

Industria y Comercio AS: 102.612
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-125963-00003-0000

Fecha: 2008-02-29 16:56:14 Dep. 2020 NUECREACION
FOLIO 11 FASENACIONAL
Act. 329 INFORMACION Folios: 42

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE

Nombre: **BRISTOL - MYERS SQUIBB COMPANY**

Dirección: P.O. Box 4000, Route 206 and Province
Line Road, Princeton, NJ 08543-4000, Estados
Unidos de América

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos
Lugar de Constitución: Estados Unidos

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **JUAN PABLO CADENA SARMIENTO**

Dirección: Cra. 7 No. 71-21, Torre B, Piso 4

Teléfono: 744-2200

Fax: 742-2200

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 80 410.337 TP 57492

4 Número de expediente:

06 125963

5 Descripción de la corrección o modificación solicitada _____

Estamos presentando nuevo capítulo reivindicatorio, donde se han realizado algunas modificaciones, las cuales precisan el objetivo de la solicitud y no afectan en ningún sentido el alcance de la invención.

6 Comprobante de pago No. 07-89,273 y 08-529

Fecha 29-02-2008

7 Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$103.000
- ☐ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.
- ☒ Nuevo capítulo Reivindicatorio.

8

NOMBRE: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO FIRMA:

881²
~~97~~
83

1997, 1998, 1999, 2000, 2001, 2002, 2003, 2004, 2005, 2006, 2007, 2008, 2009, 2010, 2011, 2012, 2013, 2014, 2015, 2016, 2017, 2018, 2019, 2020, 2021, 2022, 2023, 2024, 2025, 2026, 2027, 2028, 2029, 2030, 2031, 2032, 2033, 2034, 2035, 2036, 2037, 2038, 2039, 2040, 2041, 2042, 2043, 2044, 2045, 2046, 2047, 2048, 2049, 2050, 2051, 2052, 2053, 2054, 2055, 2056, 2057, 2058, 2059, 2060, 2061, 2062, 2063, 2064, 2065, 2066, 2067, 2068, 2069, 2070, 2071, 2072, 2073, 2074, 2075, 2076, 2077, 2078, 2079, 2080, 2081, 2082, 2083, 2084, 2085, 2086, 2087, 2088, 2089, 2090, 2091, 2092, 2093, 2094, 2095, 2096, 2097, 2098, 2099, 2100, 2101, 2102, 2103, 2104, 2105, 2106, 2107, 2108, 2109, 2110, 2111, 2112, 2113, 2114, 2115, 2116, 2117, 2118, 2119, 2120, 2121, 2122, 2123, 2124, 2125, 2126, 2127, 2128, 2129, 2130, 2131, 2132, 2133, 2134, 2135, 2136, 2137, 2138, 2139, 2140, 2141, 2142, 2143, 2144, 2145, 2146, 2147, 2148, 2149, 2150, 2151, 2152, 2153, 2154, 2155, 2156, 2157, 2158, 2159, 2160, 2161, 2162, 2163, 2164, 2165, 2166, 2167, 2168, 2169, 2170, 2171, 2172, 2173, 2174, 2175, 2176, 2177, 2178, 2179, 2180, 2181, 2182, 2183, 2184, 2185, 2186, 2187, 2188, 2189, 2190, 2191, 2192, 2193, 2194, 2195, 2196, 2197, 2198, 2199, 2200, 2201, 2202, 2203, 2204, 2205, 2206, 2207, 2208, 2209, 2210, 2211, 2212, 2213, 2214, 2215, 2216, 2217, 2218, 2219, 2220, 2221, 2222, 2223, 2224, 2225, 2226, 2227, 2228, 2229, 2230, 2231, 2232, 2233, 2234, 2235, 2236, 2237, 2238, 2239, 2240, 2241, 2242, 2243, 2244, 2245, 2246, 2247, 2248, 2249, 2250, 2251, 2252, 2253, 2254, 2255, 2256, 2257, 2258, 2259, 2260, 2261, 2262, 2263, 2264, 2265, 2266, 2267, 2268, 2269, 2270, 2271, 2272, 2273, 2274, 2275, 2276, 2277, 2278, 2279, 2280, 2281, 2282, 2283, 2284, 2285, 2286, 2287, 2288, 2289, 2290, 2291, 2292, 2293, 2294, 2295, 2296, 2297, 2298, 2299, 2300, 2301, 2302, 2303, 2304, 2305, 2306, 2307, 2308, 2309, 2310, 2311, 2312, 2313, 2314, 2315, 2316, 2317, 2318, 2319, 2320, 2321, 2322, 2323, 2324, 2325, 2326, 2327, 2328, 2329, 2330, 2331, 2332, 2333, 2334, 2335, 2336, 2337, 2338, 2339, 2340, 2341, 2342, 2343, 2344, 2345, 2346, 2347, 2348, 2349, 2350, 2351, 2352, 2353, 2354, 2355, 2356, 2357, 2358, 2359, 2360, 2361, 2362, 2363, 2364, 2365, 2366, 2367, 2368, 2369, 2370, 2371, 2372, 2373, 2374, 2375, 2376, 2377, 2378, 2379, 2380, 2381, 2382, 2383, 2384, 2385, 2386, 2387, 2388, 2389, 2390, 2391, 2392, 2393, 2394, 2395, 2396, 2397, 2398, 2399, 2400, 2401, 2402, 2403, 2404, 2405, 2406, 2407, 2408, 2409, 2410, 2411, 2412, 2413, 2414, 2415, 2416, 2417, 2418, 2419, 2420, 2421, 2422, 2423, 2424, 2425, 2426, 2427, 2428, 2429, 2430, 2431, 2432, 2433, 2434, 2435, 2436, 2437, 2438, 2439, 2440, 2441, 2442, 2443, 2444, 2445, 2446, 2447, 2448, 2449, 2450, 2451, 2452, 2453, 2454, 2455, 2456, 2457, 2458, 2459, 2460, 2461, 2462, 2463, 2464, 2465, 2466, 2467, 2468, 2469, 2470, 2471, 2472, 2473, 2474, 2475, 2476, 2477, 2478, 2479, 2480, 2481, 2482, 2483, 2484, 2485, 2486, 2487, 2488, 2489, 2490, 2491, 2492, 2493, 2494, 2495, 2496, 2497, 2498, 2499, 2500, 2501, 2502, 2503, 2504, 2505, 2506, 2507, 2508, 2509, 2510, 2511, 2512, 2513, 2514, 2515, 2516, 2517, 2518, 2519, 2520, 2521, 2522, 2523, 2524, 2525, 2526, 2527, 2528, 2529, 2530, 2531, 2532, 2533, 2534, 2535, 2536, 2537, 2538, 2539, 2540, 2541, 2542, 2543, 2544, 2545, 2546, 2547, 2548, 2549, 2550, 2551, 2552, 2553, 2554, 2555, 2556, 2557, 2558, 2559, 2560, 2561, 2562, 2563, 2564, 2565, 2566, 2567, 2568, 2569, 2570, 2571, 2572, 2573, 2574, 2575, 2576, 2577, 2578, 2579, 2580, 2581, 2582, 2583, 2584, 2585, 2586, 2587, 2588, 2589, 2590, 2591, 2592, 2593, 2594, 2595, 2596, 2597, 2598, 2599, 2600, 2601, 2602, 2603, 2604, 2605, 2606, 2607, 2608, 2609, 2610, 2611, 2612, 2613, 2614, 2615, 2616, 2617, 2618, 2619, 2620, 2621, 2622, 2623, 2624, 2625, 2626, 2627, 2628, 2629, 2630, 2631, 2632, 2633, 2634, 2635, 2636, 2637, 2638, 2639, 2640, 2641, 2642, 2643, 2644, 2645, 2646, 2647, 2648, 2649, 2650, 2651, 2652, 2653, 2654, 2655, 2656, 2657, 2658, 2659, 2660, 2661, 2662, 2663, 2664, 2665, 2666, 2667, 2668, 2669, 2670, 2671, 2672, 2673, 2674, 2675, 2676, 2677, 2678, 26

