

AVISO DE NOTIFICACION
CORREO CERTIFICADO
Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

498
100

Radicación :	6-73210- -5-0	Fecha: 2008-09-01 08:18:30
Trámite :	11 PATENTEIYII	
Evento :	378 FASENACIONALI	
Actuación :	432 COMUNICACTOADM	
Destinatario :	HUMBERTO RUBIO CAMACHO Folios 1	

Señor (a) (es)
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
CRA. 7 # 74 - 64 OFC. 506
BOGOTA D.C.

Referencia RESOLUCION : 32832
Fecha : 29/08/2008
Expediente : 6-73210
Trámite : 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II
Evento : 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
Actuación : 432 COMUNICACION ACTO ADMINISTRATIVO

Comendidamente le solicito presentarse a este Despacho ubicado en la Carrera 13 No. 27 - 00 Piso Quinto (5), de la ciudad de Bogotá D.C., dentro del término de cinco (5) días hábiles contados a partir del envío de la presente citación, en horario de 8:00 a.m. a 4:30 p.m. jornada continua, con el fin de notificarle personalmente el contenido de la resolución de la referencia proferida dentro del expediente tramitado con el número de radicación citado en el asunto.

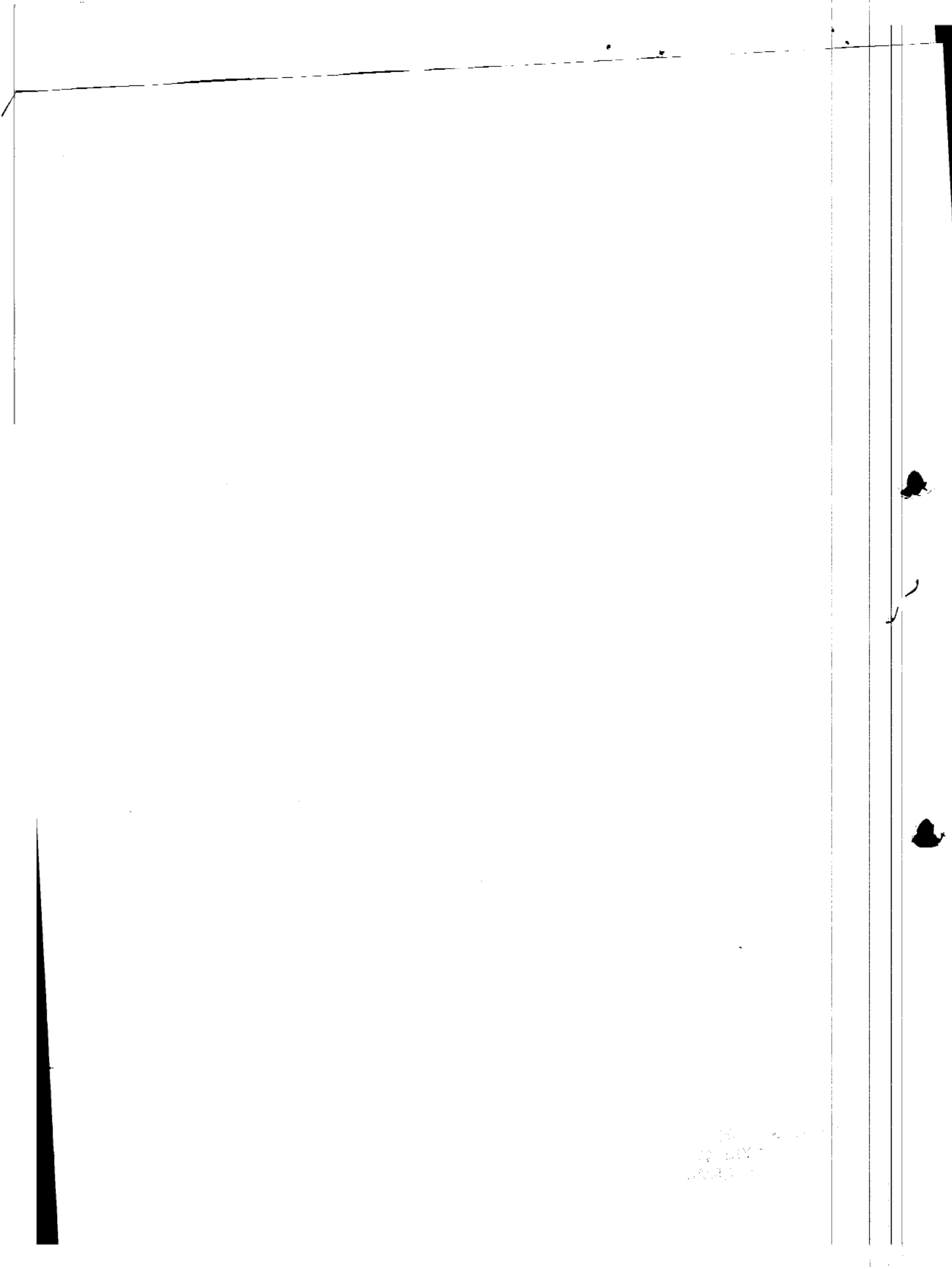
De no hacerse presente en el término indicado anteriormente, la providencia en mención se notificará por edicto, el cual se fijará por el término de diez (10) días en el Centro de Documentación e Información.

Para su comodidad el texto completo de la resolución se encontrará disponible en la página web de la Entidad desde el día hábil siguiente al de su notificación, la cual podrá ser consultada desde un computador con acceso a Internet, en la página www.sic.gov.co, con el número de resolución a través de la opción servicios en línea - caracter general - consulta actos administrativos.

Secretaria General
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Al contestar favor indique el número de radicación consignado en el sticker

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Cra 50 No. 26-55 Int 2 PBX: 3820840
Fax: 3 82 26 95 3 50 52 20. Línea 018000 910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia



REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

Rad. PCT/06-073210

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 26 de julio del 2006 bajo el número 06-073210, se presentó la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE TIAZOL", para los efectos de que se dé comienzo a la fase nacional, en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial Nº 583 del 18 de diciembre del 2007 y posteriormente rectificada la publicación en la Gaceta 589 de 29 de febrero de 2008.

TERCERO: Que el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, establece que: *"Dentro del plazo de seis meses contados desde la publicación de la solicitud, independientemente que se hubieren presentado oposiciones, el solicitante deberá pedir que se examine si la invención es patentable. Los Países Miembros podrán cobrar una tasa para la realización de este examen. Si transcurriera dicho plazo sin que el solicitante hubiera pedido que se realice el examen, la solicitud caerá en abandono"*.

CUARTO: Que contados seis meses desde la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial, no se presentó petición de parte del interesado para efectuar el examen de fondo, razón por la cual se considera abandonada la solicitud en los términos del mencionado artículo 44.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Declarar abandonada la solicitud de privilegio de patente de invención que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.



REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION N° 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

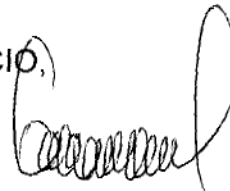
Rad. PCT/06-073210

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Humberto Rubio Camacho, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Kyowa Hakko Kogyo Co., LTD, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición a interponer ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 29 AGO. 2008

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
Carrera 7 N° 74-64, Ofic. 506
Bogotá D.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL

La presente resolución se dio por notificada el 8 SET. 2008
mediante memorial suscrito por el Doctor(a) Humberto Rubio Camacho
(Artículo 46 C.C.A.)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL AD-HOC

NOTIFICADOR

621
1001
U95

nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_6 , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo;

522
~~100~~
 4/6

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) o CR^3OR^3 , donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, azido, $-NR^3R^4$, $-OR^3$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo, donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

923
1003
497

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde Y es NH.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, donde X es CR^{10} , y R^{10} es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ y $C(O)NR^4S(O)_2R^3$, donde cualquiera de dichos heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ o $C(O)NR^4S(O)_2R^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

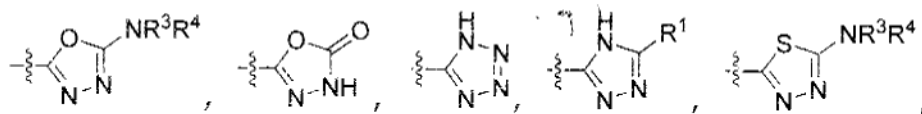
629
1204
408

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 ; y

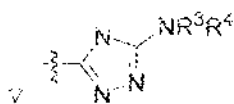
R^3 está seleccionado de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde

W está seleccionado de



075
125
109



8. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^1 es alquilo C_1-C_4 , alquénilo C_2-C_3 o alquínilo C_2-C_4 , donde dicho alquilo C_1-C_4 , alquénilo C_2-C_3 y alquínilo C_2-C_4 puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitró, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo, heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitró, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquénilo C_2-C_3 , alquínilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^2 .

9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^2 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitró, azido, nitrilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^3 .

