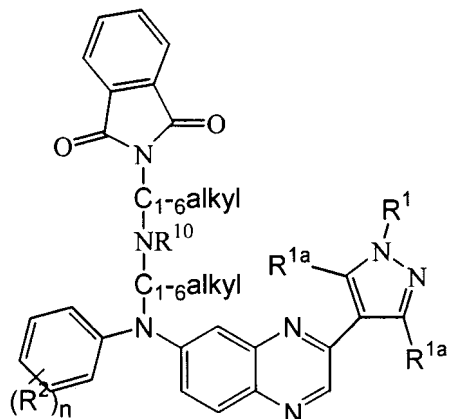
(iv) la reacción de un compuesto de la fórmula (VI):



o una forma protegida del mismo, con un compuesto de fórmula W_6 -

alquilo $C_{1-6}-NHR^{10}$, en donde W_6 representa un grupo saliente apropiado, en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

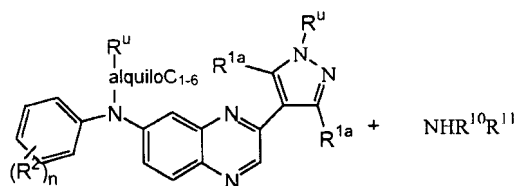
(v) la reacción de un compuesto de fórmula (XXXVI)



(XXXVI)

con hidrazina en presencia de un solvente apropiado;

(vi) la reacción de un compuesto de fórmula (IX-1), en donde R^u representa $-O-S(=O)_2-CH_3$,

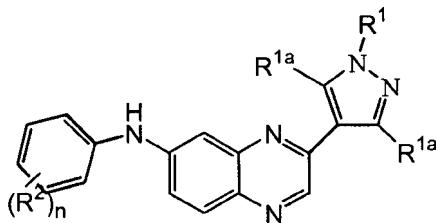


(IX-1)

(X)

con un intermediario de fórmula (X) en presencia de un solvente apropiado;

(vii) la reacción de un compuesto de fórmula (VI)

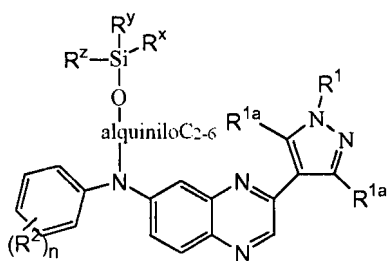


(VI)

con un intermediario de fórmula $W_{11}-R^{3b}$ en donde R^{3b} representa

alquínilo C_{2-6} opcionalmente sustituido y W_{11} representa un grupo saliente apropiado, en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

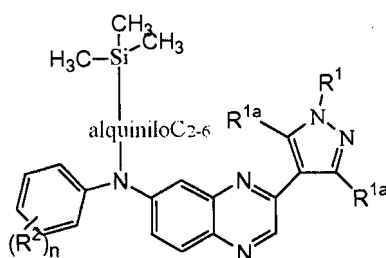
(viii) la reacción de un compuesto de fórmula (VIII'), en donde R^x y R^y representan alquilo C_{1-4} y R^z representa alquilo C_{1-4} o fenilo,



(VIII')

con un ácido apropiado, en presencia de un solvente apropiado;

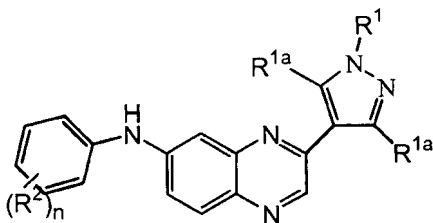
(viii) desprotección de un compuesto de fórmula (XXXXII)



(XXXXII)

en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

(ix) la reacción de un compuesto de fórmula (VI)

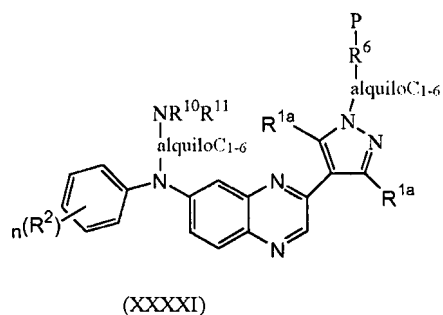


(VI)

con di(alquil C_{1-6})vinilfosfonato en presencia de un catalizador

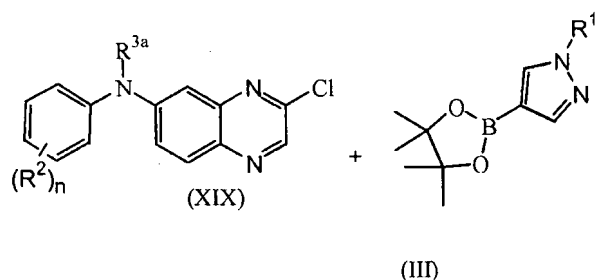
apropiado y un solvente apropiado;

(x) desprotección de un compuesto de fórmula (XXXXI)



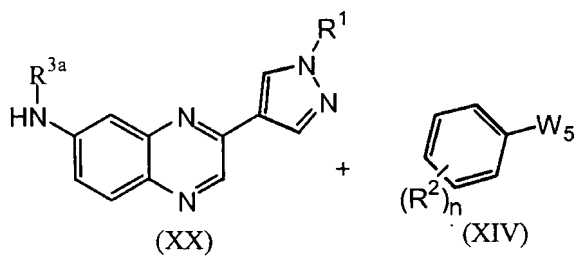
en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