Rev. 3/2020 - 2020-01-01 - Dep. 2020 NUECREACIONE
 Tit. 14 - PA - N. 101 - Exp. 378 FASENACIONALI
 Art. 329 GIO-N-ORRAGION - Foglio: 42

NIT : 900176989-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 89,273
FECHA : OCTUBRE 31 DE 2007

**** CONSIGNATION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BRIGASE & CASTRO LTA	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00100-6	51101279	10/10/2007	17,100,000.00

***** C O N F I D E N T I A L *****

CART. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS / LEAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

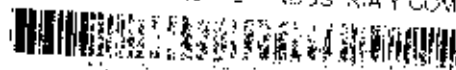
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

AS

3
987
938

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 8001

ACTIVIDAD ECONOMICA

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 529
FECHA : ENERO 3 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BRIGARD & CASTRO LTDA	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2280232	03/01/2008	26,682,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISYGO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	DIFER. SERVICIOS DE PROPIEDAD 1	998 VALOR COMPLEMENTO TARIFA AÑO ANTER
		TOTAL :	\$ 4,000.00

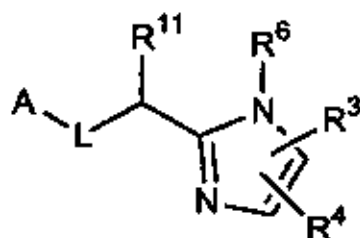
SON: CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE Nº. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, caracterizado porque:

A es carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-1 R¹ y 0-3 R², o con un heterociclo de 5 hasta 12 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está sustituido con 0-1 R¹ y 0-3 R²; con la condición de que cuando A es un heterociclo que contiene uno o más átomos de nitrógeno, A no está unido a L por medio de cualesquiera de los átomos de nitrógeno en el anillo A;

L es -C(O)NH- o -NHC(O)-;

R¹ es, independientemente cada que se presenta, -NH₂, -NH(alquilo C₁₋₃), -N(alquilo C₁₋₃)₂, -C(=NH)NH₂, -C(O)NR^{8a}R⁹, -S(O)_pNR^{8a}R⁹, -(CH₂)_rNR⁷R⁸, -(CH₂)_rNR⁷CO₂R^a, -CH₂NH₂, -CH₂NH(alquilo C₁₋₃), -CH₂N(alquilo C₁₋₃)₂, -CH₂CH₂NH₂, -CH₂CH₂NH(alquilo C₁₋₃), -CH₂CH₂N(alquilo C₁₋₃)₂, -CH(alquilo C₁₋₄)NH₂, -C(alquilo C₁₋₄)₂NH₂, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, =NR⁸, -NR⁸CR⁸(=NR^{8a}), F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, -(CH₂)_rOR^a, -(CH₂)_rSR^a, CN, 1-NH₂-1-ciclopropilo, o alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-1 R^{1a};

R^{1a} es H, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NR⁸CH(=NR^{8a}), -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, F, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, -NR⁹SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^c, -S(O)_p-alquilo C₁₋₄, -S(O)_p-fenilo, o -(CF₂)_rCF₃;

R² es, independientemente cada que se presenta, H, =O, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, CHF₂, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -NR⁸S(O)₂R^c, -S(O)R^c, -S(O)₂R^c, alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-2 R^{2a}, alquenilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{2a}, alquinilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{2a}, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-3 R^{2b}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está sustituido con 0-3 R^{2b};

883

R^{2a} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^c, -S(O)R^c, o -S(O)₂R^c;

R^{2b} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -S(O)₂R^c, -NR⁸SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^c, -(CF₂)_rCF₃, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, o haloalcoxi C₁₋₄;

alternativamente, cuando los grupos R¹ y R² son substituidos en átomos de anillo adyacente, estos pueden tomarse junto con los átomos en el anillo al cual se enlazan para formar un carbociclo o heterociclo de 5 a 7 miembros que comprende: átomos de carbono y 0-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el carbociclo o heterociclo está substituido con 0-2 R^{2b};

R³ es -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5- a 10- miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d};

R^{3a} es, independientemente cada que se presenta, =O, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, NO₂, CN, -(CH₂)_rOR^{3b}, -(CH₂)_rSR^{3b}, -(CH₂)_rNR⁷R⁸, C(=NR^{8a})NR⁸R⁹, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NR⁸CR⁸(=NR^{8a}), -(CH₂)_rNR⁸C(O)R^{3b}, =NR⁸, -(CH₂)_rNR⁸C(O)R^{3b}, -(CH₂)_rNR⁸C(O)₂R^{3b}, -(CH₂)_rS(O)_pNR⁸R⁹, -(CH₂)_rNR⁸S(O)_pR^{3c}, -S(O)_pR^{3c}, -S(O)_pR^{3c}, -C(O)-alquilo C₁₋₄, -(CH₂)_rCO₂R^{3b}, -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, -(CH₂)_rOC(O)NR⁸R⁹, -NHCOCF₃, -NHCO₂CF₃, -SO₂NHR^{3b}, -SO₂NHCO₂R^{3c}, -SO₂NHCO₂R^{3c}, -CONHSO₂R^{3c}, -NHCO₂R^{3c}, -CONHOR^{3b}, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquilo C₁₋₆ substituido por R^{3d}, alquenilo C₂₋₆ substituido por R^{3d}, alquinilo C₂₋₆ substituido por R^{3d}, cicloalquilo C₃₋₆ substituido por 0-1 R^{3d}, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^{3d}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5- hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-3 R^{3d};

alternativamente, cuando dos grupos R^{3a} se localizan en átomos adyacentes, estos pueden tomarse junto con los átomos a los cuales están enlazados para formar un carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-2 R^{3d} o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-2 R^{3d};

884

884

R^{3b} es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , alquenilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , alquinilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} sustituido con 0-3 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3d} ;

R^{3c} es, independientemente cada que se presenta, alquilo C_{1-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , alquenilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , alquinilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} sustituido con 0-3 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo está sustituido con 0-3 R^{3d} ;

