

579

Señora

**Jefe de la División de Nuevas Creaciones**

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
Rad 06-112392- -00002-0000  
IFec 2007-02-21 14 32'04 Dep 2020 NUECREACIONES  
Tra. 11 PATENTEIYI  
Eve 378 FASENACIONALI  
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios 52

E.

S.

D.

Ref.: Expediente No. 06.112.392

Solicitud de Patente PCT entrada fase nacional para:

**ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR DE PGD2 PARA EL TRATAMIENTO DE  
ENFERMEDADES INFLAMATORIAS**

Solicitante: **MILLENIUM PHARMACEUTICALS, INC**

### **RESPUESTA A EXAMEN DE FORMA**

**LUIS PATIÑO LEIVA**, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en atención a su oficio No. 14645 Notificado el **22 de Diciembre de 2006**, atentamente me permito dar repuesta al mismo de la siguiente manera:

Presento copia del documento de cesión de los inventores al solicitante debidamente notariado y legalizado por Apostilla junto con su respectiva traducción oficial.

Por otro lado, presento copia del capítulo reivindicatorio completo (70 reivindicaciones) tal como aparece en la solicitud internacional.

Cumplido así con lo dispuesto, atentamente solicito a Ud. se continúe con el trámite correspondiente a esta solicitud de Patente de Invención.

De la Señora Jefe,

  
Luis Patiño Leyva

C.C. No. 2.930.616 de Bogotá

T.P.A. No.2698 del C. Sup. de la Judicatura

Carrera 11A No. 94-76 Oficina 308 Santa Fe de Bogotá

Teléfonos: 6161948

**21 FEB. 2007**

**DOCUMENTO DE CESION  
ASSIGNMENT DOCUMENT**

Los suscritos  
(We, the undersigned)

1. GHOSH Shomir, 134 Sewall Avenue, Unit C, Brookline, Massachusetts 02446, USA
2. ELDER Amy M., 15 Westminster Avenue, Arlington, MA 02474 USA
3. CARSON Kenneth G., 96 Herrontown Road, Princeton, New Jersey 08540 USA
4. SPROTT Kevin T., 67 Monument Avenue #2, Boston, MA 02129 USA
5. HARRISON Sean J., 38 Grove Street, Somerville, MA 02478 USA
6. HICKS Frederick A., 5 Woodbine Street, Somerville, MA 02143 USA
7. RENOU Christelle C., 74 Josephine Avenue, Unit A., Somerville MA 02144 USA
8. REYNOLDS Dominic, 304 Allston Street, Apt. 6, Cambridge, MA 01239 USA

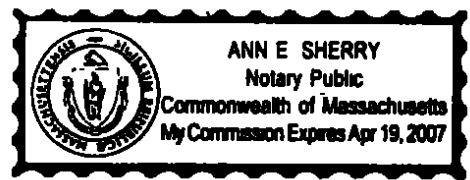
declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título  
(declare that we are the inventors of the invention titled)

**“ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR DE PGD2 PARA EL TRATAMIENTO DE  
ENFERMEDADES INFLAMATORIAS”.**  
(PGD2 RECEPTOR ANTAGONISTS FOR THE TREATMENT OF INFLAMATORY  
DISEASES)

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios  
y anexos, a favor  
(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its  
privileges and attachments, to

**MILLENIUM PHARMACEUTICALS, INC.,**

domiciliada en  
(domiciled in) Cambridge, Massachusetts, USA



**SIGNATURAS OF ASSIGNORS**

Signed at  
on December 13, 2006

*Shomir Ghosh*

1. GHOSH Shomir

3. CARSON Kenneth G.

*Kenneth G. Carson*

5. HARRISON Sean J.

*Christelle Renou*

7. RENOU Christelle C.

**FIRMA DE LOS CEDENTES**

Firmado en  
el

*Amy M. Elder*

2. ELDER Amy M.

4. SPROTT Kevin T.

*Kevin T. Sprott*

6. HICKS Frederick A.

*Dominic Reynolds*

8. REYNOLDS Dominic

MASSACHUSETTS ALL-PURPOSE ACKNOWLEDGMENT

Gov Exec Ord #455 (03 13), §5(d)

Commonwealth of Massachusetts

County of Middlesex } ss.

On this the 13<sup>th</sup> day of December, 2006, before me,

Diana E. Gentile  
Name of Notary Public

personally appeared Amy M. Elder, Sean J. Harrison, Chuckelle Reno,  
Frederick A. Hicks, Dominic Reynolds  
proved to me through satisfactory evidence of identity, which was/were

MA Drivers License  
Description of Evidence of Identity

to be the person(s) whose name(s) is/are signed on the preceding or attached document, and acknowledged to me that he/she/they signed it voluntarily for its stated purpose( )

☐ as partner(s) for \_\_\_\_\_  
Name of Partnership

\_\_\_\_\_, a partnership.

☐ as \_\_\_\_\_ for  
Title of Office

\_\_\_\_\_, a corporation.  
Name of Corporation

☐ as attorney in fact for \_\_\_\_\_  
Name of Principal Signer

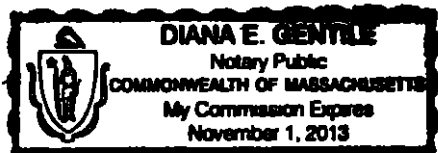
\_\_\_\_\_, the principal.

☐ as \_\_\_\_\_ for \_\_\_\_\_  
Type of Capacity

\_\_\_\_\_, a/the \_\_\_\_\_  
Name of Person/Entity Type of Entity

Diana E. Gentile  
Signature of Notary Public

Diana E. Gentile  
Printed Name of Notary



Place Notary Seal and/or Any Stamp Above

My Commission Expires 11/1/2013

OPTIONAL

Although the information in this section is not required by law, it may prove valuable to persons relying on the document and could prevent fraudulent removal and reattachment of this form to another document

Description of Attached Document

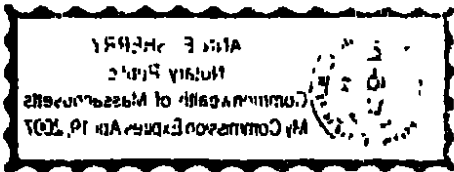
Title or Type of Document: Assignment (Colombia)

Document Date: 12/13/06 Number of Pages: 1

Signer(s) Other Than Named Above: Shamir Ghosh

Right Thumbprint  
of Signer

Top of thumb here



I HEREBY CERTIFY THAT THIS  
IS THE ORIGINAL DOCUMENT

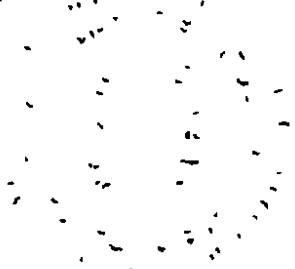
*San Sandoz*

District of Columbia : SS  
Subscribed and Sworn to before me

this 8 day of Jan

*Candelaria O. McGee*  
Candelaria O. McGee, Notary Public, D.C.

My commission expires April 14, 2008





# Apostille

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. *District of Columbia*  
*United States of America*

2. This public document has been signed by CANDELARIA O. MCGEE
3. acting in the capacity of NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE DISTRICT OF COLUMBIA  
CANDELARIA O. MCGEE, NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE
4. bears the seal/stamp of DISTRICT OF COLUMBIA

## CERTIFIED

5. at Washington, D.C.
6. the 8 day of JANUARY 2007
7. by Secretary of the District of Columbia
8. No. 167403
9. Seal/Stamp



10. Signature  
PATRICIA ELWOOD

Patricia Elwood

-----TRADUCCION OFICIAL No. 070115-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

(Anexo a un documento de cesión de patente escrito en Ingles a favor de Millenium Pharmaceuticals, Inc.)

(Sello): ANN E. SHERRY

Notario Público

Estado de Massachusets - Mi comisión vence en Abril 19, 2007

(Al anverso, sello que dice): Certifico por el presente que este es el documento original

(fdo) ilegible

Distrito de Columbia, conste que:

Suscrito y jurado ante mí hoy día 8 de Enero de 2007.

(fdo) ilegible

Candelaria O. McGee, Notario Público, D. C.

Mi comisión vence Abril 14, 2006 (Sello en relieve)

---

**MASSACHUSETTS - RECONOCIMIENTO PARA TODOS LOS FINES**

Estado De Massachussets

Condado de Middlesex

Hoy día 13 de Diciembre de 2006, ante mí, Diana E. Gentile, el suscrito

Notario Público, comparecieron personalmente Amy M. Elder, Sean J.

Harrison, Christelle Renou, Frederick A. Hicks, Dominic Reynolds

quienes probaron ante mí mediante evidencia satisfactoria de su



identidad, consistente en: Licencia de Conducción, ser la(s) persona(s) cuyos nombres están firmados en el documento anterior y adjunto, y reconocieron ante que son las personas que lo firmaron voluntariamente para los fines indicados, como: ☐ socio de \_\_\_\_\_ ☐ como (cargo) \_\_\_\_\_ en la sociedad \_\_\_\_\_ ☐ como apoderado de: (nombre del firmante principal) \_\_\_\_\_ ☐ como (cargo) para \_\_\_\_\_ nombre de la persona/entidad, en \_\_\_\_\_ (tipo de entidad).  
(fdo) Diana E. Gentile (firma del Notario Público) Diana E. Gentile

Mi comisión vence: 11/1/2013

Sello notarial: DIANA E. GENTILE – Notario Público

Estado de Massachussets – Mi comisión vence Nov. 1, 2013

Aunque la información en esta sección no la exige la ley, puede ser valiosa a personas que confían en el documento y puede evitar eliminaciones o adiciones de este formato como otro documento.

Descripción del documento adjunto

Título o tipo de documento: CESION (Colombia)

Fecha del documento: 12/12/06 Número de páginas 1

Firmantes distintos de los nombrados antes: (fdo) Shamir Ghosh.

---

#### APOSTILLA

(Convención de La Haya de Octubre 5, 1961)

1. Distrito de Columbia, Estados Unidos de América
2. Este documento público ha sido firmado por CANDELARIA O. MCGEE

DORA DUQUE DE BERNAL  
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
RES 02755/08 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
REP. DE COLOMBIA

+

3. actuando en su carácter de NOTARIO PUBLICO EN Y PARA EL  
DISTRITO DE COLUMBIA

4. lleva el sello de CANDELARIA O. MCGEE, NOTARIO PUBLICO EN  
Y PARA EL DISTRITO DE COLUMBIA

Certificado

- 5. en Washington, D. C.
- 6. el día 8 de Enero de 2007
- 7. por el Secretario del Distrito de Columbia
- 8. No. 167403

9. Sello: 10. Firma PATRICIA ELWOOD  
(fdo) ilegible

(Sello del Distrito de Columbia)

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

*[Handwritten signature]*

DORA DUQUE DE BERNAL  
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
REP. DE COLOMBIA

MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERNA S.

560231

*Dora Diaz*  
CUYA FIRMA ATUECE EN EL  
DOCUMENTO DESEMPLEA  
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2007 FEB - I A 11: 32

*ms*

JEFE DE LEGALIZACIONES  
BOGOTA D.C.