(xi) la reacción de un compuesto de fórmula (XIX) con un compuesto de fórmula (III)



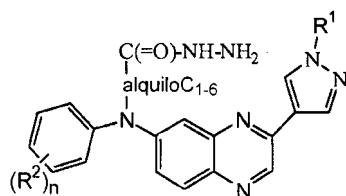
en presencia de un catalizador apropiado, un ligando apropiado, una base apropiada y un solvente apropiado;

(xii) la reacción de un compuesto de fórmula (XX), en donde R³ᵃ representa alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, con un compuesto de fórmula (XIV)



en presencia de un catalizador apropiado, un ligando apropiado, una base apropiada y un solvente apropiado;

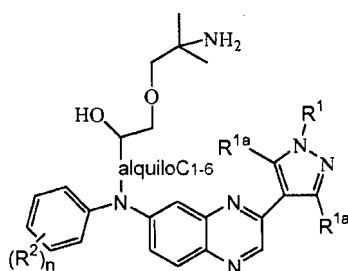
(xiii) la reacción de un compuesto de la fórmula (XXXI)



(XXXI)

con W_8-CN , en donde W_8 representa un grupo saliente apropiado, en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

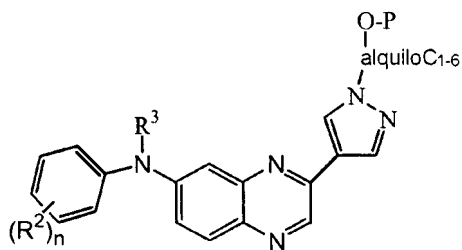
(xiv) la reacción de un compuesto de fórmula (XXXV)



(XXXV)

con una base apropiada en presencia de un solvente apropiado;

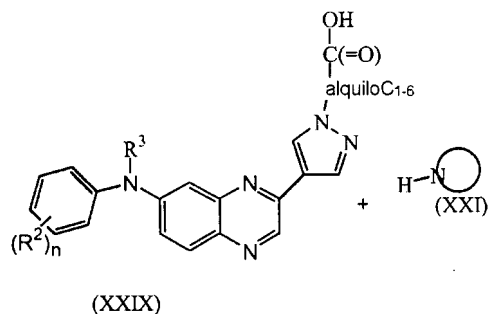
(xv) desprotección de un compuesto de la fórmula (XXVI), en donde P representa un grupo protector apropiado,



(XXVI)

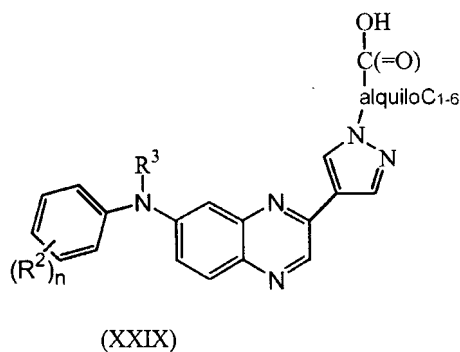
en presencia de un ácido apropiado o un agente de desililación apropiado y un solvente apropiado;

(xvi) la reacción de un compuesto de fórmula (XXIX) con un compuesto de fórmula (XXI)



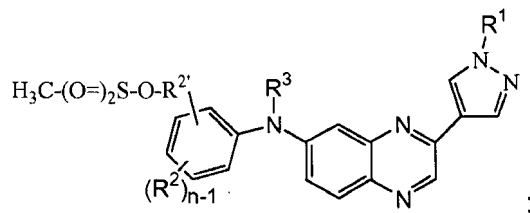
en presencia de reactivos de acoplamiento de péptidos apropiados;

(xvii) la reacción de un compuesto de fórmula (XXIX)



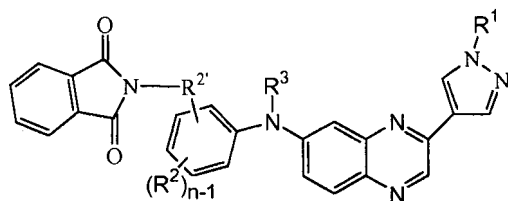
con NHR^4R^5 en presencia de reactivos de acoplamiento de péptidos apropiados y una base apropiada y un solvente apropiado;

(xviii) reacción del siguiente compuesto



con NHR^7R^8 en presencia de una base apropiada y un solvente apropiado;

(xviii) desprotección del siguiente compuesto



en presencia de monohidrato de hidrazina y un solvente apropiado;

en donde R^1 , R^{1a} , R^2 , R^3 , R^{10} y n son tal como se definen aquí; y opcionalmente después, conversión de un compuesto de la fórmula (I) en otro compuesto de la fórmula (I).

23. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la fórmula (I) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19.

24. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 para usarse en terapia.

25. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 para usarse en la prevención o el tratamiento de un estado o condición patológica mediados por una FGFR cinasa.

26. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 para usarse en la prevención o el tratamiento del cáncer.

27. Uso de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, para la fabricación de un medicamento para la prevención o el tratamiento de un estado o condición patológica mediados por una FGFR cinasa.

28. Uso de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, para la fabricación de un medicamento para la prevención o el tratamiento de cáncer.

29. Uso de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 para la fabricación de un medicamento para la prevención o el tratamiento de un estado o condición patológica tal como se describe aquí.

30. Un método para la prevención o el tratamiento de un estado o condición patológica mediados por una FGFR cinasa, que comprende la administración a un sujeto en necesidad del mismo, un compuesto de la fórmula (I) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19.