R^{3d} es, independientemente cada que se presenta, H, $=O$, $-(CH_2)_rOR^a$, F, Cl, Br, CN, NO_2 , $-(CH_2)_rNR^7R^8$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^7C(O)R^b$, $-C(O)NR^8R^9$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2R^C$, $-S(O)_pR^C$, $-(CF_2)_rCF_3$, alquilo C_{1-6} sustituido con 0-2 R^e , alquenilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^e , alquinilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^e , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} sustituido con 0-3 R^d , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo está sustituido con 0-3 R^d ;

R^4 es H, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN, NO_2 , $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^7R^8$, $-C(O)NR^8R^9$, $-NR^7C(O)R^b$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^C$, $-S(O)R^C$, $-S(O)_2R^C$ o alquilo C_{1-6}

R^6 es H;

R^7 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , $-(CH_2)_n$ carbociclo C_{3-10} , $-(CH_2)_n$ -(heteroarilo de 5-10 miembros), $-C(O)R^C$, $-CHO$, $-C(O)_2R^C$, $-S(O)_2R^C$, $-CONR^8R^C$, $-OCONHR^C$, $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(alquilo C_{1-4}), o $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(arilo C_{6-10}); en donde los alquilo, carbociclo, heteroarilo, y arilo están sustituidos opcionalmente con 0-2 R^f ;

R^8 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_r$ -fenilo, o $-(CH_2)_n$ heterociclo de 5-10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$; en donde los alquilo, fenilo y heterociclo están sustituidos opcionalmente con 0-2 R^f ;

alternativamente, R^7 y R^8 , cuando se enlazan al mismo nitrógeno, se combinan para formar un anillo heterocíclico de 5 hasta 10 miembros que

885

335

comprende átomos de carbono y 0-2 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-2 R^d;

R^{8a} es, independientemente cada que se presenta, H, OH, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₄, (arilo C₆₋₁₀)-alcoxi C₁₋₄, -(CH₂)_n-fenilo, -(CH₂)_n-(heteroarilo de 5-10 miembros), -C(O)R^c, -C(O)₂R^c, -C(O)O-(alquilo C₁₋₄)OC(O)-(alquilo C₁₋₄), o -C(O)O-(alquilo C₁₋₄)OC(O)-(arilo C₆₋₁₀); en donde el fenilo, arilo, y heteroarilo están opcionalmente substituidos con 0-2 R^f;

R⁹ es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C₁₋₆, o -(CH₂)_n-fenilo; en donde el alquilo y fenilo están substituidos opcionalmente con 0-2 R^f;

R^{9a} es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C₁₋₆, o -(CH₂)_n-fenilo;

alternativamente, R⁸ y R⁹, cuando se enlazan al mismo nitrógeno, se combinan para formar un anillo heterocíclico de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 0-2 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-2 R^d;

R¹⁰ es H,

R¹¹ es -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, alquilo C₁₋₆ substituido con 0-3 R^{11a}, -(CR¹⁴R¹⁵)_r carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^{11b}, o -(CR¹⁴R¹⁵)_r heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-3 R^{11b};

R^{11a} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, alquilo C₁₋₄, OR^a, CF₃, SR^a, F, CN, NO₂, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -S(O)_pR^c, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, -(CH₂)_r carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, y substituido con 0-3 R^d;

R^{11b} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, =NR⁸, OR^a, F, Cl, Br, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -SOR^c, -SO₂R^c, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -NR⁸C(O)₂R^c, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, -(CH₂)_r carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r heterociclo de 5-10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-3 R^d;

R^{14} y R^{15} son, independientemente cada que se presentan, H, F, o alquilo C_{1-4} ;

alternativamente, R^{14} se combina con R^{15} para formar $=O$;

R^a es, independientemente cada que se presenta, H, CF_3 , alquilo C_{1-6} , $-(CH_2)_r$ cicloalquilo C_{3-7} , $-(CH_2)_r$ arilo C_{6-10} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$; en donde los grupos cicloalquilo, arilo y heterociclo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f ;

R^b es, independientemente cada que se presenta, CF_3 , OH, alcoxi C_{1-4} , alquilo C_{1-6} , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^d , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5-10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^d ;

R^c es, independientemente cada que se presenta, CF_3 , alquilo C_{1-6} substituido con 0-2 R^f , cicloalquilo C_{3-6} substituido con 0-2 R^f , arilo C_{6-10} , heteroarilo de 5 hasta 10 miembros, (arilo C_{6-10})-alquilo C_{1-4} , o (heteroarilo de 5 hasta 10 miembros)-alquilo C_{1-4} , en donde los grupos arilo y heteroarilo son opcionalmente substituidos con 0-3 R^f ;

R^d es, independientemente cada que se presenta, H, $=O$, $=NR^8$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^7R^8$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, $-(CF_2)_rCF_3$, alquilo C_{1-6} , substituido con 0-2 R^e , alqueno C_{2-6} substituido con 0-2 R^e , o alquinilo C_{2-6} substituido con 0-2 R^e ;

R^e es, independientemente cada que se presenta, $=O$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^8R^9$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, o $-(CF_2)_rCF_3$;

R^f es, independientemente cada que se presenta, H, $=O$, $-(CH_2)_rOR^g$, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^{9a}R^{9a}$, $-C(O)R^g$, $-C(O)OR^g$, $-NR^{9a}C(O)R^g$, $-C(O)NR^{9a}R^{9a}$, $-SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^{9a}SO_2CF_3$, $-NR^{9a}SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, $-(CF_2)_rCF_3$, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo;

R^g es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo;

n, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, 2, 3, y 4;

p, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, y 2;

r, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, 2, 3, y 4; y

s, cada que se presenta, se selecciona de 1, 2, 3, y 4;

con la condición de que:

(a). cuando L es $-C(O)NH-$, R^3 no es 2,4-diclorofenilo, 4-nitrofenilo o pentafluorofenilo;

(b). cuando L es $-C(O)NH-$, R^{11} no es $-CH_2-(3\text{-indolilo})$, $-(CH_2)_4NHCO_2(t\text{-Bu})$ o $-(CH_2)_4NH_2$.

2. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque:

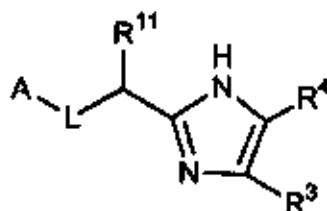
R^1 es, independientemente cada que se presenta, F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t\text{-Bu})$, $-CH(Me)NH_2$, $-C(Me)_2NH_2$, $-NHEt$, $-NHCO_2(t\text{-Bu})$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a o $-CH_2R^{1a}$;

R^3 es $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , naftilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , indanilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^4 es H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, NH_2 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-CONR^8R^9$, alquilo C_{1-6} ; y

R^{11} es alquilo C_{1-6} , $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-(CH_2)_r$ -cicloalquilo C_{3-7} sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-2 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5-10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-2 R^{11b} .

3. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (II):



(II)

888
10
389

o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

A está substituido con 0-1 R^1 y 0-2 R^2 y se selecciona de: cicloalquilo C_{3-7} , fenilo naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, piridilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, isoquinolinilo, 5,6,7,8-tetrahidroisoquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, quinazolinilo, 1H-quinazolin-4-onilo, 2H-isoquinolin-1-onilo, 3H-quinazolin-4-onilo, 3,4-dihidro-2H-isoquinolin-1-onilo, 2,3-dihidroisoindolinonilo, y ftalazinilo;

L es $-C(O)NH-$ o $-NHC(O)-$;

R^1 es, independientemente cada que se presenta, F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t-Bu)$, $-CH(Me)NH_2$, $-CMe_2NH_2$, $-NHEt$, $-NHCO_2(t-Bu)$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a , o $-CH_2R^{1a}$;

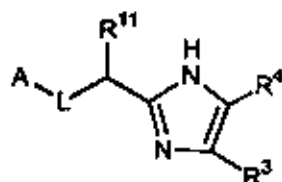
R^3 es fenilo substituido con 0-2 R^{3a} , naftilo substituido con 0-2 R^{3a} , indanilo substituido con 0-2 R^{3a} , o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-2 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo está substituido con 0-2 R^{3a} ;

R^4 es H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , o alquilo C_{1-6} ;

R^{11} es alquilo C_{1-6} , $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-(CH_2)_r$ cicloalquilo C_{3-7} substituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ fenilo substituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ naftilo substituido con 0-2 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ heteroarilo de 5 hasta 10 miembros substituidos con 0-2 R^{11b} y seleccionados de tiazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, imidazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, indolilo, isoindolilo, indolinilo, isoindolinilo, benzimidazolilo, benzotiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, y tetrahydroisoquinolinilo; y

R^{11b} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, OEt, $O(i-Pr)$, OCF_3 , $OCHF_2$, CN, OPh, OBn, NO_2 , $-NH_2$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-NR^7C(O)R^b$, $-NR^8C(O)_2R^c$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^c$, $-SO_2R^c$, alquilo C_{1-4} , Ph, o Bn.

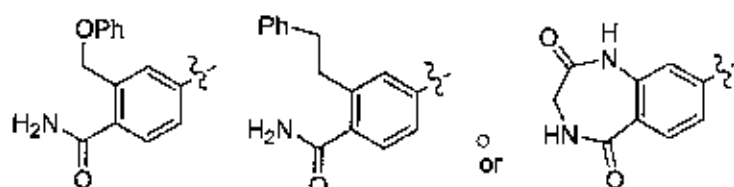
4. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (II):



881
83-1

o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

A es 4-CH₂NH₂-ciclohexilo, 4-CO₂Me-ciclohexilo, 4-CONH₂-ciclohexilo, 4-NHCO₂(*t*-Bu)-ciclohexilo, 4-NHCO₂Bn-ciclohexilo, fenilo, 4-Me-fenilo, 3-OMe-fenilo, 4-CH₂NH₂-fenilo, 3-CONH₂-fenilo, 4-CONH₂-fenilo, 3-amidino-fenilo, 4-amidino-fenilo, 2-F-4-Me-fenilo, 2-Bn-4-CH₂NH₂-fenilo, 4-SO₂NH₂-fenilo, 2-F-5-OMe-fenilo, 2-F-4-Cl-fenilo, 2-F-4-CH₂NH₂-fenilo, 2-F-4-CONH₂-fenilo, 2-Cl-4-CONH₂-fenilo, 2-Et-4-CH₂NH₂-fenilo, 2-NHEt-4-CH₂NH₂-fenilo, 2-OMe-4-CONH₂-fenilo, 3-OMe-4-CONH₂-fenilo, 1,2,3,4-tetrahidronaft-2-ilo, 3-Cl-tien-2-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indazol-6-ilo, 3-NH₂-indazol-6-ilo, 3-NH₂-indazol-5-ilo, 1-Me-3-NH₂-indazol-6-ilo, 3-NH₂-benzisoaxazol-6-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-6-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 2-COPh-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 2-CO₂Bn-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-1-on-6-ilo, 2H-isoquinolin-1-on-6-ilo, isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-3-Me-isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-5,6,7,8-tetrahidroisoquinolin-6-ilo, 4-NH₂-quinazolin-7-ilo, 3H-quinazolin-4-on-7-ilo,



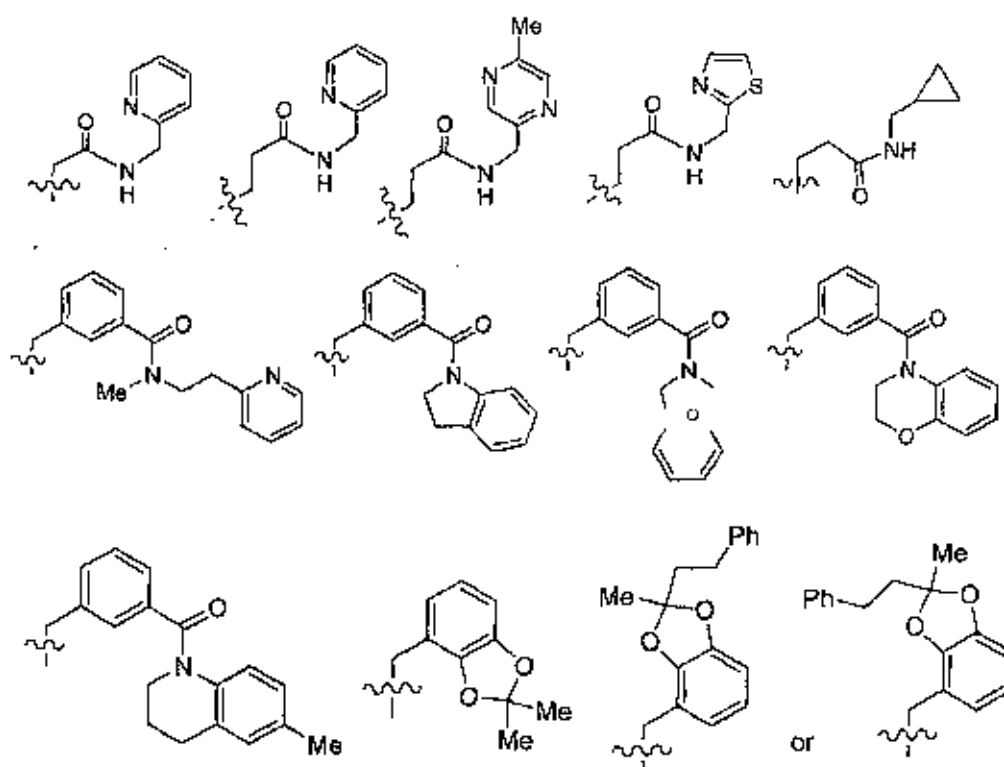
R³ es fenilo, fenetilo, -(CH=CH)-fenilo, 3-bifenilo, 4-bifenilo, 3,4-metilendioxfenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, 3-NH₂-fenilo, 3-NMe₂-fenilo, 4-OPh-fenilo, 4-OBn-fenilo, 4-(*t*-butoximetil)-fenilo, 4-SO₂Me-fenilo, 3-CN-fenilo, 4-CN-fenilo, 3-F-fenilo, 4-F-fenilo, 3-Cl-fenilo, 4-Cl-fenilo, 3-Br-fenilo, 4-Br-fenilo, 3-OH-fenilo, 4-OH-fenilo, 2-OMe-fenilo, 3-OMe-fenilo, 4-OMe-fenilo, 3-CF₃-fenilo, 4-CF₃-fenilo, 3-CO₂H-fenilo, 4-CO₂H-fenilo, 3-CO₂Me-fenilo, 4-CO₂Me-fenilo, 3-CH₂CO₂H-fenilo, 4-CH₂CO₂H-fenilo, 4-CH₂CO₂Me-fenilo, 3-CH₂CO₂Et-fenilo, 4-CH₂CO₂Et-fenilo, 3-CONH₂-fenilo, 4-CONH₂-fenilo, 3-CH₂CONH₂-fenilo, 4-CH₂CONH₂-fenilo, 4-CONHMe-fenilo, 4-CONMe₂-fenilo, 4-amidino-fenilo, 3-NHCOMe-fenilo, 4-NHCOMe-fenilo, 4-NHCO₂Me-fenilo, 4-SO₂NH₂-fenilo, 3-NHSO₂Me-fenilo, 4-NHSO₂Me-fenilo, 2,4-diF-fenilo, 3-F-4-CN-fenilo, 3-CN-5-F-fenilo, 3-F-4-CONH₂-fenilo, 3-CO₂H-4-CN-fenilo, 3-NMe₂-4-CN-fenilo, 3-Ph-4-CONH₂-fenilo, 4-(2-oxo-1-piperidino)-fenilo, tiazol-2-ilo, 4-CO₂Me-tiazol-2-ilo, 4-CONH₂-tiazol-2-ilo, 1-Bn-piazol-4-ilo, 5-Ph-oxazol-2-ilo, 5-CONH₂-tien-2-ilo, 5-CO₂H-tien-2-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirid-4-ilo, 6-NH₂-Pirid-3-ilo, benzimidazol-