**DOCUMENTO DE CESION  
ASSIGNMENT DOCUMENT**

Los suscritos  
(We, the undersigned)

1. GHOSH Shomir, 134 Sewall Avenue, Unit C, Brookline, Massachusetts 02446, USA
2. ELDER Amy M., 15 Westminster Avenue, Arlington, MA 02474 USA
3. CARSON Kenneth G., 96 Herrontown Road, Princeton, New Jersey 08540 USA
4. SPROTT Kevin T., 67 Monument Avenue #2, Boston, MA 02129 USA
5. HARRISON Sean J., 38 Grove Street, Somerville, MA 02478 USA
6. HICKS Frederick A., 5 Woodbine Street, Somerville, MA 02143 USA
7. RENOU Christelle C., 74 Josephine Avenue, Unit A., Somerville MA 02144 USA
8. REYNOLDS Dominic, 304 Allston Street, Apt. 6, Cambridge, MA 01239 USA

declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título  
(declare that we are the inventors of the invention titled)

**"ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR DE PGD2 PARA EL TRATAMIENTO DE  
ENFERMEDADES INFLAMATORIAS".**

**(PGD2 RECEPTOR ANTAGONISTS FOR THE TREATMENT OF INFLAMATORY  
DISEASES)**

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios  
y anexos, a favor

(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its  
privileges and attachments, to

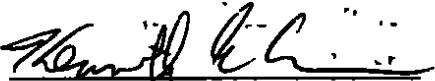
**MILLENIUM PHARMACEUTICALS, INC.,**

domiciliada en  
(domiciled in) Cambridge, Massachusetts, USA

**SIGNATURAS OF ASSIGNORS**

Signed at  
on November 16, 2006

1. GHOSH Shomir



3. CARSON Kenneth G.

5. HARRISON Sean J.

7. RENOU Christelle C.

**FIRMA DE LOS CEDENTES**

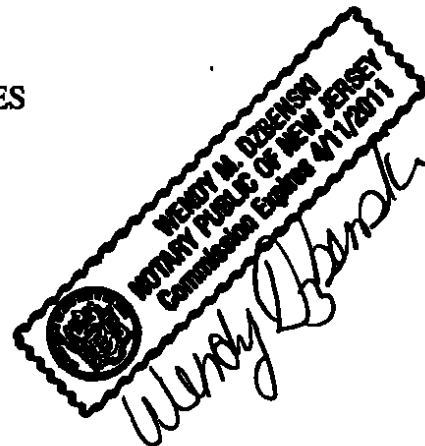
Firmado en  
el

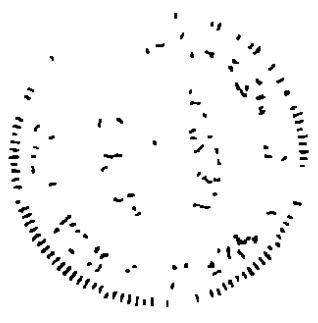
2. ELDER Amy M.

4. SPROTT Kevin T.

6. HICKS Frederick A.

8. REYNOLDS Dominic





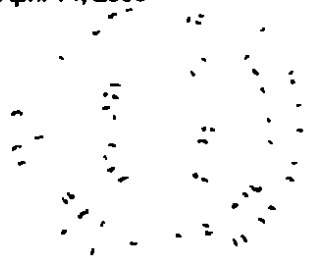
I HEREBY CERTIFY THAT THIS  
IS THE ORIGINAL DOCUMENT

*Sam Scumlek*

District of Columbia : SS  
Subscribed and Sworn to before me

this 20 day of July 2007  
*Candelaria O. McGee*  
Candelaria O. McGee, Notary Public, D.C.

My commission expires April 14, 2008



587



# Apostille

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. *District of Columbia*  
*United States of America*

2. This public document has been signed by CANDELARIA O. MCGEE

3. acting in the capacity of NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE DISTRICT OF COLUMBIA

CANDELARIA O. MCGEE, NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE

4. bears the seal/stamp of DISTRICT OF COLUMBIA

## CERTIFIED

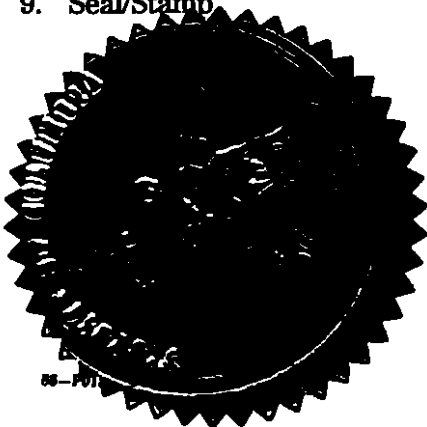
5. at Washington, D.C.

6. the 8 day of JANUARY 2007

7. by Secretary of the District of Columbia

8. No. 167402

9. Seal/Stamp



10. Signature  
PATRICIA ELWOOD

Patricia Elwood

7

-----TRADUCCION OFICIAL No. 070117-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

(Anexo a un documento de cesión de patente escrito en Ingles a favor de Millenium Pharmaceuticals, Inc.) (firma de Kenneth G. CARSON)

(fdo) ilegible

Wendy M. Dzbenski

Notario Público de New Jersey

La comisión vence 4/11/2011 (Sello en relieve)

(Al anverso, sello que dice): Certifico por el presente que este es el documento original

(fdo) ilegible

Distrito de Columbia, conste que:

Suscrito y jurado ante mí hoy día 8 de Enero de 2007.

(fdo) ilegible

Candelaria O. McGee, Notario Público, D. C.

Mi comisión vence Abril 14, 2006 (Sello en relieve)

---

APOSTILLA

(Convención de La Haya de Octubre 5, 1961)

1. Distrito de Columbia, Estados Unidos de América
2. Este documento público ha sido firmado por CANDELARIA O. MCGEE

DORA DUCQUE DE BERNAL  
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
 RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
 REP. DE COLOMBIA

3. actuando en su carácter de NOTARIO PUBLICO EN Y PARA EL  
DISTRITO DE COLUMBIA

4. lleva el sello de CANDELARIA O. MCGEE, NOTARIO PUBLICO EN  
Y PARA EL DISTRITO DE COLUMBIA

Certificado

5. en Washington, D. C.

6. el día 8 de Enero de 2007

7. por el Secretario del Distrito de Columbia

8. No. 167402

9. Sello:

10. Firma PATRICIA ELWOOD

(fdo) ilegible

(Sello del Distrito de Columbia)

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, D. C., Enero 30, 2007

*[Firma manuscrita]*

DORA DUQUE DE BERNAL  
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
REG. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
REP. DE COLOMBIA

RECEIVED  
BOGOTÁ D.C.  
SECRETARÍA DE JUSTICIA  
Y DE LEGISLACIONES  
2007-01-31 11:31

MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERIORES

560226

DOY Q. Doy Q.  
CUYA FIRMA APARECE EN EL  
DOCUMENTO DESEMPLEA  
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2007 FEB - 1 A 11: 31

JCS  
JEFE DE LEGALIZACIONES  
BOGOTÁ D.C.

**DOCUMENTO DE CESION  
ASSIGNMENT DOCUMENT**

Los suscritos  
(We, the undersigned)

1. GHOSH Shomir, 134 Sewall Avenue, Unit C, Brookline, Massachusetts 02446, USA
2. ELDER Amy M., 15 Westminster Avenue, Arlington, MA 02474 USA
3. CARSON Kenneth G., 96 Herrontown Road, Princeton, New Jersey 08540 USA
4. SPROTT Kevin T., 67 Monument Avenue #2, Boston, MA 02129 USA
5. HARRISON Sean J., 38 Grove Street, Somerville, MA 02478 USA
6. HICKS Frederick A., 5 Woodbine Street, Somerville, MA 02143 USA
7. RENOU Christelle C., 74 Josephine Avenue, Unit A., Somerville MA 02144 USA
8. REYNOLDS Dominic, 304 Allston Street, Apt. 6, Cambridge, MA 01239 USA

declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título  
(declare that we are the inventors of the invention titled)

**“ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR DE PGD2 PARA EL TRATAMIENTO DE  
ENFERMEDADES INFLAMATORIAS”.**  
(PGD2 RECEPTOR ANTAGONISTS FOR THE TREATMENT OF INFLAMMATORY  
DISEASES)

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios  
y anexos, a favor  
(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its  
privileges and attachments, to

**MILLENIUM PHARMACEUTICALS, INC.,**

domiciliada en  
(domiciled in) Cambridge, Massachusetts, USA

**SIGNATURAS OF ASSIGNORS**

Signed at  
on December 21, 2006

1. GHOSH Shomir

3. CARSON Kenneth G.

5. HARRISON Sean J.

7. RENOU Christelle C

**FIRMA DE LOS CEDENTES**

Firmado en  
el

2. ELDER Amy M.

4. SPROTT Kevin T.

6. HICKS Frederick A.

8. REYNOLDS Dominic

*Marian Rapperty*  
MARIAN RAPPERTY  
PUBLIC NOTARY

I HEREBY CERTIFY THAT THIS  
IS THE ORIGINAL DOCUMENT

*Sam Sunk*

District of Columbia : SS

Subscribed and Sworn to before me

this 8 day of June 2007

*Candela O. McGee*  
Candela O. McGee, Notary Public, D.C.

My commission expires April 14, 2008



591

# Apostille

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. *District of Columbia*  
*United States of America*

2. This public document has been signed by CANDELARIA O. MCGEE

3. acting in the capacity of NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE DISTRICT OF COLUMBIA

CANDELARIA O. MCGEE, NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE

4. bears the seal/stamp of DISTRICT OF COLUMBIA

## CERTIFIED

5. at Washington, D.C.

6. the 8 day of JANUARY 2007

7. by Secretary of the District of Columbia

8. No. 167401

9. Seal/Stamp



10. Signature

PATRICIA ELWOOD

Patricia Elwood

H

-----TRADUCCION OFICIAL No. 070116-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

(Anexo a un documento de cesión de patente escrito en Ingles a favor de Millenium Pharmaceuticals, Inc.) (firma de Kevin T. SPROTT)

(fdo) ilegible

Marian Rapperty

Notario Público

(Al anverso, sello que dice): Certifico por el presente que este es el documento original

(fdo) ilegible

Distrito de Columbia, conste que:

Suscrito y jurado ante mí hoy día 8 de Enero de 2007.

(fdo) ilegible

Candelaria O. McGee, Notario Público, D. C.

Mi comisión vence Abril 14, 2006 (Sello en relieve)

---

APOSTILLA

(Convención de La Haya de Octubre 5, 1961)

1. Distrito de Columbia, Estados Unidos de América
2. Este documento público ha sido firmado por CANDELARIA O. MCGEE
3. actuando en su carácter de NOTARIO PUBLICO EN Y PARA EL DISTRITO DE COLUMBIA

DORA DUQUE DE BERNAL  
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
REP. DE COLOMBIA



MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERIORES

560225

*Para Deque*  
Cuya firma aparece en el  
documento de entrega  
las funciones indicadas

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

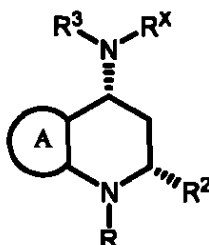
2007 FEB - I A 11: 31

*UCS*

JEFE DE LEGALIZACIONES  
BOGOTÁ D.C.

**REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto de fórmula I-A:



5

**I-A**

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

El anillo A es un aromático monocíclico opcionalmente sustituido;

10 R es  $-X_1-R^1$ ;

$R^X$  es  $-X_2-R^4$ ;

cada uno de  $X_1$  y  $X_2$  son independientemente  $-S(O)_2-$ ,  $-C(O)-$ , o  $-C(O)NH-$ ;

$R^1$  es:

15 A) un grupo aromático o grupo heteroaromático que tiene 5-6 átomos en el anillo, condensado a un anillo heterocíclico monocíclico no aromático o anillo monocíclico aromático o heteroaromático donde el anillo heterocíclico no aromático, el anillo aromático, o el anillo heteroaromático están opcionalmente sustituidos; o

20 B) un grupo aromático o grupo heteroaromático que tiene 5-6 átomos en el anillo, sustituido con:

i)  $T^1-V-T-R^Y$ ;

ii)  $T^1-V-T-M-R^Y$ ; o

iii)  $V-R^9$ , donde  $R^9$  es un grupo carbocíclico o heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido;

25 y donde el grupo aromático o heteroaromático que tiene 5-6 átomos en el anillo está opcionalmente sustituido también con 1-2 grupos seleccionados independientemente representados por  $R^Z$ ;

cada  $R^Z$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^o$ , -  
 $OR^o$ , -O(haloalquilo), - $SR^o$ , - $NO_2$ , -CN, - $N(R')_2$ , - $NR'CO_2R^o$ , - $NR'C(O)R^o$ , -  
 $NR'NR'C(O)R^o$ , - $N(R')C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'CO_2R^o$ , -  
 $C(O)C(O)R^o$ , - $C(O)CH_2C(O)R^o$ , - $CO_2R^o$ , - $C(O)R^o$ , - $C(O)N(R^o)_2$ , - $OC(O)R^o$ , -  
 5  $OC(O)N(R^o)_2$ , - $S(O)_2R^o$ , - $SO_2N(R')_2$ , - $S(O)R^o$ , - $NR'SO_2N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^o$ , -  
 $C(=S)N(R')_2$  y - $C(=NH)-N(R')_2$ ;

cada  $R'$  es independientemente hidrógeno, alquilo, - $C(O)OR^o$ ,  $S(O)_2R^o$  o -  
 $C(O)R^o$ ;

cada  $R^o$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo, grupo  
 10 heterocíclico no aromático o grupo aromático y el alquilo, el grupo heterocíclico  
 no aromático y el grupo aromático representados por  $R^o$  están opcionalmente  
 sustituidos con uno o más grupos seleccionados independientemente  
 representados por  $R^\#$ ;

$R^\#$  es  $R^+$ , - $OR^+$ , -O(haloalquilo), - $SR^+$ , - $NO_2$ , -CN, - $N(R^+)_2$ , - $NHCO_2R^+$ , -  
 15  $NHC(O)R^+$ , - $NHNHC(O)R^+$ , - $NHC(O)N(R^+)_2$ , - $NHNHC(O)N(R^+)_2$ , - $NHNHCO_2R^+$ ,  
 - $C(O)C(O)R^+$ , - $C(O)CH_2C(O)R^+$ , - $CO_2R^+$ , - $C(O)R^+$ , - $C(O)N(R^+)_2$ , - $OC(O)R^+$ , -  
 $OC(O)N(R^+)_2$ , - $S(O)_2R^+$ , - $SO_2N(R^+)_2$ , - $S(O)R^+$ , - $NHSO_2N(R^+)_2$ , - $NHSO_2R^+$ , -  
 $C(=S)N(R^+)_2$  o - $C(=NH)-N(R^+)_2$ ;

$R^+$  es -H, un grupo alquilo  $C_1-C_3$ , un grupo heteroarilo monocíclico, un grupo  
 20 heterocíclico no aromático o un grupo fenilo opcionalmente sustituido con  
 alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, halo, -CN, - $NO_2$ , amina, alquilamina o  
 dialquilamina; o - $N(R^+)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático, con la  
 condición de que los grupos heterocíclicos no aromáticos representados por  $R^+$   
 y - $N(R^+)_2$  que comprenden una amina de anillo secundario están opcionalmente  
 25 acilados o alquilados;

$V$  es un enlace covalente, -O-, - $C(O)$ -, - $N(R')$ -, -S-, - $S(O)$ -, - $C(O)NR^5$ -, -  
 $NR^5C(O)$ -, - $S(O)_2NR^5$ -, - $NR^5S(O)_2$ - o - $S(O)_2$ -;

$T$  es alquilenos  $C_{1-10}$  de cadena lineal;

$T^1$  es un enlace covalente o un alquilenos  $C_{1-10}$  de cadena lineal, donde  $T$  y  $T^1$   
 30 juntos no contienen más de 10 átomos de carbono y donde  $T$  y  $T^1$  están  
 opcional e independientemente sustituidos en cualquiera de uno o más de los

átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, espiro cicloalquilo, nitrógeno opcionalmente *N*-sustituido que contiene un grupo heterocíclico no aromático espiro, un grupo heterocíclico no aromático espiro que contiene O, amina, alquilamina, dialquilamina, alcoxi o hidroxilo;

M es un grupo opcionalmente sustituido seleccionado entre grupo aromático monocíclico, heteroaromático, carbocíclico monocíclico no aromático o heterocíclico;

$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-OC(O)R^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2R^5$ ,  $-S(O)_2COR^5$ ,  $-S(O)_2N(R^5)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-NR^5S(O)_2OR^5$ ,  $-S(O)OR^5$ ,  $-S(O)R^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-CN$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OC(O)N(R^5)_2$ ,  $-N(R^5)_2$ ,  $-OR^5$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido;

con la condición de que T es  $C_{2-10}$  cuando V es un enlace covalente y T es  $C_{2-10}$  cuando V es  $-O-$ ,  $-S-$  o  $-N(R^1)-$  y  $R^Y$  es  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-N(R^5)_2$

cada  $R^5$  es independientemente  $-H$ , alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo, carboxialquilo,  $-C(O)OCH_2C_6H_5$ ,  $S(O)_2CH_3$ ,  $-C(O)OH$ ,  $-C(O)OMe$ ,  $-C(O)OEt$ ,  $C(O)NH_2$ , bencilo, pirrolidinilo, morfolinilo o  $-N(R^5)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático que contiene nitrógeno;

$R^2$  es alquilo  $C_{1-3}$ ;

$R^3$  es un grupo monocíclico o bicíclico opcionalmente sustituido seleccionado entre un grupo aromático, heteroaromático, carbocíclico no aromático y heterocíclico no aromático; y

$R^4$  es alquilo  $C_{1-8}$  opcionalmente sustituido, hidroxialquilo  $C_{1-4}$ , o cicloalquilo  $C_{3-8}$  opcionalmente sustituido,

con la condición de que el compuesto de fórmula I-A sea diferente de:

(±)-*Cis*-N-[1-(1H-indol-2-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(benzofuran-2-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; éster etílico del ácido (±)-*Cis*-[4-[2-metil-4-(fenil-propionil-amino)-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenoxi]-acético; ácido (±)-*Cis*-[4-[2-Metil-4-(fenil-propionil-amino)-3,4-dihidro-2H-

- quinolina-1-carbonil]-fenoxi}-acético; (±)-*Cis*-N-{2-metil-1-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(4-carbamoilmetoxi-benzoil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-[4-(2-hidroxi-2-metil-propoxi)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(4-dimetilcarbamoilmetoxi-benzoil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(benzo[b]tiofeno-3-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-acetamida; (±)-*Cis*-N-[1-(benzo[b]tiofeno-2-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; ácido (±)-*Cis*-{4-[4-(acetil-fenil-amino)-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenilamino}-acético; (±)-*Cis*-N-[1-(1-isopropil-1H-benzotriazol-5-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida, éster etílico del ácido (±)-*Cis*-4-{4-[2-metil-4-(fenil-propionil-amino)-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenil}-piperidina-1-carboxílico; (±)-*Cis*-N-[2-metil-1-(4-piperidin-4-il-benzoil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-[4-(1-acetil-piperidin-4-il)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-[4-(1-etil-piperidin-4-il)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[2-metil-1-(4-metil-piperazin-1-il)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[2-metil-1-(4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina-7-carbonil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[2-Metil-1-(4-morfolin-4-il-benzoil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[2-metil-1-(4-pirrolidin-1-il-benzoil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; éster metílico del ácido (±)-*Cis*-2-{4-[4-(acetil-fenil-amino)-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenilamino}-propiónico; (±)-*Cis*-2-{4-[4-(acetil-fenil-amino)-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenilamino}-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxine-6-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; (±)-*Cis*-N-[1-(benzo[c]isoxazol-3-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-N-fenil-propionamida; éster etílico del ácido (±)-*Cis*-4-(4-{4-[(4-cloro-fenil)-propionil-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-butírico; ácido (±)-

- Cis*-4-(4-{4-[(4-cloro-fenil)-propionil-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-butírico; (±)-*Cis*-N-(4-cloro-fenil)-N-{2-metil-1-[4-(1H-tetrazol-5-ilmetoxi)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-propionamida; (±)-*Cis*-N-(4-cloro-fenil)-N-{1-[4-(3-hidroxi-2,2-dimetil-propoxi)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-acetamida; éster metílico del ácido (±)-*Cis*-3-(4-{4-[acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-2,2-dimetil-propiónico; (±)-*Cis*-N-(4-cloro-fenil)-N-[1-(4-ciclopentiloxi-benzoil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; (±)-*Cis*-N-{1-[4-(4-Acetil-piperazin-1-il)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-N-(4-cloro-fenil)-acetamida; (2*S*, 4*R*)- N-(4-Cloro-fenil)-N-[2-metil-1-(4-morfolin-4-il-benzoil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; ácido (2*S*, 4*R*)- 4-(4-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-butírico; (2*S*, 4*R*)- N-(4-Cloro-fenil)-N-[2-metil-1-(6-morfolin-4-il-piridina-3-carbonil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; éster etílico del ácido (2*S*, 4*R*)- 4-(4-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-piperidina-1-carboxílico; (2*S*, 4*R*)-N-(4-Cloro-fenil)-N-{2-metil-1-[4-(2-morfolin-4-il-etoxi)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-acetamida; ácido (2*S*, 4*R*)-4-(4-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-acético; (2*S*, 4*R*)- N-(4-Cloro-fenil)-N-{2-metil-1-[4-(1H-tetrazol-5-ilmetoxi)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-acetamida; (2*S*, 4*R*)-N-{1-[4-(1-Acetil-piperidin-4-iloxi)-benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-N-(4-cloro-fenil)-acetamida; (2*S*, 4*R*)- N-(4-Cloro-fenil)-N-{2-metil-1-[4-(piridin-4-ilmetoxi)-benzoil]-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il}-acetamida; ácido (2*S*, 4*R*)- 4-(3-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenoxi)-butírico; éster etílico del ácido (2*S*, 4*R*)-4-(4-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenil)-piperidina-1-carboxílico; (2*S*, 4*R*)-N-(4-Cloro-fenil)-N-[2-metil-1-(4-pirrolidin-1-il-benzoil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; (2*S*, 4*R*)-N-(4-Cloro-fenil)-N-[1-(1-isopropil-1H-benzotriazol-5-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; ácido (2*S*, 4*R*)- 3-(4-{4-[Acetil-(4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil}-fenil)-propiónico; ácido (2*S*, 4*R*)-3-(4-{4-[Acetil-

- (4-cloro-fenil)-amino]-2-metil-3,4-dihidro-2H-quinolina-1-carbonil]-fenil)-acrílico;  
 N-[(2S,4R)-1-[4-(1-acetilpiperidin-4-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida; N-[(2R,4S)-1-[4-(1-acetilpiperidin-4-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida; N-[(2S,4R)-2-metil-1-(4-morfolin-4-ilbenzoil)-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida;  
 5 N-[(2R,4S)-2-metil-1-(4-morfolin-4-ilbenzoil)-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida; N-[(2S,4R)-1-[4-(1-acetilpiperidin-4-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida; N-[(2R,4S)-1-[4-(1-acetilpiperidin-4-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilpropanamida;  
 10 N-[(2S,4R)-1-[4-(1-acetilpiperidin-4-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; ácido (4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)butanoico; N-[(2S,4R)-1-[4-(2-amino-2-oxoetoxi)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; carboxilato de 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenil)-3,6-dihidropiridina-1(2H) etilo,  
 15 N-[(2S,4R)-1-(1,3-benzodioxol-5-ilcarbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilacetamida; N-[(2S,4R)-2-metil-1-[(3-metil-1-benzofuran-2-il)carbonil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-fenilacetamida; 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)-N-etilbutanamida; N-(4-Clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-(3-etil-4-fluorobenzoil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida;  
 20 4-(4-[(2S,4R)-4-[Acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)-2,2-dimetilbutanamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-2-metil-1-[4-(4-oxo-4-pirrolidin-1-ilbutoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; 4-(4-[(2S,4R)-4-[Acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)butanamida;  
 25 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)-N-(metilsulfonil)butanamida; butanoato de 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)etilo;  
 30 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi)-N-hidroxibutanamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-[4-(3-cianopropoxi)benzoil]-2-

- metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il}acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-{4-[3-(1,2,4-oxadiazol-5-il)propoxi]benzoil}-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il}acetamida; 3-(4-[[{(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi]propanamida; N-((2S,4R)-1-[4-(3-aminopropoxi)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)-N-(4-clorofenil)acetamida; N-((2S,4R)-1-[4-(2-amino-2-oxoetoxi)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)-N-(4-clorofenil)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-{4-[2-(metilamino)-2-oxoetoxi]benzoil}-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; 2-(4-[[{(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil}fenoxi]-N,N-dimetilacetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-[4-(2-morfolin-4-il-2-oxoetoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-{4-[2-(2-oxopirrolidin-1-il)etoxi]benzoil}-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-1-[4-[2-(1H-imidazol-1-il)etoxi]benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-[4-(2-pirrolidin-1-iletoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-1-(2,3-dihidro-1-benzofuran-5-ilcarbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-Clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-[4-(3-pirrolidin-1-ilpropoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-[4-(3-morfolin-4-ilpropoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-{4-[(4-oxopentil)oxi]benzoil}-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-Clorofenil)-N-((2S,4R)-1-[4-(3-hidroxi-3-metilbutoxi)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-Clorofenil)-N-((2S,4R)-1-{4-[(4-hidroxi-4-metilpentil)oxi]benzoil}-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-1-[4-[(1-etilpiperidin-4-il)metoxi]benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-1-[4-[3-(1H-imidazol-1-il)propoxi]benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il)acetamida; (2S,4R)-N-(4-Cloro-fenil)-N-[2-metil-1-(4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina-7-carbonil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-4-il]-acetamida; N-(4-clorofenil)-N-((2S,4R)-2-metil-1-[(4-metil-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-

- il)carbonil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-[4-(4-etilpiperazin-1-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; N-[(2S,4R)-1-[4-(4-acetilpiperazin-1-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-[4-(4-glicololpiperazin-1-il)benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-2-metil-1-[4-(3-morfolin-4-ilprop-1-in-1-il)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; ácido 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenil)but-3-inoico; N-[(2S,4R)-1-(1H-bencimidazol-2-ilcarbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; N-[(2S,4R)-1-(1,3-benzotiazol-2-ilcarbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-2-metil-1-[(1-metil-1H-1,2,3-benzotriazol-5-il)carbonil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-[(1-isopropil-1H-bencimidazol-5-il)carbonil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; ácido [4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenil)piperazin-1-il]acético; N-[(2S,4R)-1-[4-(2-amino-2-oxoetil)piperazin-1-il]benzoil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]-N-(4-clorofenil)acetamida; ácido 3-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)propanoico; ácido 4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)-2,2-dimetilbutanoico; ácido {1-[4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)metil]ciclopropil}acético; ácido (2E)-4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)but-2-enoico; ácido 3-(4-[(2S,4R)-4-[Acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)-2,2-dimetilpropanoico; ácido (2E)-4-(4-[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]fenoxi)-2-metilbut-2-enoico; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-2-metil-1-[4-(3-[(trifluorometil)sulfonil]amino}propoxi)benzoil]-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida; N-(4-clorofenil)-N-[(2S,4R)-1-[1-(2-hidroxietil)-2-metil-1H-bencimidazol-5-il]carbonil]-2-metil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-4-il]acetamida;

ácido 5-[[[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]-2-metil-1H-bencimidazol-1-il]acético; ácido 3-(5-[[[(2S,4R)-4-[acetil(4-clorofenil)amino]-2-metil-3,4-dihidroquinolin-1(2H)-il]carbonil]-1H-1,2,3-benzotriazol-1-il]propanoico; (2S,4R)-N-(4-Cloro-fenil)-N-[1-(1-isopropil-1H-indazol-5-carbonil)-2-metil-1,2,3,4-tetrahydro-quinolin-4-il]-acetamida; o (2S,4R)-N-(4-Cloro-fenil)-N-(2-metil-1-{4-[3-(1H-tetrazol-5-il)-propoxi]-benzoil}-1,2,3,4-tetrahydro-quinolin-4-il)-acetamida.

2. El compuesto de la reivindicación 1, donde:
- 10 el Anillo A es un aromático monocíclico opcionalmente sustituido;  
 R es  $-X_1-R^1$ ;  
 $R^X$  es  $-X_2-R^4$ ;  
 $X_1$  y  $X_2$  son cada uno independientemente  $-S(O)_2-$ ,  $-C(O)-$ , o  $-C(O)NH-$ ;  
 $R^1$  es: A) un grupo aromático o grupo heteroaromático que tiene 5-6 átomos en  
 15 el anillo, sustituidos por:  
     i)  $T^1-V-T-R^Y$ ;  
     ii)  $T^1-V-T-M-R^Y$ ; o  
     iii)  $V-R^9$  donde  $R^9$  es un grupo carbocíclico o heterocíclico no  
     aromático opcionalmente sustituido;  
 20 y donde el grupo aromático o heteroaromático representado por  $R^1$  está  
 sustituido además opcionalmente por 1-2 grupos seleccionados  
 independientemente representados por  $R^Z$ ; o  
     B) un grupo aromático o grupo heteroaromático que tiene 5-6  
     átomos en el anillo, condensados a un anillo heterocíclico no  
 25 aromático monocíclico o anillo aromático monocíclico donde el  
 anillo heterocíclico no aromático o el anillo aromático están  
 opcionalmente sustituidos;  
     cada  $R^Z$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  
 $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  
 30  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  
 $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,

$-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^0$ ,  $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$ ,  
 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}')_2$ , y  $-\text{C}(=\text{NH})-\text{N}(\text{R}')_2$ ;

cada  $\text{R}'$  es independientemente hidrógeno, alquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^0$ ,  $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^0$ , o  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ;

5 cada  $\text{R}^0$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo, grupo heterocíclico no aromático o grupo aromático y el alquilo, grupo heterocíclico no aromático y grupo aromático representado por  $\text{R}^0$  está opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $\text{R}^\#$ ;

10  $\text{R}^\#$  es  $\text{R}^+$ ,  $-\text{OR}^+$ ,  $-\text{O}(\text{haloalquilo})$ ,  $-\text{SR}^+$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{NHCO}_2\text{R}^+$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{NHNHCO}_2\text{R}^+$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^+$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^+$ ,  $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^+$ ,  $-\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^+)_2$ ,  $-\text{NHSO}_2\text{R}^+$ ,  $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^+)_2$ , o  $-\text{C}(=\text{NH})-\text{N}(\text{R}^+)_2$ ;

15  $\text{R}^+$  es  $-\text{H}$ , un grupo alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , un grupo heteroarilo monocíclico, un grupo heterocíclico no aromático o un grupo fenilo opcionalmente sustituido con alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, halo,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{NO}_2$ , amina, alquilamina o dialquilamina; o  $-\text{N}(\text{R}^+)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático, con la condición de que los grupos heterocíclicos no aromáticos representados por  $\text{R}^+$   
 20 y  $-\text{N}(\text{R}^+)_2$  que comprenden un anillo amina secundario amina están opcionalmente acilados o alquilados;

$\text{R}^Y$  es  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{COR}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^5_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ,  $\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^5_2$ ,  $-\text{NR}^5_2$ ,  $-\text{OR}^5$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente  
 25 sustituido o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido;

$\text{V}$  es un enlace covalente,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{N}(\text{R}')-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{S}(\text{O})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5-$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^5-$ ,  $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2-$ , o  $-\text{S}(\text{O})_2-$ ;

$\text{T}$  es un alquileo  $\text{C}_{1-10}$  de cadena lineal; con la condición de que  $\text{T}$  es  $\text{C}_{2-10}$  cuando  $\text{V}$  es un enlace covalente, y  $\text{T}$  es  $\text{C}_{2-10}$  cuando  $\text{V}$  es  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ , o  $-\text{N}(\text{R}')-$   
 30 y  $\text{R}^Y$  es  $-\text{CN}$ ,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^5)_2$ ;

T<sup>1</sup> es un enlace covalente, o un alquileo C<sub>1-10</sub> de cadena lineal, donde T y T<sup>1</sup> juntos no contienen más de 10 átomos de carbono, y donde T y T<sup>1</sup> están opcional e independientemente sustituidos en cualquiera de uno o más átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, espiro cicloalquilo, nitrógeno opcionalmente N-sustituido que contiene un grupo heterocíclico no aromático espiro, amina, alquilamina, dialquilamina, o hidroxilo;

5 cada R<sup>5</sup> es independientemente -H, alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo, carboxialquilo, -C(O)OCH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(O)OH, -C(O)OMe, -C(O)OEt, C(O)NH<sub>2</sub>, bencilo, pirrolidinilo, morfolinilo, o -N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> es un nitrógeno-que  
10 contiene un grupo heterocíclico no aromático;

M es un aromático monocíclico, heteroaromático opcionalmente sustituido o un grupo carbocíclico no aromático monocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido;

15 R<sup>2</sup> es alquilo C<sub>1-3</sub>;

R<sup>3</sup> es un grupo aromático opcionalmente sustituido que tiene 5-6 átomos en el anillo; y

R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1-3</sub> o hidroxialquilo C<sub>1-3</sub>.

20 3. El compuesto de la reivindicación 1, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido;

R<sup>2</sup> es metilo o etilo;

R<sup>3</sup> es un grupo fenilo opcionalmente sustituido;

R<sup>4</sup> es metilo, etilo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclobutilo, o  
25 isopropilo; y

X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son -C(O)-.

4. El compuesto de la reivindicación 2, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido;

30 R<sup>2</sup> es metilo o etilo;

R<sup>3</sup> es un grupo fenilo opcionalmente sustituido;

$R^4$  es metilo, etilo, hidroximetilo, o hidroxietilo; y  
 $X_1$  y  $X_2$  son  $-C(O)-$ .

5. El compuesto de la reivindicación 3, donde:

- 5  $R^1$  es un anillo fenilo sustituido con  $V-T-R^Y$ , y opcionalmente también está sustituido con 1-2 grupos seleccionados independientemente representados por  $R^Z$ ;

$V$  es un enlace covalente,  $-O-$  o  $-N(R')-$ ; y

- 10  $T$  es alquileo  $C_{1-6}$  de cadena lineal opcionalmente sustituido en cualquiera de uno o más de los átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, nitrógeno opcionalmente *N*-sustituido que contiene un grupo espiro heterocíclico no aromático,  $O$  que contiene un grupo espiro heterocíclico no aromático, amina, alquilamina, dialquilamina, alcoxi, o hidroxilo.

15

6. El compuesto de la reivindicación 4, donde:

$R^1$  es un anillo fenilo sustituido con  $V-T-R^Y$ , y opcionalmente también está sustituido con 1-2 grupos seleccionados independientemente representados por  $R^Z$ ;

- 20  $V$  es un enlace covalente,  $-O-$  o  $-N(R')-$ ; y

- $T$  es alquileo  $C_{1-6}$  de cadena lineal opcionalmente sustituido en cualquiera de uno o más de los átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, nitrógeno opcionalmente *N*-sustituido que contiene un grupo espiro heterocíclico no aromático, amina, alquilamina, dialquilamina, o hidroxilo.

25

7. El compuesto de la reivindicación 5 ó 6, donde:

$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2R^5$ ,  $-NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-OR^5$ ,  $-CN$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-N(R^5)_2$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido representado por  $R^7$ , o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido representado por  $R^8$ ;

30

$R^7$  es un grupo opcionalmente sustituido seleccionado entre piperidinonilo, oxazolidinilo, oxazolidinonilo, tiazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, tiazolidinilo, tetrahidrotiofeno, morfolinilo, tiomorfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, dioxanilo, dioxolanilo, ditiolanilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo o piperidinilo; y

$R^8$  es un grupo opcionalmente sustituido seleccionado entre furanilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidilo, tiazolilo, tienilo o imidazolilo

10 8. El compuesto de la reivindicación 7, donde:

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

15 cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , -O(haloalquilo), - $SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi, - $NO_2$ , -CN, - $N(R')_2$ , - $NR'CO_2R^0$ , - $NR'C(O)R^0$ , - $NR'NR'C(O)R^0$ , - $N(R')C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'CO_2R^0$ , - $C(O)C(O)R^0$ , - $C(O)CH_2C(O)R^0$ , - $CO_2R^0$ , - $C(O)R^0$ , - $C(O)N(R^0)_2$ , - $OC(O)R^0$ , - $OC(O)N(R^0)_2$ , - $S(O)_2R^0$ , - $SO_2N(R')_2$ , - $S(O)R^0$ , - $NR'SO_2N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$ , - $C(=S)N(R')_2$ , - $(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ , - $O(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ , - $(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ , - $O(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ , - $(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ , - $O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ , - $(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ , - $O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ , o - $C(=NH)-N(R')_2$ .