527
1000
500

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, donde R^3 y R^2 son independientemente hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

11. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 11, donde Y es NH, R^1 es halógeno, R^2 es halógeno, R^3 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es H.

13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde X es N.

14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13, donde R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 14, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo

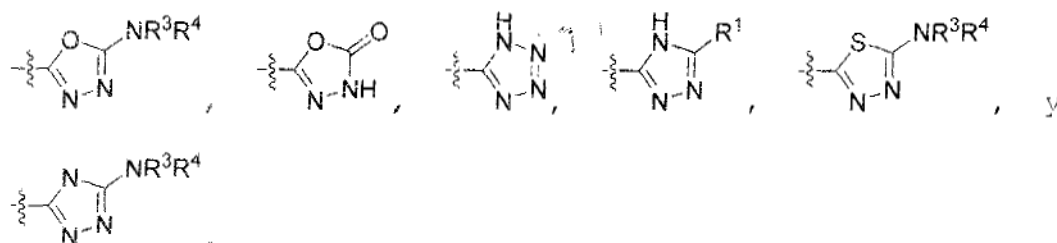


678
1007
501

C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³; y

R³ está seleccionado de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 14, donde W está seleccionado de



17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 15 o la reivindicación 16, donde R¹ es alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄ y alquinilo C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo,

G29
1003
502

heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³.

18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR¹¹.

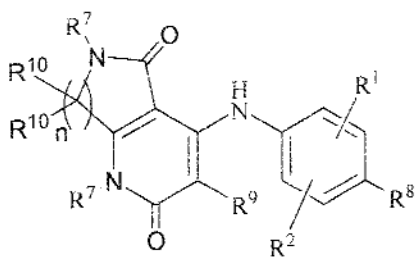
19. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 18, donde R¹ y R² son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde R¹ es halógeno o metilo, R² es hidrógeno y R⁸ es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR¹¹.

21. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, donde Y es NH, R¹ es halógeno, R⁵ es halógeno R⁵ es alquilo o halógeno, y R² está en la posición adyacente a Y, donde R² es hidrógeno.

620
1509
503

22. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

R^1 , R^2 , R^8 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo C_3-C_{10} , $-S(O)_2(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_2(CR^4R^5)_m\text{-arilo}$, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m\text{-arilo}$, $-NR^4(CR^4R^5)_m\text{-arilo}$, $-O(CR^4R^5)_m\text{-heteroarilo}$, $-NR^4(CR^4R^5)_m\text{-heteroarilo}$, $-O(CR^4R^5)_m\text{-heterociclilo}$ o $-NR^4(CR^4R^5)_m\text{-heterociclilo}$, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, alqueno, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición

de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-CR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

R^7 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$,

$-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$,
 $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$,
 $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} ,
 alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo,
 arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y
 heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo,
 heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o
 heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
 varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
 nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
 alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
 heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^{10} es, de modo independiente, hidrógeno, ciano,
 nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi,
 azido, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_2(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_2(CR^4R^5)_m$ -
 arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de
 dichas porciones de 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 (con la condición
 de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,

33
1212
506

ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^1SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-OR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $-C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$,

G24
1213
507

$-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, -

635
 121
 508

$\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo,

636
b25
509

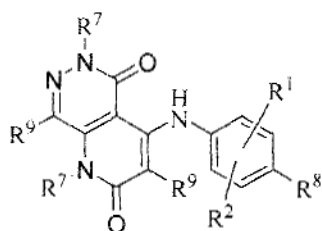
heteroarilo o heterociclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n es 1 ó 2; y

j es 0, 1 ó 2.

23. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

R^1 , R^2 , R^8 y cada R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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, heteroarilalquilo, heterociclilo,

837
1210
510

heterocicliclilalquilo, $-O(CR^4R^5)_m$ -arilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -arilo,
 $-O(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo, $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heteroarilo,
 $-O(CR^4R^5)_m$ -heterociclicilo o $-NR^4(CR^4R^5)_m$ -heterociclicilo, donde
cualquiera de dichas porciones de alquilo, alquénilo,
alquínilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo,
heteroarilalquilo, heterociclicilo y heterocicliclilalquilo están
opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos
seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición
de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,
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, heterociclicilo y
heterocicliclilalquilo, y donde dichos anillos arilo,
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclicilo o
heterocicliclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
alquilo C_3-C_4 , alquénilo C_2-C_4 , alquínilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-
 C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

R^7 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , alquénilo
 C_2-C_{10} , alquínilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , cicloalquilalquilo
 C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
heterociclicilo o heterocicliclilalquilo, donde cualquiera de

638
1217
511

dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{14}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

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, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo,

639
1213
512

alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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

640
1219
513

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{13}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{13}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, -

641
1260
514

$\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

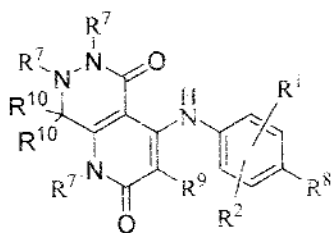
R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrogeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

24. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

R^1 , R^2 , R^8 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_4$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_4(CR^4R^5)_m$ -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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-CR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o

640
1222
5/3

heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^7 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{13}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{13}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o

64d
L23
519

varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^{10} es, de modo independiente, hidrógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_2(alquilo\ C_1-C_6)$, $-S(O)_2(CR^4R^5)_m-$ arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, 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, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o

645
 124
 518

varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³;

R³ es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀, alquino C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilalquilo C₃-C₁₀, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -NR¹¹SO₂R¹⁴, -SO₂NR¹¹R¹², -C(O)R¹¹, C(O)OR¹¹, -OC(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹⁴, -NR¹¹C(O)R¹², -C(O)NR¹¹R¹², -SR¹¹, -S(O)R¹⁴, -SO₂R¹⁴, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)NR¹²R¹³, -NR¹¹C(NCN)NR¹²R¹³, -OR¹¹, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

o R³ y R⁴ junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente,

640
B65
519

de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y

heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

648
120
87

25. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 y un portador farmacéuticamente aceptable.

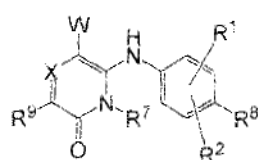
26. Un método para inhibir la actividad de MEK en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para inhibir dicha actividad de MEK.

27. Un método para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para tratar dicho trastorno hiperproliferativo.

28. Un método para el tratamiento de una condición inflamatoria en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para tratar dicha condición inflamatoria.

29. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



649
1203
22

donde

X es N o CR^{10} ;

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^{10} son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^1$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_2$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_2(CR^4R^5)_m$ -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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$,

650
129
23

$-\text{OC}(\text{O})\text{R}^3$, $-\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $-\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{R}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^3\text{R}^4$,
 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^5\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{OR}^3$, arilo, heteroarilo,
 arilalquilo, heteroarilalquilo, heterocicclilo y
 heterocicclilalquilo, y donde dichos anillos arilo,
 heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterocicclilo o
 heterocicclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
 varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
 nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
 alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$,
 heterocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, NR^3R^4 y OR^3 ;

R^7 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alquenilo
 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, cicloalquilalquilo
 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
 heterocicclilo o heterocicclilalquilo, donde cualquiera de
 dichas porciones de alquilo, alquenilo, alquinilo,
 cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo,
 heteroarilalquilo, heterocicclilo y heterocicclilalquilo están
 opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos
 seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición
 de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,
 ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo,
 difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$,
 $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$,



alquínulo C₂-C₁₀, cicloalquínulo C₃-C₁₀, arilo, heteroarilo,
 arilalquínulo, heteroarilalquínulo, y donde dichos anillos arilo,
 heterocíclico, arilalquínulo, heteroarilalquínulo, heterocíclico o
 heterocíclico también pueden estar sustituidos con uno o
 varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
 nitró, azido, difluorometilo, trifluorometilo, C₁-C₄,
 alquínulo C₁-C₄, alquínulo C₂-C₄, cicloalquínulo C₃-
 C₆, heterocicloalquínulo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³;
 R³ es hidrógeno, trifluorometilo, alquínulo C₁-C₄, alquínulo
 C₂-C₁₀, alquínulo C₂-C₆, cicloalquínulo C₃-C₁₀, cicloalquínulo
 C₃-C₁₀, arilo, arilalquínulo, heteroarilo, heteroarilalquínulo,
 heterocíclico, heterocíclico, fosfato o un residuo de
 aminoácido, donde cualquiera de dichas porciones de alquínulo,
 alquénulo, alquínulo, cicloalquínulo, arilo, arilalquínulo,
 heteroarilo, heteroarilalquínulo, heterocíclico y
 heterocíclico están opcionalmente sustituidas con uno o
 varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo
 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o
 heteroarilo, halógeno, ciano, nitró, trifluorometilo,
 difluorometilo, trifluorometoxi, azido, -NR¹SO₂R², -SO₂NR¹R²,
 -C(O)R¹, C(O)OR¹, -OC(O)R¹, -NR¹C(O)OR¹, -NR¹C(O)R²,
 -C(O)NR¹R², -SR¹, -S(O)R¹, -SO₂R¹, -NR¹R², -NR¹C(O)NR²R³, -
 NR¹C(NCN)NR²R³, -OR¹, arilo, heteroarilo, arilalquínulo,
 heteroarilalquínulo, heterocíclico y heterocíclico,

652
1231
525

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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{14}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{14}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;



653
1032
100

R^6 es trifluorometilo, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi,



6A
433
522

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

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) o CR^3OR^3 , donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, azido, $-NR^3R^4$, $-OR^3$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo, donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

con la condición de que, cuando X es CH, W no pueda ser C(O)arilo o C(O)heteroarilo, y también con la condición de que, cuando X es CH, W es C(O)OR³ y R⁵ es F, R⁷ no pueda ser H;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

65
1234
1,12

30. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde X es CR^{10} , y R^{10} es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, fluorometilo o etilo.

31. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 30, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

32. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 31, donde W está seleccionado de heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ y $C(O)NR^4S(O)_2R^3$, donde cualquiera de dichos heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ o $C(O)NR^4S(O)_2R^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

33. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 31, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos

1235
576

seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³; y

R³ está seleccionado de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

34. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 32 o la reivindicación 33, donde R⁷ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ y alquinilo C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos

107
1/20

cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 .

35. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, donde R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^{11} .

36. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 35, donde R^1 y R^2 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

37. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^8 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

38. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, donde Y es NH, R^1 es halógeno, R^8 es halógeno, R^9 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

900
1237
(3)

39. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, donde R^1 es halógeno, R^6 es halógeno, R^3 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

40. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde X es N.

41. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 40, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

42. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 41, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 ; y

R^3 está seleccionado de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo

7

689
1053
122

C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

43. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 42, donde R⁷ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄ o alquino C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄ y alquino C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³.

44. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 43, donde R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR¹¹.

660
-1291
-33

45. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 44, donde R^1 y R^2 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

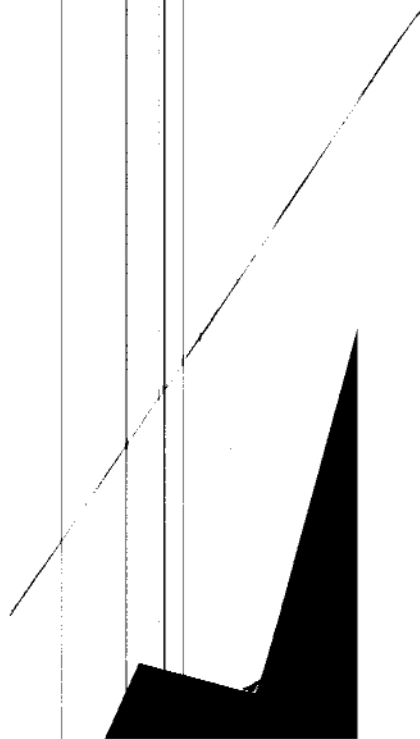
46. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 43, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

47. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, donde R^1 es halógeno, R^8 es halógeno, R^9 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

48. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 y un portador farmacéuticamente aceptable.

49. Un método para inhibir la actividad de MEK en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para inhibir dicha actividad de MEK.

50. Un método para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para tratar dicho trastorno hiperproliferativo.



1540
130

51. Un método para el tratamiento de una condición inflamatoria en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para tratar dicha condición inflamatoria.

52. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 para usar como un medicamento.

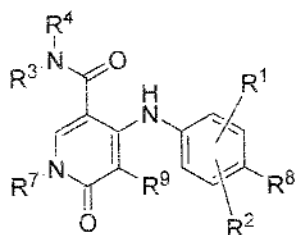
53. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 para usar como un medicamento para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo o una condición inflamatoria.

54. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo o una condición inflamatoria.



662
1241
125

55. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 6



6

donde

R¹, R² y R³ son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R⁴ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

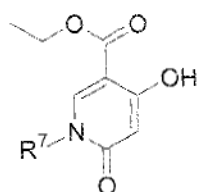
R³ y R⁷ son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino,

683
1041
36

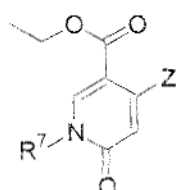
aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, SR^1 , etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 2



2

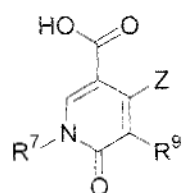
con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula 3



3, donde Z es Cl o Br;

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 3 con N-clorosuccinimida o 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-diazoniabicyclo[2,2,2]octan-bis(tetrafluoroborato) seguido de hidrólisis básica para proporcionar un compuesto de la fórmula

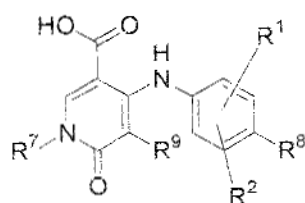
4



4

684
1043
532

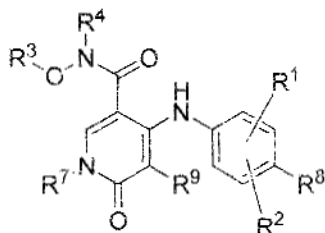
(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 4 con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 5



5 ; y

(d) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 5 con una amina para proporcionar un compuesto de la fórmula 6.

56. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 7



7 ,

donde

R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

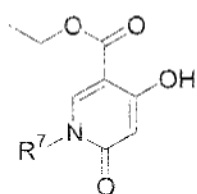
R^4 hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede

estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

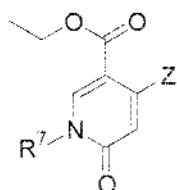
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 2



2

con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula 3



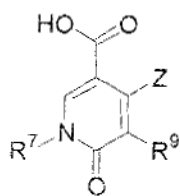
3, donde Z es Cl o Br;

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 3 con N-clorosuccinimida o 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-

666
1045
539

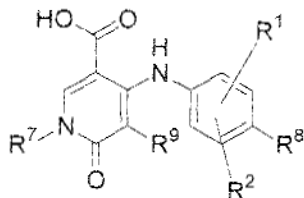
diazoniabicyclo[2,2,2]octan-bis(tetrafluoroborato) seguido de hidrólisis básica para proporcionar un compuesto de la fórmula

4



4

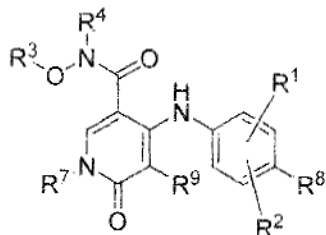
(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 4 con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 5



5

(d) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 5 con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula 7.

57. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 7



7

donde

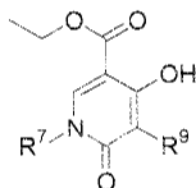
R^1 , R^2 y R^3 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^5 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

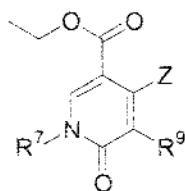
R^6 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 9



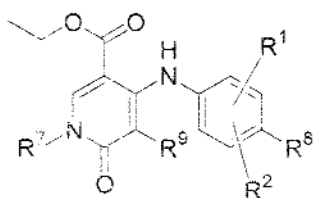
608
1217
541

con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula 10



10 , donde Z es Cl, o Br;

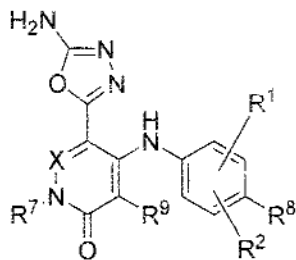
(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 10 con un derivado de anilina en presencia de un catalizador de paladio, un ligando de fosfina y una base para proporcionar un compuesto de la fórmula 11



11 ; y

(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 11 con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula 7.

58. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 43



43

609
1043
2.72

donde

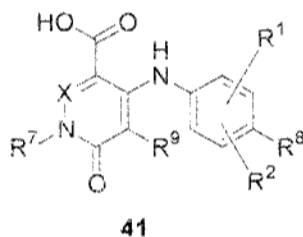
X es CH o N;

R^1 , R^2 y R^5 son, de modo independiente, hidrogeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^7 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

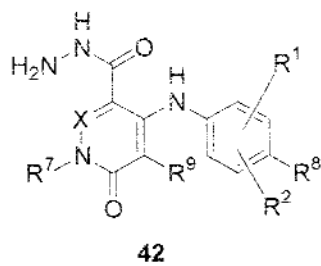
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



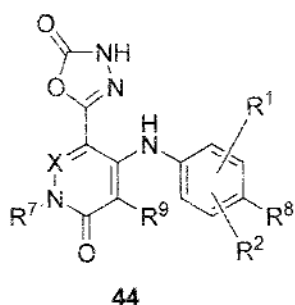
670
 124
 203

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42



(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con bromuro de cianógeno para proporcionar un compuesto de la fórmula 43.

59. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 44



donde

X es CH o N;

R^1 , R^2 y R^8 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

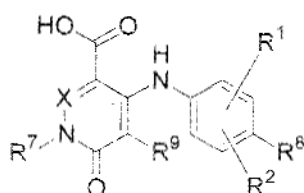
R^7 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,

57
1250
119

nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

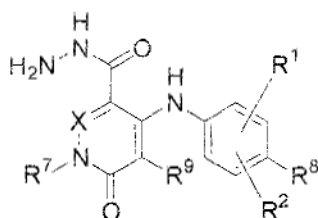
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



41

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42



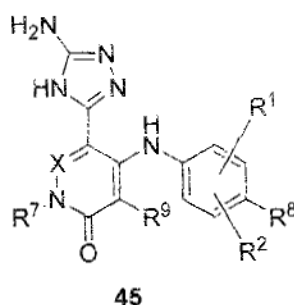
42

; y

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con CDI o fosgeno para proporcionar un compuesto de la fórmula 44.

60. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 45

972
~~1051~~
 502



donde

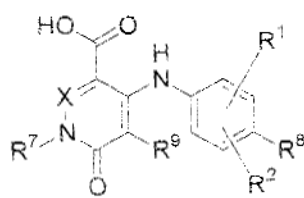
X es CH o N;

R¹, R² y R⁹ son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R⁷ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

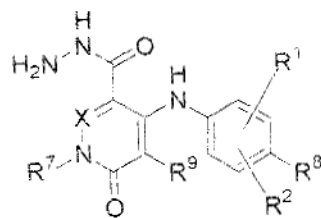
R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41

6-10
1052
7-2

41

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42

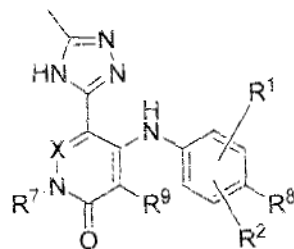


42

; y

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con cianamida seguido de una mezcla de PPh_3 , TEA y CCl_4 para proporcionar un compuesto de la fórmula 45.

61. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 46



46

donde

X es CH o N;

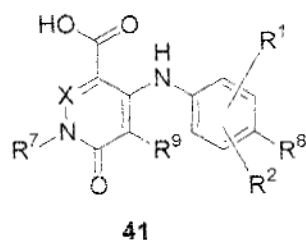
R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

64
152
67

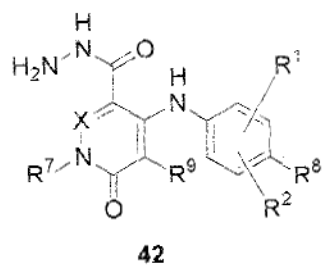
R^7 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42

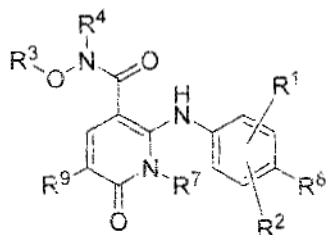


; y

695
~~154~~
 548

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con acetimidato de etilo seguido de una mezcla de PPh_3 , TEA y CCl_4 para proporcionar un compuesto de la fórmula 46.

62. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 56



56

donde

R^1 , R^2 y R^6 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 es hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$;

R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

AVISO DE NOTIFICACION

CORREO CERTIFICADO

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

498
100

Radicación :	6-73210- -5-0	Fecha: 2008-09-01 08:18:30
Trámite :	11 PATENTEIYII	
Evento :	378 FASENACIONALI	
Actuación :	432 COMUNICACTOADM	
Destinatario :	HUMBERTO RUBIO CAMACHO Folios 1	

Señor (a) (es)
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
CRA. 7 # 74 - 64 OFC. 506
BOGOTA D.C.

Referencia RESOLUCION : 32832
Fecha : 29/08/2008
Expediente : 6-73210
Trámite : 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II
Evento : 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
Actuación : 432 COMUNICACION ACTO ADMINISTRATIVO

Comedidamente le solicito presentarse a este Despacho ubicado en la Carrera 13 No. 27 - 00 Piso Quinto (5), de la ciudad de Bogotá D.C., dentro del término de cinco (5) días hábiles contados a partir del envío de la presente citación, en horario de 8:00 a.m. a 4:30 p.m. jornada continua, con el fin de notificarle personalmente el contenido de la resolución de la referencia proferida dentro del expediente tramitado con el número de radicación citado en el asunto.

De no hacerse presente en el término indicado anteriormente, la providencia en mención se notificará por edicto, el cual se fijará por el término de diez (10) días en el Centro de Documentación e Información.

Para su comodidad el texto completo de la resolución se encontrará disponible en la página web de la Entidad desde el día hábil siguiente al de su notificación, la cual podrá ser consultada desde un computador con acceso a Internet, en la página www.sic.gov.co, con el número de resolución a través de la opción servicios en línea - caracter general - consulta actos administrativos.

Secretaria General

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Al contestar favor indique el número de
radicación consignado en el sticker

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Cra 50 No. 26-55 Int 2 PBX: 3820840
Fax: 3 82 26 95 3 50 52 20. Línea 018000 910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

499
202

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Secretaria General

E. S. D.

Ref. Expediente No. 06-73210
Marca: Derivados de Na2O1
Clase: P-I
Resolución No. 32832

HUMBERTO RUBIO CAMACHO, mayor de edad, domiciliado en Bogotá, D.C., identificado con la cédula de ciudadanía número 17'192.062 de Bogotá, por medio del presente escrito solicito a su Despacho me sea notificada oficialmente la Resolución No. 32832 — de 29 de Agosto de 2.008, correspondiente al Expediente de la referencia; por lo cual solicito sea entregada copia de la Resolución a mi Dependiente.



HUMBERTO RUBIO CAMACHO

C.C. 17'192.062 de Bogotá

**T.P. 50.007 Consejo Superior
de la Judicatura**

COD. 4134

YOLANDA CORTES

**C.C. 61.907.772 Bta.
SE ANEXA MEMORIAL**

1

1

1

1

1

1

1

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

Rad. PCT/06-073210

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el
artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 26 de julio del 2006 bajo el número 06-073210, se presentó la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE TIAZOL", para los efectos de que se dé comienzo a la fase nacional, en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 583 del 18 de diciembre del 2007 y posteriormente rectificada la publicación en la Gaceta 589 de 29 de febrero de 2008.

TERCERO: Que el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, establece que: *"Dentro del plazo de seis meses contados desde la publicación de la solicitud, independientemente que se hubieren presentado oposiciones, el solicitante deberá pedir que se examine si la invención es patentable. Los Países Miembros podrán cobrar una tasa para la realización de este examen. Si transcurriera dicho plazo sin que el solicitante hubiera pedido que se realice el examen, la solicitud caerá en abandono"*.

CUARTO: Que contados seis meses desde la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial, no se presentó petición de parte del interesado para efectuar el examen de fondo, razón por la cual se considera abandonada la solicitud en los términos del mencionado artículo 44.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Declarar abandonada la solicitud de privilegio de patente de invención que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION N° 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

Rad. PCT/06-073210

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Humberto Rubio Camacho, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Kyowa Hakko Kogyo Co., LTD, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición a interponer ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 29 AGO. 2008

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
Carrera 7 N° 74-64, Ofic. 506
Bogotá D.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL

La presente resolución se dio por notificada el 8 SET. 2008
mediante memorial suscrito por el Doctor(a) Humberto Rubio Canache

(Artículo 48 C.C.A.)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL AD-HOC

NOTIFICADOR

621
1001
U95

nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{13}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{13}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{13}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{13}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

500
+200
496

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^1$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) o CR^3OR^3 , donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)$ (cicloalquilo C_3-C_{10}), $-C(O)$ (alquilo C_1-C_{10}), $-C(O)$ (arilo), $-C(O)$ (heteroarilo), $-C(O)$ (heterociclilo) y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, azido, $-NR^3R^4$, $-OR^3$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo, donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

497

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde Y es NH.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, donde X es CR¹⁰, y R¹⁰ es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R⁹ es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

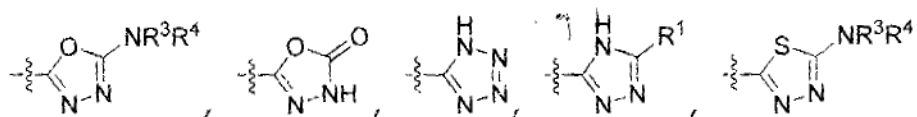
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de heteroarilo, C(O)OR³, C(O)NR³R⁴, C(O)NR⁴OR³ y C(O)NR⁴S(O)₂R³, donde cualquiera de dichos heteroarilo, C(O)OR³, C(O)NR³R⁴, C(O)NR⁴OR³ o C(O)NR⁴S(O)₂R³ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

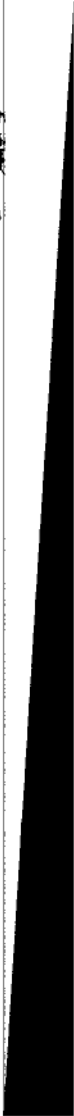
1004
408

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 ; y

R^3 está seleccionado de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de





AVISO DE NOTIFICACION
CORREO CERTIFICADO**Industria y Comercio**
SUPERINTENDENCIA

498
V

Radicación :	6-73210- -5-0	Fecha: 2008-09-01 08:18:30
Trámite :	11 PATENTEIYII	
Evento :	378 FASENACIONALI	
Actuación :	432 COMUNICACTOADM	
Destinatario :	HUMBERTO RUBIO CAMACHO Folios 1	

Señor (a) (es)
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
CRA. 7 # 74 - 64 OFC. 506
BOGOTA D.C.