890
890

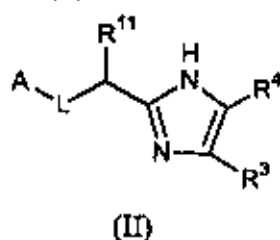
2-ilo, 1-Me-benzimidazol-2-ilo, benzoxazol-2-ilo, benzotiazol-2-ilo, 3-NH₂-benzisoxazol-6-ilo, 3-NH₂-benzisoxazol-5-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, 3-NH₂-indazol-5-ilo, 3-OH-indazol-5-ilo, 3-NH₂-indazol-6-ilo, 3-NH₂-4-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-5-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-7-F-indazol-6-ilo, 4-imino-3,4-dihidro-2H-ftalazin-1-on-7-ilo, 3-(5-tetrazolil)-fenilo, 2,3-dihidro-isoindol-1-on-6-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-5-ilo, 2H-isoquinolin-1-on-6-ilo, 2,4-diaminoquinazolin-7-ilo, o 4-NH₂-quinazolin-7-ilo;

R⁴ es H, Me, Br, Cl, CF₃, CO₂H, CO₂Me, o CO₂Et; y

R¹¹ es Me, neopentilo, ciclohexilmetilo, -CH₂CH₂CONHBn, -CH₂CH₂CONH(CH₂CH₂Ph), -CH₂CH₂CON(Me)Bn, bencilo, fenetilo, 2-Me-bencilo, 3-Me-bencilo, 4-Me-bencilo, 2-F-bencilo, 3-F-bencilo, 4-F-bencilo, 2-Cl-bencilo, 3-Cl-bencilo, 4-Cl-bencilo, 2-Br-bencilo, 3-Br-bencilo, 4-Br-bencilo, 3-CF₃-bencilo, 4-CF₃-bencilo, 2-NH₂-bencilo, 3-NH₂-bencilo, 2-NO₂-bencilo, 3-NO₂-bencilo, 4-NO₂-bencilo, 3-OMe-bencilo, 4-OMe-bencilo, 3-OCF₂H-bencilo, 2-OCF₃-bencilo, 3-OCF₃-bencilo, 2-OPh-bencilo, 3-OPh-bencilo, 2-OBn-bencilo, 3-OBn-bencilo, 4-OBn-bencilo, 4-COPh-bencilo, 3-CO₂H-bencilo, 3-CO₂Me-bencilo, 3-NHAc-bencilo, 2-NHCOPh-bencilo, 2-NHCOBn-bencilo, 3-NHCOBn-bencilo, 3-N(Me)COPh-bencilo, 3-(NHCOCH₂CH₂Ph)-bencilo, 2-NHSO₂Ph-bencilo, 3-NHSO₂Ph-bencilo, 3-[SO₂N(Me)Ph]-bencilo, 3-[N(Me)SO₂Ph]-bencilo, 3-[CONH(*i*-Bu)]-bencilo, 3-[CONH(*t*-Bu)]-bencilo, 3-[CONH(isopentil)]-bencilo, 3-[CONH(2-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(3-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(4-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(4-F-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(1-naftil)]-bencilo, 3-(CONHBn)-bencilo, 3-[CONH(4-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CONH(4-OMe-Bn)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂Ph]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(4-OMe-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(2-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(3-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(4-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(CH₂)₃Ph]-bencilo, 3-[CONMe₂]-bencilo, 3-[CON(Me)(Et)]-bencilo, 3-[CON(Me)(*i*-Pr)]-bencilo, 3-[CON(Me)(*i*-Bu)]-bencilo, 3-[CON(Me)Ph]-bencilo, 3-[CON(Me)(3-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CON(Me)(4-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CON(Me)Bn]-bencilo, 3-[CON(Me)(3-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CON(Me)(4-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CON(Me)(CH₂CH₂Ph)]-bencilo, 3-[CON(Et)Ph]-bencilo, 3-[CO(1-piperidino)]-bencilo, 3-[CO(4-Ph-1-piperidino)]-bencilo, 3-[CO(1,2,3,4-tetrahidroisoquinolino)]-bencilo, 2-Ph-bencilo, 3-Ph-bencilo, 4-Ph-bencilo, 3-fenetil-bencilo, -CH₂OBn, -CH₂SBn, 1-naftilmetilo, 2-naftilmetilo, tiazol-4-ilmetilo, pirid-2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 1-Bn-imidazol-4-ilmetilo, benzotiazol-2-ilmetilo,



5. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (II):



o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

R^3 es 3-NH₂-indazol-5-ilo, 3-OH-indazol-5-ilo, 3-NH₂-benzisoaxazol-6-ilo, 3-NH₂-benzisoaxazol-5-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, 3-NH₂-indazol-6-ilo, 3-NH₂-4-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-5-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-7-F-indazol-6-ilo, isoquinolin-5-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-8-ilo, 2H-isoquinolin-1-on-6-ilo, 2,4-diaminoquinazolin-7-ilo, o 4-NH₂-quinazolin-7-ilo.

6. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 5, caracterizado porque:

R^1 es, independientemente cada que se presenta, F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t-Bu)$, $-CH(Me)NH_2$, $-C(Me)_2NH_2$, $-NHet$, $-NHCO_2(t-Bu)$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a , o $-CH_2R^{1a}$;

R^4 es H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-CONR^8R^9$, o alquilo C_{1-6} ;

R^{11} es alquilo C_{1-6} , $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-(CH_2)_r$ cicloalquilo C_{3-7} sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-2 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5-10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo está sustituido con 0-2 R^{11b} ; y

R^{11b} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, OEt, $O(i-Pr)$, OCF_3 , $OCHF_2$, CN, OPh, OBn, NO_2 , $-NH_2$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-NR^7C(O)R^b$, $-N^8CO_2R^c$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^c$, $-SO_2R^c$, alquilo C_{1-4} , Ph, o Bn.

7. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque:

A es sustituido con 0-1 R^1 y 0-2 R^2 y son seleccionados de: cicloalquilo C_{3-7} , fenilo, naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, piridilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, isoquinolinilo, 5,6,7,8-tetrahidroisoquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, quinazolinilo, 1H-quinazolin-4-onilo, 2H-isoquinolin-1-onilo, 3H-quinazolin-4-onilo, 3,4-dihidro-2H-isoquinolin-1-onilo, 2,3-dihidroisoindolinonilo, y ftalazinilo;

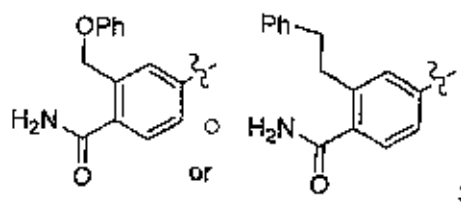
8. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 7, caracterizado porque:

A es 4- CH_2NH_2 -ciclohexilo, 4- CO_2Me -ciclohexilo, 4- $CONH_2$ -ciclohexilo, 4- $NHCO_2(t-Bu)$ -ciclohexilo, 4- $NHCO_2Bn$ -ciclohexilo, fenilo, 4-Me-fenilo, 3-OMe-fenilo, 4- CH_2NH_2 -fenilo, 3- $CONH_2$ -fenilo, 4- $CONH_2$ -fenilo, 3-amidino-fenilo, 4-amidino-fenilo, 2-F-4-Me-fenilo, 2-Bn-4- CH_2NH_2 -fenilo, 4- SO_2NH_2 -fenilo, 2-F-5-OMe-fenilo, 2-F-4-Cl-fenilo, 2-F-4- CH_2NH_2 -fenilo, 2-F-4- $CONH_2$ -fenilo, 2-Cl-4- $CONH_2$ -fenilo, 2-Et-4- CH_2NH_2 -fenilo, 2-NHet-4- CH_2NH_2 -fenilo, 2-OMe-4- $CONH_2$ -fenilo, 3-OMe-4- $CONH_2$ -fenilo, 1,2,3,4-tetrahidronaft-2-ilo, 3-Cl-tien-2-ilo, indol-5-ilo, indol-5-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, 3- NH_2 -indazol-6-ilo, 3- NH_2 -indazol-5-ilo, 1-Me-3- NH_2 -indazol-6-ilo, 3- NH_2 -benzisoxazol-6-ilo, 1,2,3,4-

833

843

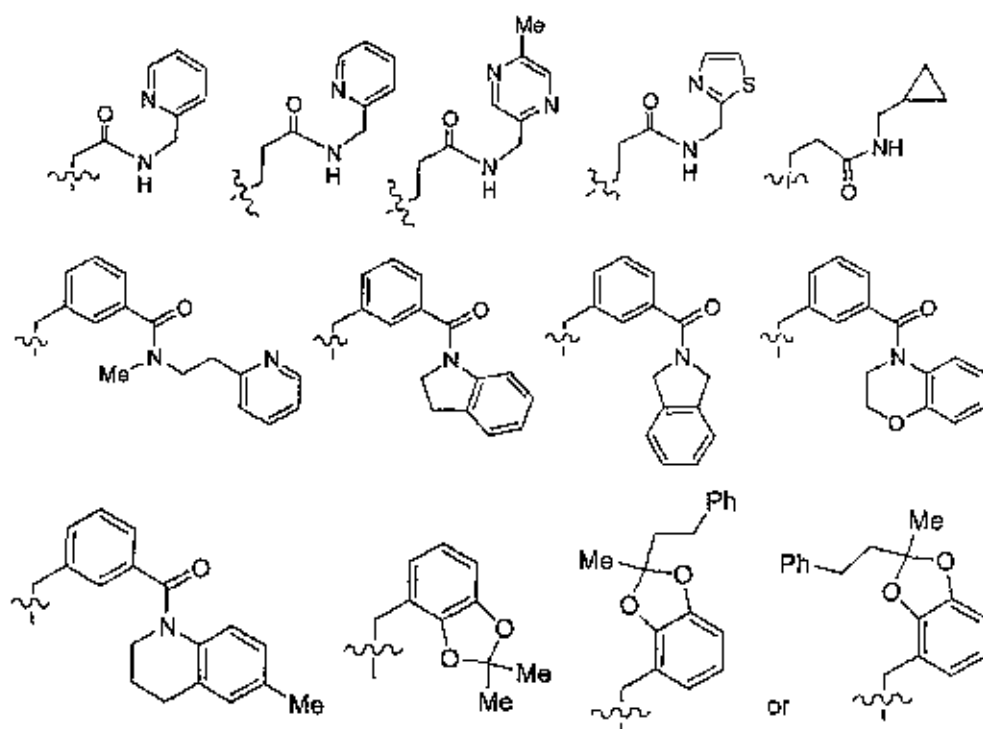
tetrahidroisoquinolin-6-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 2-COPh-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 2-CO₂Bn-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-3-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-1-on-6-ilo, 2H-isoquinolin-1-on-6-ilo, isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-3-Me-isoquinolin-6-ilo, 1-NH₂-5,6,7,8-tetrahidroisoquinolin-6-ilo, 4-NH₂-quinazolin-7-ilo, 3H-quinazolin-4-on-7-ilo,