9. El compuesto de la reivindicación 7, donde:

25  $R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

30 cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , -O(haloalquilo), - $SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi, - $NO_2$ , -CN, - $N(R')_2$ , - $NR'CO_2R^0$ , - $NR'C(O)R^0$ , - $NR'NR'C(O)R^0$ , - $N(R')C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'CO_2R^0$ , - $C(O)C(O)R^0$ , - $C(O)CH_2C(O)R^0$ , - $CO_2R^0$ , - $C(O)R^0$ , - $C(O)N(R^0)_2$ , - $OC(O)R^0$ , - $OC(O)N(R^0)_2$ , - $S(O)_2R^0$ , - $SO_2N(R')_2$ , - $S(O)R^0$ , - $NR'SO_2N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$ , - $C(=S)N(R')_2$ , o - $C(=NH)-N(R')_2$ .

10. El compuesto de la reivindicación 9, donde:  
R<sup>Y</sup> es -C(O)OR<sup>5</sup>, -C(O)R<sup>5</sup>, -C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>, -OH, un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido representado por R<sup>7</sup> o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido representado por R<sup>8</sup>;  
cada R<sup>5</sup> es independientemente -H, alquilo, o -N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> es un grupo heterocíclico no aromático que contiene nitrógeno;  
R<sup>7</sup> es un grupo opcionalmente sustituido seleccionado entre piperidinonilo, morfolinilo, imidazolidinonilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo o piperidinilo;  
R<sup>8</sup> es un grupo opcionalmente sustituido seleccionado entre tetrazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, piridinilo o imidazolilo;  
V es un enlace covalente, o -O-; y
- 15 T es un alquileo C<sub>1-5</sub> de cadena lineal opcionalmente sustituido en el átomo de carbono adyacente a R<sup>Y</sup> con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, grupo heterocíclico no aromático espiro opcionalmente N-sustituido que contiene nitrógeno, amina, dialquilamina, alcoxi, o hidroxilo.
- 20
11. El compuesto de la reivindicación 9, donde V es -O-.
12. El compuesto de la reivindicación 9, donde V es un enlace covalente y T es un alquileo C<sub>1-5</sub> de cadena lineal sustituido en el átomo de carbono adyacente a R<sup>Y</sup> con alquilo, gem dialquilo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, o un nitrógeno opcionalmente N-sustituido que contiene un grupo heterocíclico no aromático espiro.
- 25
13. El compuesto de la reivindicación 10, donde:
- 30 El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con R<sup>14</sup>;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ , o  $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

$n$  es un número entero de 1-4;

$R^1$  es un anillo fenilo sustituido en las posiciones *para* o *meta* con  $V-T-R^Y$ , y  
opcionalmente también está sustituido con 1-2 grupos seleccionados independientemente representados por  $R^Z$ ;

cada  $R^Z$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ , y  $-OC(O)N(R^0)_2$ ;

cada  $R^{11}$  es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ , y  $-OC(O)N(R^0)_2$ ;

cada  $R'$  es independientemente H o alquilo; y

cada  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo o un grupo alquilo

20

14. El compuesto de la reivindicación 13, donde:

$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OH$ ,  $N$ -morfolinilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-morfolinilo  $N$ -sustituido, 3-morfolinilo  $N$ -sustituido,  $N$ -imidazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 5-imidazolidinilo, 2-imidazolidinilo  $N$ -sustituido,  $N$ -imidazolidinilo  $N'$ -sustituido, 4-imidazolidinilo  $N$ -sustituido, 5-imidazolidinilo  $N$ -sustituido,  $N$ -imidazolidinonilo, 4-imidazolidinonilo, 5-imidazolidinonilo, 4-imidazolidinonilo  $N$ -sustituido, 5-imidazolidinonilo  $N$ -sustituido,  $N$ -pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo  $N$ -sustituido, 3-pirrolidinilo  $N$ -sustituido,  $N$ -pirrolidin-2-onilo, 3-pirrolidin-2-onilo, 4-pirrolidin-2-onilo, 5-pirrolidin-2-onilo, 3-pirrolidin-2-onilo  $N$ -sustituido, 4-pirrolidin-2-onilo  $N$ -sustituido, 5-pirrolidin-2-onilo  $N$ -sustituido,  $N$ -pirrolidin-3-onilo, 2-pirrolidin-3-onilo, 4-pirrolidin-3-onilo, 5-

30

pirrolidin-3-onilo, 2-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, 4-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, 5-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 2-piperidinilo *N*-sustituido, 3-piperidinilo *N*-sustituido, 4-piperidinilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-2-onilo, 3-piperidin-2-onilo, 4-piperidin-2-onilo, 5-piperidin-2-onilo, 6-piperidin-2-onilo, 3-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 4-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-3-onilo, 2-piperidin-3-onilo, 4-piperidin-3-onilo, 5-piperidin-3-onilo, 6-piperidin-3-onilo, 2-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, 4-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-4-onilo, 2-piperidin-4-onilo, 3-piperidin-4-onilo, 5-piperidin-4-onilo, 6-piperidin-4-onilo, 2-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 3-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, *N*-piperazinilo, 2-piperazinilo, *N*-piperazinilo *N'*-sustituido, 2-piperazinilo *N*-sustituido, furanilo, *N*-tetrazolilo, 5-tetrazolilo, 5-tetrazolilo *N*-sustituido, 4-(1,2,3)oxadiazolilo, 5-(1,2,3)oxadiazolilo, 3-(1,2,4)oxadiazolilo, 5-(1,2,4)oxadiazolilo, 3-(1,2,5)oxadiazolilo, 4-(1,2,5)oxadiazolilo, 2-(1,3,4)oxadiazolilo, 5-(1,3,4)oxadiazolilo, *N*-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 2-pirrolilo *N*-sustituido, 3-pirrolilo *N*-sustituido, *N*-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 3-pirazolilo *N*-sustituido, 4-pirazolilo *N*-sustituido, 5-pirazolilo *N*-sustituido, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, *N*-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo; 2-imidazolilo *N*-sustituido, 4-imidazolilo *N*-sustituido, o 5-imidazolilo *N*-sustituido;

V es -O-; y

T es un alquileo  $C_{1-3}$  de cadena lineal sustituido en el átomo de carbono adyacente a  $R^Y$  con flúor, metilo, gem dimetilo, gem difluorofluorometilo, espiro ciclopropilo, espiro ciclobutilo, espiro azetidinilo opcionalmente *N*-sustituido, espiro aziridinilo opcionalmente *N*-sustituido, espiro pirrolidinilo opcionalmente *N*-sustituido, espiro piperidinilo opcionalmente *N*-sustituido, amina, metilamina, dimetilamina, o hidroxilo.

30

15. El compuesto de la reivindicación 14, donde:

cada  $R^2$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , -O(haloalquilo);

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *meta* o *para* por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

5 cada  $R^{11}$  es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , - $N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$  y -O(haloalquilo).

16. El compuesto de la reivindicación 15, donde:

$R^Y$  es - $C(O)OR^5$ , - $C(O)NR^5_2$ , -OH, *N*-tetrazolilo, 5-tetrazolilo, 5-tetrazolilo *N*-sustituido, *N*-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo; 2-imidazolilo *N*-sustituido, 4-imidazolilo *N*-sustituido, o 5-imidazolilo *N*-sustituido; y  
10  $R^5$  es -H, metilo, o etilo.

17. El compuesto de la reivindicación 16, donde:

15 El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $R^{14}$ ;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno,  $R^0$ , - $OR^0$ , - $CO_2R^0$ , - $C(O)R^0$ , - $C(O)N(R^0)_2$ , - $OC(O)R^0$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $NHSO_2R^0$ , - $NHCOR^0$ , -CN,  $NHC(O)N(R^0)_2$ ,  $(CH_2)_nOH$ ,  $O(CH_2)_nOH$ ,  $(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ , o  
20  $O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

$R^1$  es un anillo fenilo sustituido en las posición *para* por V-T- $R^Y$  y opcionalmente está también sustituido en la posición *meta* por  $R^Z$ ;

$R^Z$  es cloruro, fluoruro, bromuro, - $OR^0$ , - $N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$  o - $R^0$ ;

$R'$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo  $C_{1-3}$ ; y

25  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo, o un grupo alquilo  $C_{1-3}$ .

18. El compuesto de la reivindicación 3, donde:

$R^1$  es un anillo fenilo sustituido por V- $R^9$  donde  $R^9$  es un grupo carbocíclico o heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido y opcionalmente está  
30 también sustituido por 1-2 grupos independientemente seleccionados representados por  $R^Z$ .

19. El compuesto de la reivindicación 18, donde  $R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y
- 5 cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , -O(haloalquilo), - $SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi, - $NO_2$ , -CN, - $N(R')_2$ , - $NR'CO_2R^0$ , - $NR'C(O)R^0$ , - $NR'NR'C(O)R^0$ , - $N(R')C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'CO_2R^0$ , - $C(O)C(O)R^0$ , - $C(O)CH_2C(O)R^0$ , - $CO_2R^0$ , - $C(O)R^0$ , - $C(O)N(R^0)_2$ , - $OC(O)R^0$ , - $OC(O)N(R^0)_2$ , - $S(O)_2R^0$ , - $SO_2N(R')_2$ , - $S(O)R^0$ ,  
 10 - $NR'SO_2N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$ , - $C(=S)N(R')_2$  -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>0</sup>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>0</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CON(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CON(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>(C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CO<sub>2</sub>R<sup>0</sup>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>(C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CO<sub>2</sub>R<sup>0</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>(C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CON(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>(C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CON(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub>, o -C(=NH)-N(R')<sub>2</sub>.
- 15 20. El compuesto de la reivindicación 18, donde  $R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y  
 cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ , - $OR^0$ , -O(haloalquilo), - $SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi, - $NO_2$ , -CN, -  
 20  $N(R')_2$ , - $NR'CO_2R^0$ , - $NR'C(O)R^0$ , - $NR'NR'C(O)R^0$ , - $N(R')C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'C(O)N(R')_2$ , - $NR'NR'CO_2R^0$ , - $C(O)C(O)R^0$ , - $C(O)CH_2C(O)R^0$ , - $CO_2R^0$ , - $C(O)R^0$ , - $C(O)N(R^0)_2$ , - $OC(O)R^0$ , - $OC(O)N(R^0)_2$ , - $S(O)_2R^0$ , - $SO_2N(R')_2$ , - $S(O)R^0$ , - $NR'SO_2N(R')_2$ , - $NR'SO_2R^0$ , - $C(=S)N(R')_2$  o -C(=NH)-N(R')<sub>2</sub>.
- 25 21. El compuesto de la reivindicación 19, donde:  
 $R^0$  es un ciclohexanilo, oxazolidinilo, oxazolidinonilo, tiazolidinilo, tetrahydrofuranilo, tetrahidropiranilo, tiazolidinilo, tetrahidrotienilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, dioxanilo, dioxolanilo, ditiolanilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo, S,S-dióxido de isotiazolidinilo, S,S-  
 30 dióxido de 1,2,5-tiadiazolidina, o piperidinilo opcionalmente sustituido.

22. El compuesto de la reivindicación 20, donde:

$R^9$  es un ciclohexanilo, oxazolidinilo, oxazolidinonilo, tiazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, tiazolidinilo, tetrahidrotienilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, dioxanilo, dioxolanilo, ditiolanilo, 5 pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo, S,S-dióxido de isotiazolidinilo, o piperidinilo opcionalmente sustituido.