Referencia RESOLUCION : 32832
Fecha : 29/08/2008
Expediente : 6-73210
Trámite : 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II
Evento : 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
Actuación : 432 COMUNICACION ACTO ADMINISTRATIVO

Comendidamente le solicito presentarse a este Despacho ubicado en la Carrera 13 No. 27 - 00 Piso Quinto (5), de la ciudad de Bogotá D.C., dentro del término de cinco (5) días hábiles contados a partir del envío de la presente citación, en horario de 8:00 a.m. a 4:30 p.m. jornada continua, con el fin de notificarle personalmente el contenido de la resolución de la referencia proferida dentro del expediente tramitado con el número de radicación citado en el asunto.

De no hacerse presente en el término indicado anteriormente, la providencia en mención se notificará por edicto, el cual se fijará por el término de diez (10) días en el Centro de Documentación e Información.

Para su comodidad el texto completo de la resolución se encontrará disponible en la página web de la Entidad desde el día hábil siguiente al de su notificación, la cual podrá ser consultada desde un computador con acceso a Internet, en la página www.sic.gov.co, con el número de resolución a través de la opción servicios en línea - caracter general - consulta actos administrativos.

Secretaría General
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Al contestar favor indique el número de radicación consignado en el sticker

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Cra 50 No. 26-55 Int 2 PBX: 3820840
Fax: 3 82 26 95 3 50 52 20. Línea 018000 910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

499
VPL

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Secretaria General

E. S. D.

Ref. Expediente No. 06-73210
Marca: Derivados de Na2O1
Clase: P-I
Resolución No. 32832

HUMBERTO RUBIO CAMACHO, mayor de edad, domiciliado en Bogotá, D.C., identificado con la cédula de ciudadanía número 17'192.062 de Bogotá, por medio del presente escrito solicito a su Despacho me sea notificada oficialmente la Resolución No. 32832 — de 29 de Agosto de 2.008, correspondiente al Expediente de la referencia; por lo cual solicito sea entregada copia de la Resolución a mi Dependiente.



HUMBERTO RUBIO CAMACHO

C.C. 17'192.062 de Bogotá

**T.P. 50.007 Consejo Superior
de la Judicatura**

COD. 4134

YOLANDA CORTES

**C.C. 51.907.772 Btá.
SE ANEXA MEMORIAL**

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

Rad. PCT/06-073210

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el
artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 26 de julio del 2006 bajo el número 06-073210, se presentó la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE TIAZOL", para los efectos de que se dé comienzo a la fase nacional, en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 583 del 18 de diciembre del 2007 y posteriormente rectificad la publicación en la Gaceta 589 de 29 de febrero de 2008.

TERCERO: Que el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, establece que: *"Dentro del plazo de seis meses contados desde la publicación de la solicitud, independientemente que se hubieren presentado oposiciones, el solicitante deberá pedir que se examine si la invención es patentable. Los Países Miembros podrán cobrar una tasa para la realización de este examen. Si transcurriera dicho plazo sin que el solicitante hubiera pedido que se realice el examen, la solicitud caerá en abandono"*.

CUARTO: Que contados seis meses desde la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial, no se presentó petición de parte del interesado para efectuar el examen de fondo, razón por la cual se considera abandonada la solicitud en los términos del mencionado artículo 44.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Declarar abandonada la solicitud de privilegio de patente de invención que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION N° 3 2 8 3 2

Por la cual se declara abandonada una solicitud

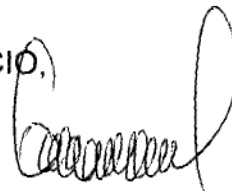
Rad. PCT/06-073210

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Humberto Rubio Camacho, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Kyowa Hakko Kogyo Co., LTD, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición a interponer ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 29 AGO. 2008

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
Carrera 7 N° 74-64, Ofic. 506
Bogotá D.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL

La presente resolución se dio por notificada el 8 SET. 2008
mediante memorial suscrito por el Doctor(a) Humberto Rubio Camacho

(Artículo 48 C.C.A.)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SECRETARIA GENERAL AD-HOC

NOTIFICADOR

621
100'
U95

nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

522
100
496

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$ o CR^3OR^3 , donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$ y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, azido, $-NR^3R^4$, $-OR^3$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo, donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;



523
1203
497

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde Y es NH.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, donde X es CR^{10} , y R^{10} es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ y $C(O)NR^4S(O)_2R^3$, donde cualquiera de dichos heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ o $C(O)NR^4S(O)_2R^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

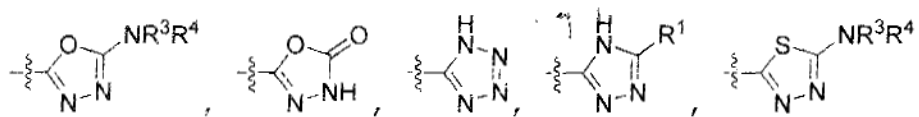


620
1204
408

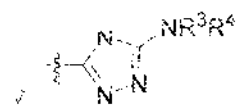
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 ; y

R^3 está seleccionado de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde W está seleccionado de



025
125
129



8. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^7 es alquilo C_1-C_4 , alquenoilo C_2-C_4 o alquínilo C_2-C_4 , donde dicho alquilo C_1-C_4 , alquenoilo C_2-C_4 y alquínilo C_2-C_4 puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminocetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenoilo C_2-C_4 , alquínilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^1 .

9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminocetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 .



527
1000
500

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, donde R^1 y R^2 son independientemente hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

11. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{14} .

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 11, donde Y es NH, R^1 es halógeno, R^2 es halógeno, R^3 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es H.

13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde X es N.

14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13, donde R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 14, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo

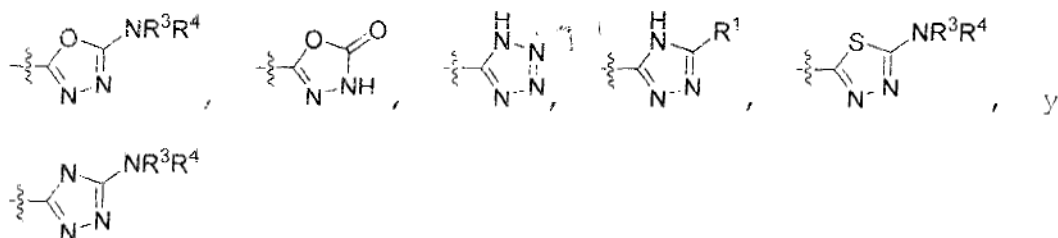


678
1007
501

C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³; y

R³ está seleccionado de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 14, donde W está seleccionado de



17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 15 o la reivindicación 16, donde R⁷ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ y alquinilo C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo,

C29
1003
202

heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 .

18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde R^6 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^{11} .

19. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 18, donde R^1 y R^2 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

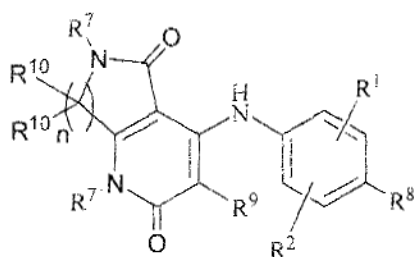
20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^8 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

21. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, donde Y es NH, R^1 es halógeno, R^8 es halógeno R^9 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.



620
159
4,03

22. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_3$ (alquilo C_1-C_6), $-S(O)_3(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, acilalquilo, 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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición

63T
127
300

de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^3C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-CR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

R^7 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$,

632
LH
3.15

$-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$,
 $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-$
 $NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} ,
alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo,
arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y
heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo,
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o
heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^{10} es, de modo independiente, hidrógeno, ciano,
nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi,
azido, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_j(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -
arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de
dichas porciones de 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 (con la condición
de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,

33
122
506

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, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $-C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$,



G24
1013
507

$-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, 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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^4 y R^5 son, de modo independiente, hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, 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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, -

508

$\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo,



636
b5
509

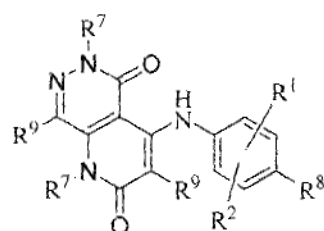
heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterocicilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n es 1 ó 2; y

j es 0, 1 ó 2.

23. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

R^1 , R^2 , R^8 y cada R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_j(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo,

1510
510

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, donde
cualquiera de dichas porciones de alquilo, alqueno, alquino,
alquino, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo,
heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están
opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos
seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición
de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,
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, y donde dichos anillos arilo,
heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o
heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-
C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR^3R^4 y OR^3 :

R^7 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C₁-C₁₀, alqueno
C₂-C₁₀, alquino C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilalquilo
C₃-C₁₀, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de



638
1217
511

dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{14}R^{11}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{14}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

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, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo,

634
513
512

alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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

1519
513

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, -



641
1267
514

$\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

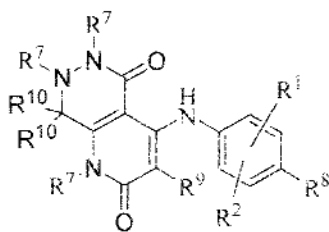
R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrogeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alquenilo inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alquenilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

24. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:



donde

642
1021
5/5

R^1 , R^2 , R^8 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-SR^{11}$, $-OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, 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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometilo, difluorometoxi, azido, $-NR^4SO_2R^6$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-OC(O)R^3$, $-NR^4C(O)OR^6$, $-NR^4C(O)R^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-NR^3R^4$, $-NR^5C(O)NR^3R^4$, $-NR^5C(NCN)NR^3R^4$, $-CR^3$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o

648
1222
5/6

heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^7 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o

644
123
519

varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 ;

cada R^{10} es, de modo independiente, hidrógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-C(O)R^3$, $-C(O)OR^3$, $-SO_2NR^3R^4$, $-C(O)NR^3R^4$, 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} , $-S(O)_j(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $-S(O)_j(CR^4R^5)_m$ -arilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, 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, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o

645
 124
 518

varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³;

R³ es hidrógeno, trifluorometilp, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilalquilo C₃-C₁₀, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oco (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -NR¹¹SO₂R¹⁴, -SO₂NR¹¹R¹², -C(O)R¹¹, C(O)OR¹¹, -OC(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹⁴, -NR¹¹C(O)R¹², -C(O)NR¹¹R¹², -SR¹¹, -S(O)R¹⁴, -SO₂R¹⁴, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)NR¹²R¹³, -NR¹¹C(NCN)NR¹²R¹³, -OR¹¹, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

o R³ y R⁴ junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente,

646
Des
5.9

de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y

647
+205
570

heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

643
12
87

25. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 y un portador farmacéuticamente aceptable.

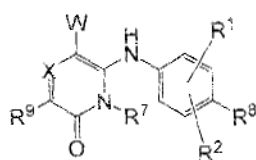
26. Un método para inhibir la actividad de MEK en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para inhibir dicha actividad de MEK.

27. Un método para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para tratar dicho trastorno hiperproliferativo.

28. Un método para el tratamiento de una condición inflamatoria en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6, 8, 12, 17, 22, 23 y 24 en una cantidad efectiva para tratar dicha condición inflamatoria.

29. Un compuesto que incluye sus enantiómeros, diastereoisómeros resueltos, solvatos y sales farmacéuticamente aceptables, que tiene la fórmula:

647
 1203
 22



donde

X es N o CR¹⁰;

R¹, R², R³, R⁹ y R¹⁰ son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -SR¹¹, -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)₂(alquilo C₁-C₆), -S(O)₂(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, donde cualquiera de dichas porciones de 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 (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -NR⁴SO₂R⁶, -SO₂NR³R⁴, -C(O)R³, -C(O)OR³,

650
1229
523

$-\text{OC}(\text{O})\text{R}^3$, $-\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $-\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{R}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^3\text{R}^4$,
 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{NR}^5\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^3\text{R}^4$, $-\text{OR}^3$, arilo, heteroarilo,
 arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y
 heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo,
 heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o
 heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o
 varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,
 nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo,
 alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$,
 heterocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, NR^3R^4 y OR^3 ;

R^7 es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alquenilo
 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, cicloalquilalquilo
 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo,
 heterociclilo o heterociclilalquilo, donde cualquiera de
 dichas porciones de 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 (con la condición
 de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno,
 ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo,
 difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{14}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$,
 $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{NCN})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $-\text{OR}^{11}$, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$,

alquinilo C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo, y donde dichos anillos arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo o heterociclilalquilo también pueden estar sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³;

R³ es hidrógeno, trifluorometilo, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilalquilo C₃-C₁₀, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fosfato o un residuo de aminoácido, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxc (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, -NR¹¹-SO₂R¹⁴, -SO₂NR¹¹R¹², -C(O)R¹¹, C(O)OR¹¹, -CC(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹⁴, -NR¹¹C(O)R¹², -C(O)NR¹¹R¹², -SR¹¹, -S(O)R¹⁴, -SO₂R¹⁴, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)NR¹²R¹³, -NR¹¹C(NCN)NR¹²R¹³, -OR¹¹, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo,

652
1231
525

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, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

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, donde dicho alquilo o cualquiera de dichos anillos carbocíclicos, heteroarilos y heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, 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 o heterociclilalquilo, donde cualquiera de dichas porciones de alquilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de oxo (con la condición de que no esté sustituido en el arilo o heteroarilo, halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, azido, $-NR^{11}SO_2R^{14}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-C(O)R^{11}$, $C(O)OR^{11}$, $-OC(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{14}$, $-NR^{11}C(O)R^{12}$, $-C(O)NR^{11}R^{12}$, $-SR^{11}$, $-S(O)R^{14}$, $-SO_2R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)NR^{12}R^{13}$, $-NR^{11}C(NCN)NR^{12}R^{13}$, $-OR^{11}$, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo y heterociclilalquilo;

R^{11} , R^{12} y R^{13} son, de modo independiente, hidrógeno, alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo, y R^{14} es alquilo inferior, alqueno inferior, arilo y arilalquilo;

o dos cualesquiera de R^{11} , R^{12} , R^{13} o R^{14} junto con el átomo al que están unidos forman un anillo carbocíclico, heteroarilo o heterocíclico de 4 a 10 miembros, donde cualquiera de dichos anillos carbocíclicos alquilo, alqueno, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heterocíclicos están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, trifluorometilo, difluorometoxi,

GA
1233
527

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

W es heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$ o CR^3OR^3 , donde cualquiera de dichos heteroarilo, heterociclilo, $-C(O)OR^3$, $-C(O)NR^3R^4$, $-C(O)NR^4OR^3$, $-C(O)R^4OR^3$, $-C(O)NR^4SO_2R^3$, $-C(O)(\text{cicloalquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{alquilo } C_1-C_{10})$, $-C(O)(\text{arilo})$, $-C(O)(\text{heteroarilo})$, $-C(O)(\text{heterociclilo})$ y CR^3OR^3 están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de halógeno, ciano, nitro, azido, $-NR^3R^4$, $-OR^3$, alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo, donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , cicloalquilo y heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados, de modo independiente, de $-NR^3R^4$ y $-OR^3$;

con la condición de que, cuando X es CH, W no pueda ser C(O)arilo o C(O)heteroarilo, y también con la condición de que, cuando X es CH, W es $C(O)OR^3$ y R^3 es F, R^3 no pueda ser H;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y

j es 0, 1 ó 2.

655
1034
1072

30. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde X es CR^{10} , y R^{10} es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, fluorometilo o etilo.

31. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 30, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

32. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 31, donde W está seleccionado de heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ y $C(O)NR^4S(O)_2R^3$, donde cualquiera de dichos heteroarilo, $C(O)OR^3$, $C(O)NR^3R^4$, $C(O)NR^4OR^3$ o $C(O)NR^4S(O)_2R^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 .

33. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 31, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos

1235
526

seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR³R³ y OR³; y

R³ está seleccionado de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y heterocicloalquilo C₃-C₆, donde cualquiera de dichos alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR³R³ y OR³.

34. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 32 o la reivindicación 33, donde R⁷ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ y alquinilo C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos

657
1320

cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C_1-C_4 , alquienilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_3-C_6 , NR^3R^4 y OR^3 .

35. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, donde R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^{11} .

36. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 35, donde R^1 y R^2 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

37. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^8 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

38. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, donde Y es NH, R^1 es halógeno, R^8 es halógeno, R^9 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

39. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, donde R^1 es halógeno, R^6 es halógeno, R^3 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

40. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde X es N.

41. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 40, donde R^9 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

42. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 41, donde W está seleccionado de $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$, donde cualquiera de dichos $C(O)OR^3$, $C(O)NHR^3$, y $C(O)NHOR^3$ están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitró, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo o heterocicloalquilo también pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de NR^3R^4 y OR^3 ; y

R^3 está seleccionado de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y heterocicloalquilo C_3-C_6 , donde cualquiera de dichos alquilo

687
4053
22

C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo o heterocicloalquilo están opcionalmente sustituidas con uno o varios grupos seleccionados de NR³R⁴ y OR³.

43. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 42, donde R⁷ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄ o alquino C₂-C₄, donde dicho alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄ y alquino C₂-C₄ puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dichos anillos cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₃-C₆, NR³R⁴ y OR³.

44. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 43, donde R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR¹¹.

660
-1281
-33

45. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 44, donde R^1 y R^2 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo.

46. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 43, donde R^1 es halógeno o metilo, R^2 es hidrógeno y R^3 es hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o SR^{11} .

47. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, donde R^1 es halógeno, R^6 es halógeno, R^5 es alquilo o halógeno, y R^2 está en la posición adyacente a Y, donde R^2 es hidrógeno.

48. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 y un portador farmacéuticamente aceptable.

49. Un método para inhibir la actividad de MEK en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para inhibir dicha actividad de MEK.

50. Un método para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para tratar dicho trastorno hiperproliferativo.

1040
134

51. Un método para el tratamiento de una condición inflamatoria en un mamífero que comprende la administración a dicho mamífero de uno o varios compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 29, 33, 34, 39 y 43 en una cantidad efectiva para tratar dicha condición inflamatoria.

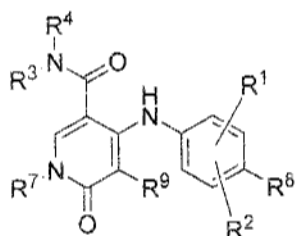
52. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 para usar como un medicamento.

53. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 para usar como un medicamento para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo o una condición inflamatoria.

54. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-51 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de un trastorno hiperproliferativo o una condición inflamatoria.

662
4241
125

55. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 6



6

donde

R^1 , R^2 y R^6 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

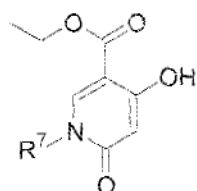
R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino,

600
1042
36

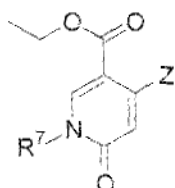
aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, SR^1 , etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 2



2

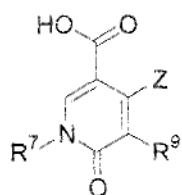
con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula 3



3, donde Z es Cl o Br;

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 3 con N-clorosuccinimida o 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-diazoniabicyclo[2,2,2]octan-bis(tetrafluoroborato) seguido de hidrólisis básica para proporcionar un compuesto de la fórmula

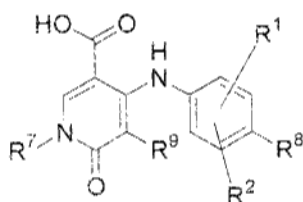
4



4

684
104
53

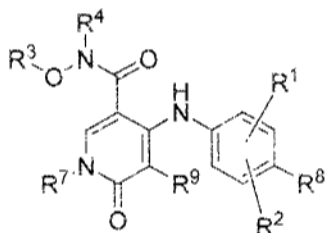
(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 4 con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 5



5 ; y

(d) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 5 con una amina para proporcionar un compuesto de la fórmula 6.

56. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 7



7

donde

R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

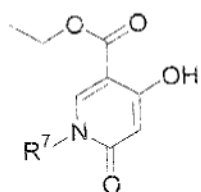
R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede

1241
-38

estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

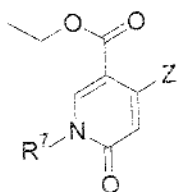
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 2



2

con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula 3



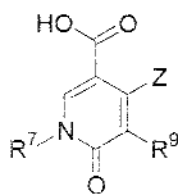
3, donde Z es Cl o Br;

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 3 con N-clorosuccinimida o 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-

666
1045
139

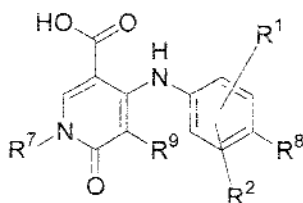
diazoniabicyclo[2,2,2]octan-bis(tetrafluoroborato) seguido de hidrólisis básica para proporcionar un compuesto de la fórmula

4



4

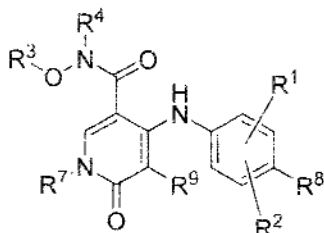
(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 4 con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 5



5

(d) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 5 con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula 7.

57. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 7



7

donde

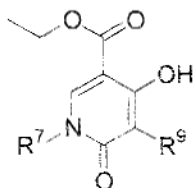
R^1 , R^2 y R^3 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 hidrógeno o alquilo C_1-C_8 ;

R^5 y R^6 son, de modo independiente, alquilo, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

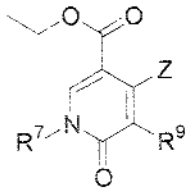
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 9



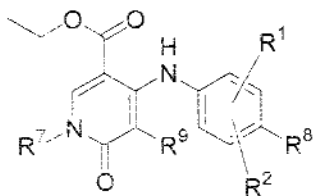
668
1247
SVI

con un agente halogenante para proporcionar un compuesto de la fórmula **10**



10 , donde Z es Cl, o Br;

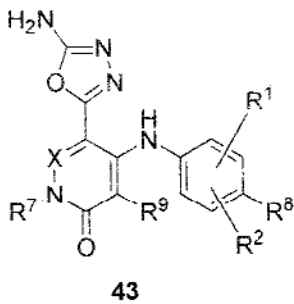
(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula **10** con un derivado de anilina en presencia de un catalizador de paladio, un ligando de fosfina y una base para proporcionar un compuesto de la fórmula **11**



11 ; y

(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula **11** con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula **7**.

58. Un método para preparar un compuesto de la fórmula **43**



43

1043
110

donde

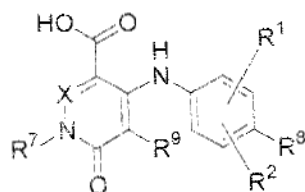
X es CH o N;

R^1 , R^2 y R^3 son, de modo independiente, hidrogeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^4 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

R^5 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo, etoxi o SR^1 , donde dicho método comprende:

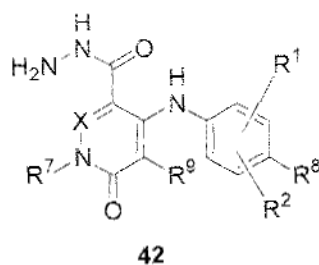
(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



41

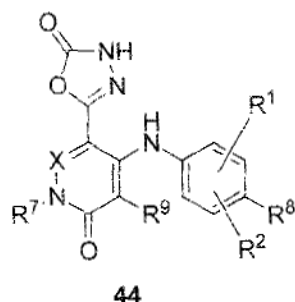
670
 1249
 243

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42



(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con bromuro de cianógeno para proporcionar un compuesto de la fórmula 43.

59. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 44



donde

X es CH o N;

R¹, R² y R³ son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

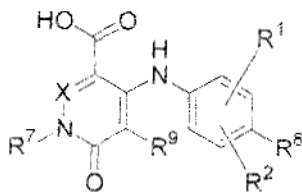
R⁷ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano,

51
1250
110

nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

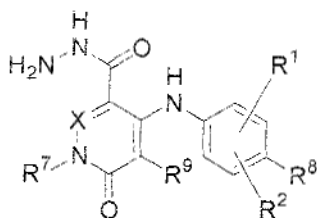
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



41

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42



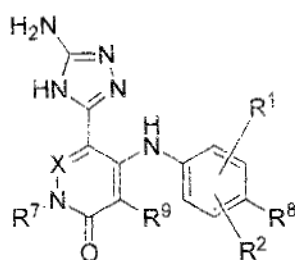
42

; y

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con CDI o fosgeno para proporcionar un compuesto de la fórmula 44.

60. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 45

576
~~1051~~
 505



45

donde

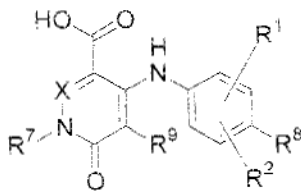
X es CH o N;

R¹, R² y R⁹ son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R⁷ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

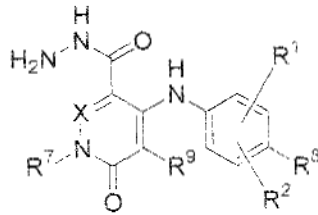
R⁸ es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



41

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42

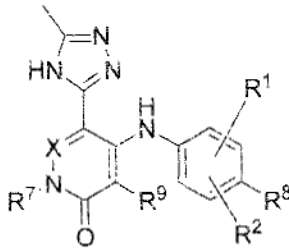


42

; y

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con cianamida seguido de una mezcla de PPh_3 , TEA y CCl_4 para proporcionar un compuesto de la fórmula 45.

61. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 46



46

donde

X es CH o N;

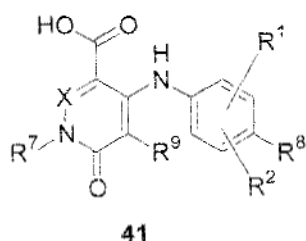
R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

674
152
67

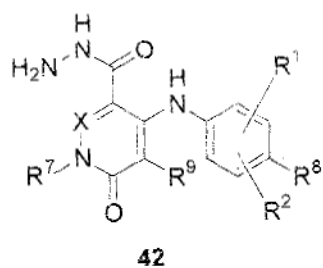
R^7 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 41



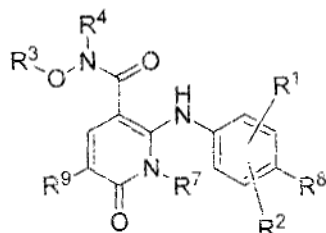
con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 42



675
154
548

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 42 con acetimidato de etilo seguido de una mezcla de PPh_3 , TEA y CCl_4 para proporcionar un compuesto de la fórmula 46.

62. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 56



56

donde

R^1 , R^2 y R^6 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

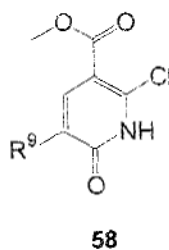
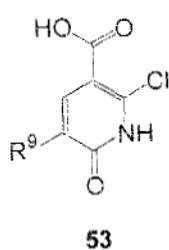
R^4 es hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$;

R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

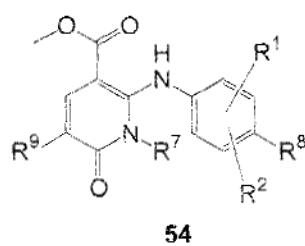
576
255
49

R^9 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, SR^1 , etilo o etoxi, donde dicho método comprende:

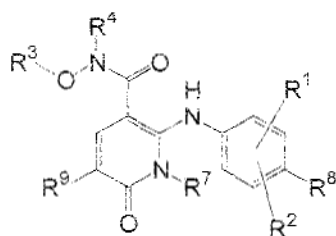
(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 53 ó 58



con un haluro de alquilo y una base seguido de la reacción con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 54

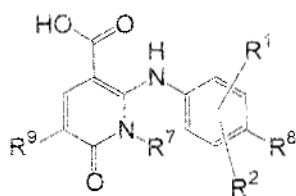


(b) (i) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 54 con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula 56



56

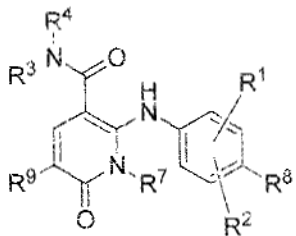
(ii) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 54 con una base acuosa para proporcionar un compuesto de la fórmula 55



55

seguido de la reacción de un compuesto de la fórmula 55 con una hidroxilamina para proporcionar un compuesto de la fórmula 56.

63. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 57



57

donde

R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

1670
10251

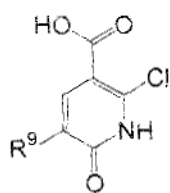
R^4 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6

R^3 y R^7 son, de modo independiente, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

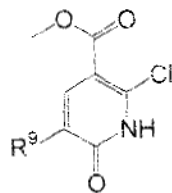
R^5 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, SR^1 , etilo o etoxi;

donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 53 ó 58



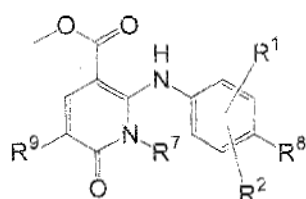
53



58

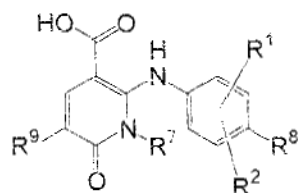
679
+ 253
552

con un haluro de alquilo y base seguido de la reacción con un derivado de anilina para proporcionar un compuesto de la fórmula 54



54

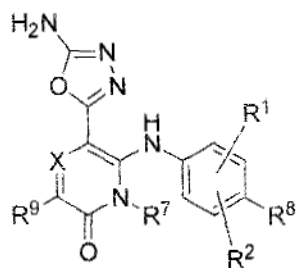
(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 54 con una base acuosa para proporcionar un compuesto de la fórmula 55



55

(c) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 55 con una amina para proporcionar un compuesto de la fórmula 57.

64. Un método para preparar un compuesto de la fórmula 87



87

donde

X es CH o N;

650
1051
553

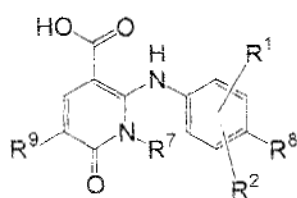
R^1 , R^2 y R^9 son, de modo independiente, hidrógeno, halógeno, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o etilo;

R^7 es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo, donde dicho alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o varios grupos seleccionados de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, amino, azido, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, etoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo; y

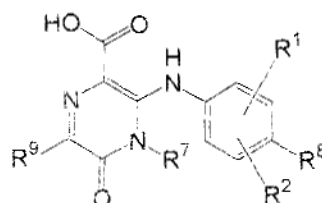
R^8 es halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, azido, metilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, amino, aminometilo, dimetilamino, aminoetilo, dietilamino, SR^1 , etilo o etoxi;

donde dicho método comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 55 ó 62



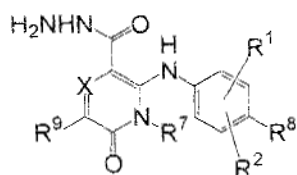
55



62

con hidrazina para proporcionar un compuesto de la fórmula 86

68T
1700
554



86

; y

(b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula 86 con bromuro de cianógeno para proporcionar un compuesto de la fórmula 87.

65. Un compuesto seleccionado de:

Ciclopropilmetoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-cloro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Ciclopropilmetoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 1-bencil-4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-cloro-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-1,1-dimetil-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

602
+ 501
555

(2-Hidroxi-1,1-dimetil-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-cloro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-cloro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-metil-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 4-(2,4-dicloro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Etoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

5-(5-Amino-[1,3,4]oxadiazol-2-il)-4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-3-fluoro-1-metil-1H-piridin-2-ona,

(2,3-Dihidroxi-propoxi)-amida del ácido 4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Hidroxiamida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

683
105
516

Etoxi-amida del ácido 5-fluoro-4-(2-fluoro-4-metilsulfanil-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Etoxi-amida del ácido 4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 5-fluoro-4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Etoxi-amida del ácido 5-fluoro-4-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 5-fluoro-4-(2-fluoro-4-metilsulfanil-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 4-(2-fluoro-4-metilsulfanil-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Metoxi-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Metoxi-etoxi)-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

684
153
55x

Etoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,5-dimetil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

Metoxi-amida del ácido 4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

5-(5-Amino-[1,3,4]oxadiazol-2-il)-4-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1,3-dimetil-1H-piridin-2-ona.

66. Un compuesto seleccionado de:

Ciclopropilmetoxi-amida del ácido 2-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 2-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 2-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-5-fluoro-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 2-(4-bromo-2-fluoro-fenilamino)-1-etil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

(2-Hidroxi-etoxi)-amida del ácido 2-(2-fluoro-4-metil-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico,

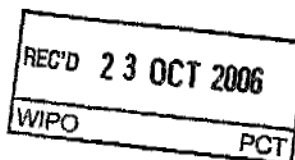
Metoxi-amida del ácido 2-(2-fluoro-4-yodo-fenilamino)-1-metil-6-oxo-1,6-dihidro-piridin-3-carboxílico.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)



Applicant's or agent's file reference ARR008 CIP1 PCT	FOR FURTHER ACTION		See Form PCT/IPEA/416
International application No. PCT/US04/39060	International filing date (day/month/year) 18 November 2004 (18.11.2004)	Priority date (day/month/year) 19 November 2003 (19.11.2003)	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC IPC: A61K 31/655(2006.01),31/501(2006.01),31/50(2006.01),31/44(2006.01),31/415(2006.01) USPC: 544/235,238,239;546/268,7,269.1;514/151,252.01,252.05,247,341,405			
Applicant ARRAY BIOPHARMA, INC.			
1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☒ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of <u>39</u> sheets, as follows: ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in electronic form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).			
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the report ☐ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement. ☐ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 12 May 2006 (12.05.2006)		Date of completion of this report 05 September 2006 (05.09.2006)	
Name and mailing address of the IPEA/ US Mail Stop PCT, Attn: IPEA/US Commissioner for Patents P.O. Box 1450 Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. (571) 273-3201		Authorized officer <u>Bonnie Mayes Jr</u> Ebenezer Sackey Telephone No. (571)272-1600	

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet)(April 2005)