R^4 es H, Me, Br, Cl, CF₃, CO₂H, CO₂Me, o CO₂Et; y

R^{11} es Me, neopentilo, ciclohexilmetilo, -CH₂CH₂CONHBn, -CH₂CH₂CONH(CH₂CH₂Ph), -CH₂CH₂CON(Me)Bn, bencilo, fenetilo, 2-Me-bencilo, 3-Me-bencilo, 4-Me-bencilo, 2-F-bencilo, 3-F-bencilo, 4-F-bencilo, 2-Cl-bencilo, 3-Cl-bencilo, 4-Cl-bencilo, 2-Br-bencilo, 3-Br-bencilo, 4-Br-bencilo, 3-CF₃-bencilo, 4-CF₃-bencilo, 2-NH₂-bencilo, 3-NH₂-bencilo, 2-NO₂-bencilo, 3-NO₂-bencilo, 4-NO₂-bencilo, 3-OMe-bencilo, 4-OMe-bencilo, 3-OCF₂H-bencilo, 2-OCF₃-bencilo, 3-OCF₃-bencilo, 2-OPh-bencilo, 3-OPh-bencilo, 2-OBn-bencilo, 3-OBn-bencilo, 4-OBn-bencilo, 4-COPh-bencilo, 3-CO₂H-bencilo, 3-CO₂Me-bencilo, 3-NHAc-bencilo, 2-NHCOPh-bencilo, 2-NHCOBn-bencilo, 3-NHCOBn-bencilo, 3-N(Me)COPh-bencilo, 3-(-NHCOCH₂CH₂Ph)-bencilo, 2-NHSO₂Ph-bencilo, 3-NHSO₂Ph-bencilo, 3-[SO₂N(Me)Ph]-bencilo, 3-[N(Me)SO₂Ph]-bencilo, 3-[CONH(*i*-Bu)]-bencilo, 3-[CONH(*t*-Bu)]-bencilo, 3-[CONH(isopentil)]-bencilo, 3-[CONH(2-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(3-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(4-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(4-F-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(1-naftil)]-bencilo, 3-(CONHBn)-bencilo, 3-[CONH(4-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CONH(4-OMe-Bn)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂Ph]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(4-OMe-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(2-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(3-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONHCH₂CH₂(4-Cl-Ph)]-bencilo, 3-[CONH(CH₂)₃Ph]-bencilo, 3-[CONMe₂]-bencilo, 3-[CON(Me)(Et)]-bencilo, 3-[CON(Me)(*i*-Pr)]-bencilo, 3-[CON(Me)(*i*-Bu)]-bencilo, 3-[CON(Me)Ph]-bencilo, 3-[CON(Me)(3-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CON(Me)(4-Me-Ph)]-bencilo, 3-[CON(Me)Bn]-bencilo, 3-[CON(Me)(3-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CON(Me)(4-Cl-Bn)]-bencilo, 3-[CON(Me)(CH₂CH₂Ph)]-bencilo, 3-[CON(Et)Ph]-bencilo, 3-[CO(1-piperidino)]-bencilo, 3-[CO(4-Ph-1-piperidino)]-bencilo, 3-[CO(1,2,3,4-tetrahidroisoquinolino)]-bencilo, 2-Ph-bencilo, 3-Ph-bencilo, 4-Ph-bencilo, 3-fenetil-bencilo, -CH₂OBn, -CH₂SBn, 1-naftilmetilo, 2-

naftilmetilo, tiazol-4-ilmetilo, pirid-2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 1-Bn-imidazol-4-ilmetilo, benzotiazol-2-ilmetilo,



9. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 7, caracterizado porque:

A es 4-CH₂NH₂-ciclohexilo, 4-NHCO₂(*t*-Bu)-ciclohexilo, 4-NHCO₂Bn-ciclohexilo, o 1-NH₂-5,6,7,8-tetrahidroisoquinolin-6-ilo;

R³ es indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, 3-NH₂-indazol-5-ilo, 3-OH-indazol-5-ilo, 3-NH₂-indazol-6-ilo, 3-NH₂-4-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-5-F-indazol-6-ilo, 3-NH₂-7-F-indazol-6-ilo, o 4-NH₂-quinazolin-7-ilo;

R⁴ es H, Me, F, Br, Cl, o CF₃; y

R¹¹ es bencilo substituido con 0-2 R^{11b}.

10. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque:

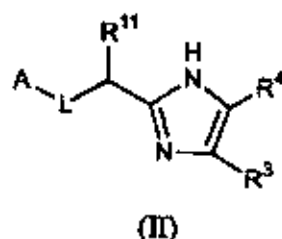
A es 4-CH₂NH₂-ciclohexilo;

L es -C(O)NH-; y

R³ es 3-NH₂-indazol-6-ilo o 4-NH₂-quinazolin-7-ilo.

895
395

11. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (II):



o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

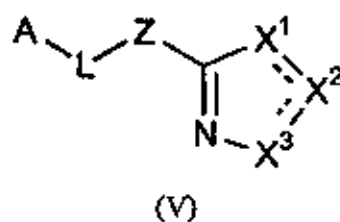
A es sustituido con 0-2 R^1 y 0-1 R^2 y seleccionados de: cicloalquilo C_{3-7} , fenilo, naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, piridilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, isoquinolinilo, 5,6,7,8-tetrahidroisoquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, quinazolinilo, 1H-quinazolin-4-onilo, 2H-isoquinolin-1-onilo, 3H-quinazolin-4-onilo, 3,4-dihidro-2H-isoquinolin-1-onilo, 2,3-dihidroisoindolinonilo, y ftalazinilo;

R^3 es $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^4 es H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-CONR^8R^9$ o alquilo C_{1-6} ; y

R^{11} es bencilo sustituido con 0-2 R^{11b} .

12. Un compuesto de la fórmula (V):

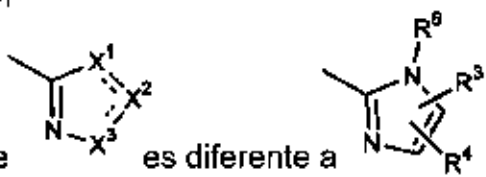


o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, caracterizado porque:

A es carbociclo C_{3-10} sustituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , o un heterociclo de 5 hasta 12 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos

seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo está substituido con 0-1 R¹ y 0-3 R²; con la condición de que cuando A es un heterociclo que contiene uno o más átomos de nitrógeno, A no está unido a L por medio de cualquiera de los átomos de nitrógeno en el anillo A;

X¹, X² y X³ son cada uno independientemente CR³, CR⁴, CR⁴R⁵, O, S(O)_p, N, NR³, NR⁶ o C(O); con la condición de que ningún enlace S-S, S-O, o O-O está presente en el anillo;



con la condición de que es diferente a
Z es -C(R¹¹)(R¹²)-, -C(R¹¹)(R¹²)-(CH₂)-, -NR¹³-, o -NR¹³CH₂-;

L es -C(O)NH- o -NHC(O)-;