23. El compuesto de la reivindicación 18, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y 10 siete con  $R^{14}$ ;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(haloalquilo)$ ,  $-SR^0$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ , 15  $OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ , o  $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

$n$  es un número entero de 1-4;

$R^1$  es un anillo fenilo sustituido en la posición *para* o *meta* por un grupo 20 carbocíclico o heterocíclico no aromático representado por  $V-R^9$ , y opcionalmente también está sustituido con 1-2 grupos seleccionados independientemente representados por  $R^Z$ ;

cada  $R^Z$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(haloalquilo)$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ , y 25  $OC(O)N(R^0)_2$ ;

$V$  es un enlace covalente o  $-O-$ ;

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $-R^0$ , 30  $OR^0$ ,  $-O(haloalquilo)$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-CO_2R^0$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-OC(O)R^0$ , y  $-OC(O)N(R^0)_2$ ;

cada R' es independientemente H o alquilo; y

cada R<sup>o</sup> es independientemente hidrógeno, haloalquilo o un grupo alquilo.

24. El compuesto de la reivindicación 23, donde:

- 5 R<sup>9</sup> es oxazolidinilo, tiazolidinilo, tetrahidrofuranilo, morfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo o piperidinilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo, -C(O)OR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -OC(O)R<sup>12</sup>, -R<sup>12</sup>C(O)OR<sup>12</sup>, -C(O)NR<sup>12</sup><sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>C(O)OR<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>COR<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>OR<sup>12</sup>, -S(O)OR<sup>12</sup>, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -CN, -NR<sup>12</sup>C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CO<sub>2</sub>H, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)NR<sup>o</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C(O)NR<sup>o</sup> o -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>;
- 10 n es un número entero de 1 a 4; y  
cada R<sup>12</sup> es independientemente -H, alquilo, haloalquilo o hidroxialquilo.

- 15 25. El compuesto de la reivindicación 24, donde:

cada R<sup>2</sup> se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo, -R<sup>o</sup>, -OR<sup>o</sup>, y -O(haloalquilo);

R<sup>3</sup> es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *para* o *meta* por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por R<sup>11</sup>; y

- 20 cada R<sup>11</sup> es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno, haloalquilo, -R<sup>o</sup>, -OR<sup>o</sup>, -N(R')<sub>2</sub>, -NR'SO<sub>2</sub>R<sup>o</sup> y -O(haloalquilo).

26. El compuesto de la reivindicación 25, donde:

- 25 R<sup>9</sup> es N-morfolinilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-morfolinilo N-sustituido, 3-morfolinilo N-sustituido, N-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo N-sustituido, 3-pirrolidinilo N-sustituido, N-piperazinilo, 2-piperazinilo, N-piperazinilo N'-sustituido, 2-piperazinilo N-sustituido, N-piperidinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 2-piperidinilo N-sustituido, 3-piperidinilo N-sustituido, 4-piperidinilo N-sustituido, cada uno opcionalmente sustituido en
- 30 cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo, -C(O)OR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -OC(O)R<sup>12</sup> o -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, y donde los

sustituyentes *N* son alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{NR}^0$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^0$  o  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ; y

*n* es un número entero de 1-4.

5

27. El compuesto de la reivindicación 26, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $\text{R}^{14}$ ;

10 cada  $\text{R}^{14}$  es independientemente halógeno,  $\text{R}^0$ ,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $\text{NHSO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{NHCOR}^0$ ,  $-\text{CN}$ ,  $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ , o  $-\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ;

*n* es un número entero de 1-4;

15  $\text{R}^1$  es un anillo fenilo sustituido en la posición *para* por un grupo carbocíclico o heterocíclico no aromático representado por  $\text{V-R}^9$ , y opcionalmente está también sustituido en la posición *meta* por  $\text{R}^2$ ;

$\text{R}^2$  es cloruro, fluoruro, bromuro,  $-\text{OR}^0$ , o  $-\text{R}^0$ ;

$\text{R}^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *para* por  $\text{R}^{11}$ ;

$\text{R}^{11}$  es cloruro, fluoruro, bromuro,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$  o  $\text{R}^0$ ;

20  $\text{R}'$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo  $\text{C}_{1-3}$ ; y

$\text{R}^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo, o un grupo alquilo  $\text{C}_{1-3}$ .

28. El compuesto de la reivindicación 27, donde:

25  $\text{R}^9$  es *N*-piperidinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 2-piperidinilo *N*-sustituido, 3-piperidinilo *N*-sustituido, 4-piperidinilo *N*-sustituido, *N*-piperazinilo, 2-piperazinilo, *N*-piperazinilo *N'*-sustituido, o 2-piperazinilo *N*-sustituido, y está opcionalmente sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con cloruro, fluoruro, bromuro, metilo, etilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$  o  $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ , y

30 donde los sustituyentes *N* son metilo, etilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{NR}^0$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CO}_2\text{H}$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^0$ , o  $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ;

N es un número entero de 1-4; y

cada  $R^{12}$  es independientemente -H, metilo o etilo.

29. El compuesto de la reivindicación 3, donde:

- 5  $R^1$  es un grupo fenilo condensado a un anillo heterocíclico no aromático monocíclico opcionalmente sustituido representado por  $R^{10}$ , o un anillo aromático monocíclico representado por  $R^{13}$ .

30. El compuesto de la reivindicación 29, donde:

- 10 El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $R^{14}$ ;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

n es un número entero de 1-4;

- 20  $R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

$R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $-R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ ,  $(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ , o  $-C(=NH)-N(R')_2$ .

30

31. El compuesto de la reivindicación 29, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $R^{14}$ ;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno, haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

10  $n$  es un número entero de 1-4;

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

$R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $-R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ ,  $-SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ .

20 32. El compuesto de la reivindicación 31, donde:

$R^{10}$  es oxazolidinilo, oxazolidinonilo, dioxolanilo, tiazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotiopiranilo, tetrahidrotienilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, dioxanilo, ditiolanilo, pirrolidinilo, piperazinilo, piperidinilo, piperidinilo, S,S-dióxido de tetrahidrotienilo, S,S-dióxido de tiomorfolinilo, o S,S-dióxido de tetrahidrotiopiranilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido; y

$R^{13}$  es pirazolilo, triazolilo, imidazolilo, furanilo, pirrolilo, tienilo, ciclopentadienilo y S,S-dióxido de tienilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido.

30 33. El compuesto de la reivindicación 32, donde:

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos

seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ;

cada  $R^{11}$  es un sustituyente seleccionado independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $-R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(\text{haloalquilo})$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-NR'SO_2R^0$ , y  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,

5 cada  $R'$  es independientemente H o alquilo; y

cada  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo o un grupo alquilo.

34. el compuesto de la reivindicación 33, donde:

$R^{10}$  es tetrahidrofuranilo, tetrahidropirranilo, morfolinilo, imidazolidinilo,  
10 imidazolidinonilo, pirrolidinilo, piperazinilo o piperidinilo cada uno de los cuales  
está opcionalmente sustituido en cualquier átomo de carbono del anillo  
sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-R^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)_2COR^{12}$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2OR^{12}$ ,  $-S(O)OR^{12}$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , o  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , y cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido  
15 en cualquier átomo de nitrógeno del anillo sustituible con alquilo, haloalquilo,  
20 hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-R^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ;

$R^{13}$  es triazolilo, imidazolilo, furanilo, pirrolilo, tienilo, cada uno de los cuales  
está opcionalmente sustituido en cualquier átomo de carbono del anillo  
sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)_2COR^{12}$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2OR^{12}$ ,  $-S(O)OR^{12}$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , o  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , y cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido  
25 en cualquier átomo de nitrógeno del anillo sustituible con alquilo, haloalquilo,  
30 en cualquier átomo de nitrógeno del anillo sustituible con alquilo, haloalquilo,

hidroxialquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{R}^{12}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{12}$ ,  $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ , y

cada  $\text{R}^{12}$  es independientemente H, alquilo, haloalquilo o hidroxialquilo.

5 35. El compuesto de la reivindicación 34, donde:

$\text{R}^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *para* o *meta* por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $\text{R}^{11}$ ;

y

10 cada  $\text{R}^{11}$  es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno, haloalquilo,  $-\text{R}^0$ ,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$  y  $-\text{O}(\text{haloalquilo})$ .

36. El compuesto de la reivindicación 35, donde:

15  $\text{R}^{10}$  es piperidinilo, piperazinilo, dioxolanilo, tetrahidrofuranilo, o morfolinilo, cada uno opcionalmente sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{12}$  o  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ , cada uno opcionalmente sustituido en cualquier átomo de nitrógeno sustituible con alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$  o  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ;

20  $\text{R}^{13}$  es triazolilo, imidazolilo o pirrolilo cada uno opcionalmente sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{12}$  o  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$  y cada uno opcionalmente sustituido en cualquier átomo de nitrógeno sustituible con alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo,  $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{R}^{12}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{12}$ ,  $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ .

25

37. El compuesto de la reivindicación 36, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $\text{R}^{14}$ ;

30 cada  $\text{R}^{14}$  es independientemente halógeno,  $\text{R}^0$ ,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $\text{NHSO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{NHCOR}^0$ ,  $\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^0_2$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ , o  $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ;

$n$  es un número entero de 1-4;

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *para* por  $R^{11}$ ;

$R^{11}$  es cloruro, fluoruro, bromuro,  $-OR^0$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$  o  $-R^0$ ;

$R'$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo  $C_{1-3}$ ; y

- 5  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo, o un grupo alquilo  $C_{1-3}$ .

38. El compuesto de la reivindicación 37, donde:

$R^{10}$  es piperidinilo, piperazinilo, o morfolinilo y está opcionalmente *N*-sustituido con metilo, etilo, isopropilo,  $C(O)OR^{12}$ ,  $C(O)NH_2$  o  $-C(O)R^{12}$ ;

- 10  $R^{13}$  es triazolilo y está opcionalmente *N*-sustituido con metilo, etilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $C(O)NH_2$  o  $-C(O)R^{12}$ ; y  
cada  $R^{12}$  es independientemente -H, metilo o etilo.

39. El compuesto de la reivindicación 29, donde:

- 15  $R^{10}$  es tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, morfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, pirrolidinilo, piperazinilo o piperidinilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido en cualquiera de uno o más átomos de carbono del anillo con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-R^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)_2COR^{12}$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2OR^{12}$ ,  $-S(O)OR^{12}$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , o  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , y cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido  
25 en cualquier átomo de nitrógeno del anillo sustituible con alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-R^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ;

cada  $R^{12}$  es independientemente H, alquilo, haloalquilo, o hidroxialquilo;

$R^{13}$  es pirazolilo, triazolilo, imidazolilo o pirrolilo, cada uno de los cuales *N*-sustituido con  $T^2-R^{Y1}$  y opcionalmente también sustituido en cualquiera de uno

- 30 o más átomo de carbono del anillo con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-$

$\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{COR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{SR}^{12}$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_{1-4}\text{CO}_2\text{R}^{12}$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}\text{CO}_2\text{R}^{12}$ ,  $(\text{CH}_2)_{1-4}\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-(\text{CH}_2)_{0-3}(\text{C}(\text{CH}_3)_2)\text{CO}_2\text{R}^{12}$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_{0-3}(\text{C}(\text{CH}_3)_2)\text{CO}_2\text{R}^{12}$ ,  $-(\text{CH}_2)_{0-3}(\text{C}(\text{CH}_3)_2)\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ , o  $-\text{O}(\text{CH}_2)_{0-3}(\text{C}(\text{CH}_3)_2)\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ ;

$\text{T}^2$  es un alquileo  $\text{C}_{1-6}$  de cadena lineal opcionalmente sustituido en cualquiera de uno o más átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, grupo heterocíclico no aromático espiro opcionalmente *N*-sustituido que contiene nitrógeno, grupo heterocíclico no aromático espiro que contiene O, amina, alquilamina, dialquilamina o hidroxilo;

$\text{R}^{Y1}$  es  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ ,  $-\text{N}(\text{R}^5)_2$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido representado por  $\text{R}^7$  o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido representado por  $\text{R}^8$ ;

$\text{R}^7$  es un piperidinonilo, oxazolidinilo, oxazolidinonilo, tiazolidinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, tiazolidinilo, tetrahidrotiofeno, morfolinilo, tiomorfolinilo, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, dioxanilo, dioxolanilo, ditiolanilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo o piperidinilo opcionalmente sustituido; y  $\text{R}^8$  es un furanilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, piridinilo, pirimidilo, tiazolilo, tienilo o imidazolilo opcionalmente sustituido.

40. El compuesto de la reivindicación 39, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $\text{R}^{14}$ ;

cada  $\text{R}^{14}$  es independientemente halógeno, haloalquilo,  $\text{R}^0$ ,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{O}(\text{haloalquilo})$ ,  $-\text{SR}^0$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{NR}'\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{N}(\text{R}')\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{NR}'\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^0$ ,  $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^0$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$ , -

$C(=S)N(R')_2$  y  $-C(=NH)-N(R')_2$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nOH$ ,  $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ , o  $O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ ;

n es un número entero de 1-4;

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos

5 seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y

cada  $R^{11}$  se selecciona independientemente entre halógeno, haloalquilo,  $-R^0$ , -

$OR^0$ ,  $-O(haloalquilo)$ ,  $-SR^0$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-NO_2$ ,  $-CN$ , -

$N(R')_2$ ,  $-NR'CO_2R^0$ ,  $-NR'C(O)R^0$ ,  $-NR'NR'C(O)R^0$ ,  $-N(R')C(O)N(R')_2$ , -

$NR'NR'C(O)N(R')_2$ ,  $-NR'NR'CO_2R^0$ ,  $-C(O)C(O)R^0$ ,  $-C(O)CH_2C(O)R^0$ ,  $-CO_2R^0$ , -

10  $C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $-OC(O)N(R^0)_2$ ,  $-S(O)_2R^0$ ,  $-SO_2N(R')_2$ ,  $-S(O)R^0$ ,

$-NR'SO_2N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(=S)N(R')_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ , -

$(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ ,  $(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ , o

$-C(=NH)-N(R')_2$ .

15

41. El compuesto de la reivindicación 40, donde:

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ;

cada  $R^{11}$  es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno,

20 haloalquilo,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-O(haloalquilo)$ , 3,4-metileno-dioxi, 3,4-etileno-dioxi,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-N(R')_2$ ,  $-NR'SO_2R^0$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ , y  $-OC(O)N(R^0)_2$ ;

cada  $R'$  es independientemente H o alquilo; y

cada  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo o un grupo alquilo.

25 42. El compuesto de la reivindicación 41, donde:

$R^{Y1}$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2N(R^5)_2$ , -

$NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OH$ , un grupo heterocíclico no aromático

opcionalmente sustituido representado por  $R^7$  o un grupo heteroarilo

opcionalmente sustituido representado por  $R^8$ ;

30 cada  $R^5$  es independientemente H o alquilo, o  $N(R^5)_2$  es un grupo heterocíclico

no aromático que contiene nitrógeno;

$R^7$  es piperidinonilo, morfolinilo, imidazolidinonilo, pirrolidinilo, pirrolidinonilo, piperazinilo o piperidinilo;

$R^8$  es tetrazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, piridinilo o imidazolilo;

- 5  $T^2$  es un alquileo  $C_{1-5}$  de cadena lineal opcionalmente sustituido en el átomo de carbono adyacente a  $R^Y$  con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, espiro cicloalquilo, grupo heterocíclico no aromático espiro opcionalmente *N*-sustituido que contiene nitrógeno, amina, dialquilamina o hidroxilo;
- 10 el grupo representado por  $R^{10}$  es morfolinilo, tiomorfolino, imidazolidinilo, imidazolidinonilo, pirrolidinilo, piperazinilo o piperidinilo cada uno de los cuales está *N*-sustituido con  $T^2-R^{Y1}$  y opcionalmente también sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)_2COR^{12}$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2OR^{12}$ ,  $-S(O)OR^{12}$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , o  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ ; y
- 15 el grupo representado por  $R^{13}$  es triazolilo, imidazolilo o pirrolilo cada uno de los cuales está *N*-sustituido con  $T^2-R^{Y1}$  y opcionalmente también sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)_2COR^{12}$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2OR^{12}$ ,  $-S(O)OR^{12}$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ ,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ ,  $(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ ,  $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ , o  $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ .
- 20
- 25
- 30 43. El compuesto de la reivindicación 42, donde:

$R^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *meta* o *para* por uno o más grupos seleccionados independientemente representados por  $R^{11}$ ; y cada  $R^{11}$  es independientemente un sustituyente seleccionado entre halógeno, haloalquilo,  $-R^o$ ,  $-OR^o$ ,  $-N(R^o)_2$ ,  $-NR'SO_2R^o$  y  $-O(haloalquilo)$ .

5

44. el compuesto de la reivindicación 43, donde

$R^{Y1}$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OH$ , *N*-morfolinilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-morfolinilo *N*-sustituido, 3-morfolinilo *N*-sustituido, *N*-imidazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 5-imidazolidinilo, 2-imidazolidinilo *N*-sustituido, 10 *N*-imidazolidinilo *N'*-sustituido, 4-imidazolidinilo *N*-sustituido, 5-imidazolidinilo *N*-sustituido, *N*-imidazolidinonilo, 4-imidazolidinonilo, 5-imidazolidinonilo, 4-imidazolidinonilo *N*-sustituido, 5-imidazolidinonilo *N*-sustituido, *N*-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 2-pirrolidinilo *N*-sustituido, 3-pirrolidinilo *N*-sustituido, *N*-pirrolidin-2-onilo, 3-pirrolidin-2-onilo, 4-pirrolidin-2-onilo, 5-pirrolidin-2-onilo, 3-pirrolidin-2-onilo *N*-sustituido, 4-pirrolidin-2-onilo *N*-sustituido, 5-pirrolidin-2-onilo 15 *N*-sustituido, *N*-pirrolidin-3-onilo, 2-pirrolidin-3-onilo, 4-pirrolidin-3-onilo, 5-pirrolidin-3-onilo, 2-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, 4-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, 5-pirrolidin-3-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidinilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 2-piperidinilo *N*-sustituido, 3-piperidinilo *N*-sustituido, 20 4-piperidinilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-2-onilo, 3-piperidin-2-onilo, 4-piperidin-2-onilo, 5-piperidin-2-onilo, 6-piperidin-2-onilo, 3-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 4-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-2-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-3-onilo, 2-piperidin-3-onilo, 4-piperidin-3-onilo, 5-piperidin-3-onilo, 6-piperidin-3-onilo, 2-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, 4-piperidin- 25 3-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-3-onilo *N*-sustituido, *N*-piperidin-4-onilo, 2-piperidin-4-onilo, 3-piperidin-4-onilo, 5-piperidin-4-onilo, 6-piperidin-4-onilo, 2-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 3-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 5-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, 6-piperidin-4-onilo *N*-sustituido, *N*-piperazinilo, 2-piperazinilo, *N*-piperazinilo *N'*-sustituido, 2-piperazinilo *N*-sustituido, furanilo, *N*-tetrazolilo, 5-tetrazolilo, 5-tetrazolilo *N*- 30 sustituido, 4-(1,2,3)oxadiazolilo, 5-(1,2,3)oxadiazolilo, 3-(1,2,4)oxadiazolilo, 5-

(1,2,4)oxadiazolilo, 3-(1,2,5)oxadiazolilo, 4-(1,2,5)oxadiazolilo, 2-(1,3,4)oxadiazolilo, 5-(1,3,4)oxadiazolilo, *N*-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 2-pirrolilo *N*-sustituido, 3-pirrolilo *N*-sustituido, *N*-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 3-pirazolilo *N*-sustituido, 4-pirazolilo *N*-sustituido, 5-pirazolilo *N*-sustituido, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, *N*-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo; 2-imidazolilo *N*-sustituido, 4-imidazolilo *N*-sustituido o 5-imidazolilo *N*-sustituido;

$T^2$  es un alquileo  $C_{1-3}$  de cadena lineal sustituido con flúor, metilo, gem dimetilo, gem difluoro fluorometilo, espiro ciclopropilo, espiro ciclobutilo, espiro azetidinio opcionalmente *N*-sustituido, espiro aziridinio opcionalmente *N*-sustituido, espiro pirrolidinilo opcionalmente *N*-sustituido, espiro piperidinilo opcionalmente *N*-sustituido, amina, metilamina, dimetilamina o hidroxilo, el grupo representado por  $R^{10}$  es morfolinilo, pirrolidinilo, piperazinilo o piperidinilo cada uno de los cuales está *N*-sustituido con  $T^2-R^{Y1}$  y opcionalmente también sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$ , y

el grupo que representa  $R^{13}$  es imidazolilo o pirrolilo cada uno de los cuales está *N*-sustituido con  $T^2-R^{Y1}$  y opcionalmente también sustituido en cualquier átomo de carbono sustituible con alquilo, haluro, haloalquilo, hidroxialquilo,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-OC(O)R^{12}$  o  $-C(O)N(R^{12})_2$  y cada uno está opcionalmente sustituido en cualquier átomo de nitrógeno sustituible con alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo,  $C(O)OR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-R^{12}C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ .

25

45. El compuesto de la reivindicación 44, donde:

El anillo A es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $R^{14}$ ;

cada  $R^{14}$  es independientemente halógeno,  $R^0$ ,  $-OR^0$ ,  $-CO_2R^0$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-CN$ ,  $-C(O)N(R^0)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $O(CH_2)_nCO_2R^0$ ,  $NHSO_2R^0$ ,  $-NHCOR^0$ ,

30

$\text{NHC(O)N(R}^0\text{)}_2$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{C(O)N(R}^0\text{)}_2$ , o  
 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C(O)N(R}^0\text{)}_2$ ;

$n$  es un número entero de 1-4;

$\text{R}^3$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en la posición *para* por  $\text{R}^{11}$ ;

5  $\text{R}^{11}$  es cloruro, fluoruro, bromuro,  $-\text{OR}^0$ ,  $-\text{N(R}^1\text{)}_2$ ,  $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$  o  $\text{R}^0$ ;

$\text{R}'$  es independientemente hidrógeno o un grupo alquilo  $\text{C}_{1-3}$ ; y

$\text{R}^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo, o un grupo alquilo  $\text{C}_{1-3}$

46. El compuesto de la reivindicación 45, donde:

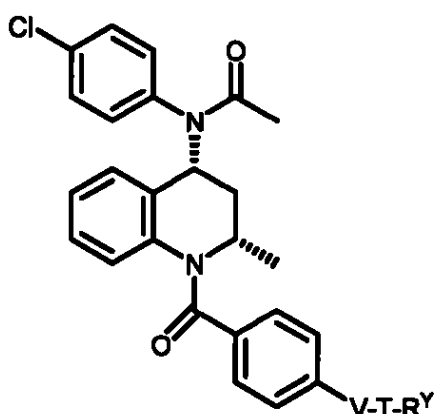
10  $\text{R}^{Y1}$  es  $-\text{C(O)OR}^5$ ,  $-\text{C(O)N(R}^5\text{)}_2$ ,  $-\text{OH}$ , *N*-tetrazolilo, 5-tetrazolilo, 5-tetrazolilo *N*-sustituido, *N*-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo; 2-imidazolilo *N*-sustituido, 4-imidazolilo *N*-sustituido o 5-imidazolilo *N*-sustituido;

el grupo representado por  $\text{R}^{10}$  es piperidinilo, piperazinilo, o morfolino, *N*-sustituido con  $\text{T}^2\text{-R}^{Y1}$  y sustituido opcionalmente también en el carbono alfa al

15 átomo de nitrógeno con metilo o gem dimetilo; y

el grupo representado por  $\text{R}^{13}$  es tiazolilo *N*-sustituido con  $\text{T}^2\text{-R}^{Y1}$  y opcionalmente sustituido también en el carbono alfa al átomo de nitrógeno con metilo.

20 47. Un compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

$V$  es un enlace covalente o  $-\text{O}-$ .

$T$  es un alquilenos  $\text{C}_{1-10}$  no sustituido de cadena lineal,

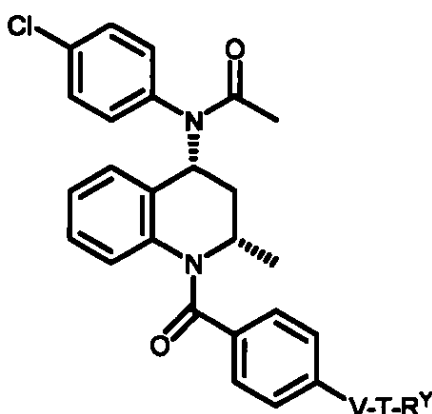
$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-OC(O)R^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2R^5$ ,  $-S(O)_2COR^5$ ,  $-S(O)_2N(R^5)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2R^5$ ,  $S(O)_2OR^5$ ,  $-S(O)OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-CN$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OC(O)N(R^5)_2$ ,  $-N(R^5)_2$ ,  $-OR^5$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido o

5 un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido,

cada  $R^5$  es independientemente  $-H$ , alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo, carboxialquilo,  $-C(O)OCH_2C_6H_5$ ,  $S(O)_2CH_3$ ,  $-C(O)OH$ ,  $-C(O)OMe$ ,  $-C(O)OEt$ ,  $C(O)NH_2$ , bencilo, pirrolidinilo, morfolino, o  $-N(R^5)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático que contiene nitrógeno;

10

48. Un compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

V es un enlace covalente o  $-O-$ ;

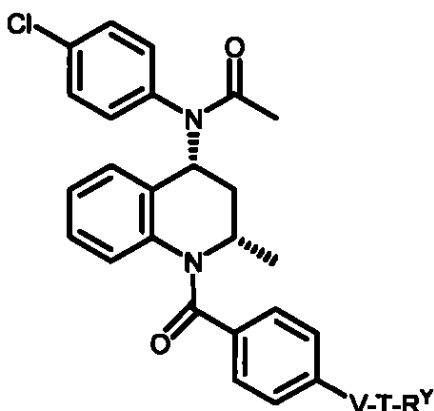
15 T es un alquileno  $C_{1-10}$  de cadena lineal sustituido con alquilo, gem dialquilo, espiro cicloalquilo, o un grupo heterocíclico no aromático espiro *N*-sustituido que contiene nitrógeno;

$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-OC(O)R^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2R^5$ ,  $-S(O)_2COR^5$ ,  $-S(O)_2N(R^5)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2R^5$ ,  $S(O)_2OR^5$ ,  $-S(O)OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-CN$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OC(O)N(R^5)_2$ ,  $-N(R^5)_2$ ,  $-OR^5$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido o

20 un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido; y  
cada  $R^5$  es independientemente  $-H$ , alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo, carboxialquilo,  $-C(O)OCH_2C_6H_5$ ,  $S(O)_2CH_3$ ,  $-C(O)OH$ ,  $-C(O)OMe$ ,  $-C(O)OEt$ ,

$C(O)NH_2$ , bencilo, pirrolidinilo, morfolinilo o  $-N(R^5)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido que contiene nitrógeno.

49. Un compuesto representado por la siguiente fórmula estructural:



5

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde:

V es  $-O-$ ;

T es un alquileo  $C_{1-10}$  de cadena lineal opcionalmente sustituido en cualquiera de uno o más átomos de carbono sustituibles con haluro, alquilo, gem dialquilo, gem dihalo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, espiro cicloalquilo, grupo heterocíclico no aromático espiro opcionalmente *N*-sustituido que contiene nitrógeno, amina, alquilamina, dialquilamina o hidroxilo;

$R^Y$  es  $-C(O)OR^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-OC(O)R^5$ ,  $-C(O)N(R^5)_2$ ,  $-NR^5C(O)R^5$ ,  $-NR^5C(O)OR^5$ ,  $-S(O)_2R^5$ ,  $-S(O)_2COR^5$ ,  $-S(O)_2N(R^5)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2$ ,  $-NR^5S(O)_2R^5$ ,  $S(O)_2OR^5$ ,  $S(O)OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ ,  $-CN$ ,  $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ ,  $-OC(O)N(R^5)_2$ ,  $-N(R^5)_2$ ,  $-OR^5$ , un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido o un grupo heteroarilo opcionalmente sustituido; y

cada  $R^5$  es independientemente  $-H$ , alquilo, haloalquilo, hidroxialquilo, carboxialquilo,  $-C(O)OCH_2C_6H_5$ ,  $S(O)_2CH_3$ ,  $-C(O)OH$ ,  $-C(O)OMe$ ,  $-C(O)OEt$ ,  $C(O)NH_2$ , bencilo, pirrolidinilo, morfolinilo o  $-N(R^5)_2$  es un grupo heterocíclico no aromático opcionalmente sustituido que contiene nitrógeno.

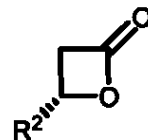
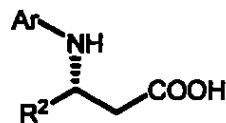
50. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo o diluyente aceptable y un compuesto de la reivindicación 1, 2, 47, 48, o 49.

51. Un método para tratar una enfermedad, trastorno o síntoma inflamatorio en un sujeto en necesidad de tratamiento, que comprende la etapa de administrar al sujeto una cantidad eficaz de un compuesto representado por el  
5 compuesto de la reivindicación 1, 2, 47, 48, o 49.

52. El método de la reivindicación 51 donde la enfermedad, trastorno o síntoma inflamatorio es rinitis alérgica, artritis reumatoide, enfermedad pulmonar obstructiva crónica, dermatitis atópica, o asma alérgica.  
10

53. El método de la reivindicación 51 donde la enfermedad, trastorno o síntoma inflamatorio es rinitis alérgica o asma alérgica

54. Un método para preparar un compuesto representado por la siguiente  
15 fórmula estructural:



que comprende la etapa de hacer reaccionar Ar-NH<sub>2</sub> con  
donde Ar es un grupo aromático monocíclico opcionalmente sustituido y R<sup>2</sup> es alquilo C1-C3.

55. El método de la reivindicación 54 donde Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido y R<sup>2</sup> es metilo o etilo.  
20

56. El método de la reivindicación 55 donde Ar es un grupo fenilo opcionalmente *para* o *meta* sustituido con R<sup>14</sup>;  
25

cada  $R^{14}$  es independientemente halo, ciano,  $R^0$ ,  $-OR^{30}$ ,  $-CO_2R^{31}$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^x)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^{31}$ ,  $O(CH_2)_nCO_2R^{31}$ ,  $NHSO_2R^0$ ,  $NHC(O)NR^x_2$ ,  $(CH_2)_nOR^{30}$ ,  $O(CH_2)_nOR^{30}$ ,  $(CH_2)_nC(O)NR^0_2$ ,  $O(CH_2)_nC(O)NR^x_2$ ;  $n$  es un número entero de 1-4;

- 5  $R^0$  es independientemente hidrógeno, haloalquilo C1-C3 o un grupo alquilo C1-C3;

un  $R^x$  es -H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y el otro es un grupo protector de amina;

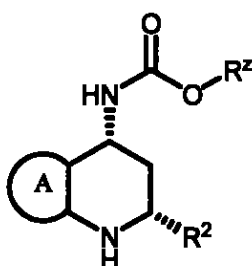
$R^{30}$  es un grupo protector de alcohol; y

$R^{31}$  es un grupo protector de ácido carboxílico.

10

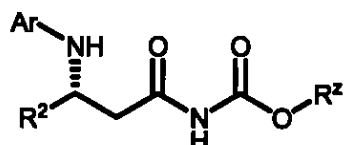
57. El método de la reivindicación 56 donde Ar es un grupo fenilo.

58. Un método para preparar un compuesto producto representado por la siguiente fórmula estructural:



15

a partir de un compuesto de partida representado por la siguiente fórmula estructural:



20

comprendiendo dicho método la etapa de reducir el carbonilo de la amida del compuesto de partida para formar un intermedio y después ciclar el intermedio para formar el compuesto producto, donde  $-C(O)OR^Z$  es un grupo protector de amida.

25

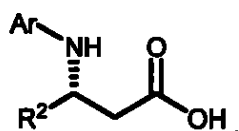
59. El método de la reivindicación 58 donde  $R^Z$  es un grupo alquilo sustituido o no sustituido, un grupo alilo o un grupo aromático.

60. El método de la reivindicación 59 donde el carbonilo de la amida del compuesto de partida se reduce haciendo reaccionar el compuesto de partida con borohidruro sódico y un ácido de Lewis y el intermedio se cicla en presencia de ácido.

61. El método de la reivindicación 60 donde Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido y R<sup>2</sup> es metilo o etilo.

62. El método de la reivindicación 60 donde R<sup>2</sup> es bencilo, metilo, etilo, alilo, 2,2,2-triclorometilo, 2,2,2-tricloro-*terc*-butilo, *terc*-butilo o fluorometilo.

63. El método de la reivindicación 58 donde el compuesto de partida se prepara amidando un aminoácido con H<sub>2</sub>NC(O)OR<sup>2</sup>, donde dicho aminoácido está representado por la siguiente fórmula estructural:

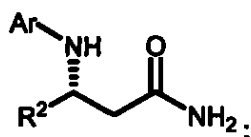


64. El método de la reivindicación 63 donde dicha amidación se realiza haciendo reaccionar el aminoácido con un reactivo de activación de ácido carboxílico para formar un intermedio activado y después haciendo reaccionar el intermedio activado con H<sub>2</sub>NC(O)OR<sup>2</sup>.

65. El método de la reivindicación 64 donde el agente de activación de ácido carboxílico es un carbonildiimidazol.

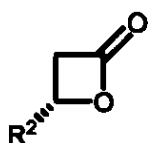
66. El método de la reivindicación 63 donde dicha amidación se realiza haciendo reaccionar el aminoácido con un reactivo de activación de ácido carboxílico para formar un intermedio activado y después haciendo reaccionar el intermedio activado con NH<sub>3</sub> o un equivalente funcional del mismo para

formar un intermedio carboxamida representado por la siguiente fórmula estructural:



5 haciendo reaccionar el intermedio carboxamida con  $X-C(O)OR^2$ , donde X es un grupo saliente.

67. El método de la reivindicación 63 donde el aminoácido se prepara haciendo reaccionar  $Ar-NH_2$  con



10

68. El método de la reivindicación 67 donde Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido y  $R^2$  es metilo o etilo.

69. El método de la reivindicación 68 donde Ar es un grupo fenilo opcionalmente sustituido en las posiciones seis y siete con  $R^{14}$ ;

15 cada  $R^{14}$  es independientemente halo, ciano,  $R^0$ ,  $-OR^{30}$ ,  $-CO_2R^{31}$ ,  $-C(O)R^0$ ,  $-C(O)N(R^x)_2$ ,  $-OC(O)R^0$ ,  $(CH_2)_nCO_2R^{31}$ ,  $O(CH_2)_nCO_2R^{31}$ ,  $NHSO_2R^0$ ,  $NHC(O)NR^x_2$ ,  $(CH_2)_nOR^{30}$ ,  $O(CH_2)_nOR^{30}$ ,  $(CH_2)_nC(O)N(R^x)_2$ ,  $O(CH_2)_nC(O)N(R^x)_2$ ;

20 n es un número entero de 1-4;

$R^0$  es independientemente hidrógeno, un grupo haloalquilo  $C_{1-3}$  o un grupo alquilo  $C_{1-3}$ ;

un  $R^x$  es -H o alquilo  $C_1-C_3$  y el otro es un grupo protector de amina;

$R^{30}$  es un grupo protector de alcohol; y

25  $R^{31}$  es un grupo protector de ácido carboxílico.

70. El método de la reivindicación 69 donde Ar es un grupo fenilo.

86