R¹ es, independientemente cada que se presenta, -NH₂, -NH(alquilo C₁₋₃), -N(alquilo C₁₋₃)₂, -C(=NH)NH₂, -C(O)NR⁸R⁹, -S(O)_pNR⁸R⁹, -(CH₂)_rNR⁷R⁸, -(CH₂)_rNR⁷C(O)OR^a, -CH₂NH₂, -CH₂NH(alquilo C₁₋₃), -CH₂N(alquilo C₁₋₃)₂, -CH₂CH₂NH₂, -CH₂CH₂NH(alquilo C₁₋₃), -CH₂CH₂N(alquilo C₁₋₃)₂, -CH(alquilo C₁₋₄)NH₂, -C(alquilo C₁₋₄)₂NH₂, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, =NR⁸, -NR⁸CR⁸(=NR^{8a}), F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, -(CH₂)_rOR^a, -(CH₂)_rSR^a, CN, 1-NH₂-1-ciclopropilo, o alquilo C₁₋₆ substituido con 0-1 R^{1a};

R^{1a} es H, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NR⁸CH(=NR^{8a}), -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, F, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, -NR⁹SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -S(O)_p-alquilo C₁₋₄, -S(O)_p-fenilo, o -(CF₂)_rCF₃;

R² es, independientemente cada que se presenta, H, =O, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, CHF₂, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -NR⁸S(O)₂R^C, -S(O)R^C, -S(O)₂R^C, alquilo C₁₋₆ substituido con 0-2 R^{2a}, alqueno C₂₋₆ substituido con 0-2 R^{2a}, alquino C₂₋₆ substituido con 0-2 R^{2a}, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^{2b}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 a 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{2b};

R^{2a} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -S(O)R^C, o -S(O)₂R^C;

R^{2b} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -S(O)₂R^C, -NR⁸SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -(CF₂)_rCF₃,

alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-6} , haloalquilo C_{1-4} , o haloalcoxi C_{1-4} ;

alternativamente, cuando los grupos R^1 y R^2 son substituidos en átomos en el anillo adyacente, estos pueden tomarse juntos con los átomos en el anillo al cual se enlazan para formar un carbociclo o heterociclo de 5 hasta 7 miembros que comprende: átomos de carbono y 0-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el carbociclo o heterociclo es substituido con 0-2 R^{2b} ;

R^3 es, independientemente cada que se presenta, $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 a 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^{3a} es, independientemente cada que se presenta, $=O$, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , NO_2 , CN, $-(CH_2)_rOR^{3b}$, $-(CH_2)_rSR^{3b}$, $-(CH_2)_rNR^7R^8$, $C(=NR^{8a})NR^8R^9$, $-NHC(=NR^{8a})NR^7R^8$, $-NR^8CR^8(=NR^{8a})$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)R^{3b}$, $=NR^8$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)R^{3b}$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)_2R^{3b}$, $-(CH_2)_rS(O)_pNR^8R^9$, $-(CH_2)_rNR^8S(O)_pR^{3c}$, $-S(O)_pR^{3c}$, $-S(O)_pR^{3c}$, $-C(O)$ -alquilo C_{1-4} , $-(CH_2)_rCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_rC(O)NR^8R^9$, $-(CH_2)_rOC(O)NR^8R^9$, $-NHCOCF_3$, $-NHCO_2CF_3$, $-SO_2NHR^{3b}$, $-SO_2NHCOR^{3c}$, $-SO_2NHCO_2R^{3c}$, $-CONHSO_2R^{3c}$, $-NHSO_2R^{3c}$, $-CONHOR^{3b}$, haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquilo C_{1-6} substituido por R^{3d} , alquenilo C_{2-6} substituido por R^{3d} , alquinilo C_{2-6} substituido por R^{3d} , cicloalquilo C_{3-6} substituido por 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{3d} ;

alternativamente, cuando dos grupos R^{3a} se localizan en átomos adyacentes, se toman junto con los átomos a los cuales se enlazan para formar un carbociclo C_{3-10} substituido con 0-2 R^{3d} o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-2 R^{3d} ;

R^{3b} es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} substituido con 0-2 R^{3d} , alquenilo C_{2-6} substituido con 0-2 R^{3d} , alquinilo C_{2-6} substituido con 0-2 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono

898
873

y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3d};

R^{3c} es, independientemente cada que se presenta, alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-2 R^{3d}, alquenilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{3d}, alquinilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{3d}, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-3 R^{3d}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3d};

R^{3d} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, -(CH₂)_rOR^a, F, Cl, Br, CN, NO₂, -(CH₂)_rNR⁷R⁸, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷C(O)R^b, -C(O)NR⁸R⁹, -SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^c, -S(O)_pR^c, -(CF₂)_rCF₃, alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-2 R^e, alquenilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^e, alquinilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^e, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^d;

R⁴ es, independientemente cada que se presenta, H, =O, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, NO₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, -S(O)R^c, -S(O)₂R^c, o alquilo C₁₋₆;

R⁵ es, independientemente cada que se presenta, H, F, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, NO₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)₂R^c, -S(O)R^c, -S(O)₂R^c, alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-2 R^{5a}, alquenilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{5a}, alquinilo C₂₋₆ sustituido con 0-2 R^{5a}, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-3 R^{5b}, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{5b};

R^{5a} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, OR^a, SR^a, F, Cl, Br, I, CF₃, OCF₃, CN, NO₂, -NR⁷R⁸, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -NR⁸S(O)₂R^c, -S(O)R^c, o -S(O)₂R^c;

R^{5b} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, =NR⁸, F, Cl, Br, I, OR^a, SR^a, CN, NO₂, CF₃, -SO₂R^c, -NR⁷R⁸, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -S(O)₂R^c, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, o haloalcoxi C₁₋₄;

811
5-17

R^6 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-4} , $-CH_2OR^a$, $-C(O)R^c$, $-C(O)_2R^c$, $-S(O)_2R^c$, o $-(CH_2)_r$ fenilo substituido con 0-3 R^d ;

R^7 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , $-(CH_2)_n$ -carbociclo C_{3-10} , $-(CH_2)_n$ -(heteroarilo de 5 hasta 10 miembros), $-C(O)R^c$, $-CHO$, $-C(O)_2R^c$, $-S(O)_2R^c$, $-CONR^bR^c$, $-OCONHR^c$, $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(alquilo C_{1-4}), o $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(arilo C_{6-10}); en donde el alquilo, carbociclo, heteroarilo, y arilo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f ;

R^8 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_r$ -fenilo, o $-(CH_2)_n$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$; en donde el alquilo, fenilo y heterociclo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f ;

alternativamente, R^7 y R^8 , cuando se enlazan al mismo nitrógeno, se combinan para formar un anillo heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 0-2 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-2 R^d ;

R^{8a} es, independientemente cada que se presenta, H, OH, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-4} , (arilo C_{6-10})-alcoxi C_{1-4} , $-(CH_2)_n$ -fenilo, $-(CH_2)_n$ -(heteroarilo de 5 hasta 10 miembros), $-C(O)R^c$, $-C(O)_2R^c$, $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(alquilo C_{1-4}), o $-C(O)O$ -(alquilo C_{1-4}) $OC(O)$ -(arilo C_{6-10}); en donde el fenilo, arilo, y heteroarilo es opcionalmente substituido con 0-2 R^f ;

R^9 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo; en donde el alquilo y fenilo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f ;

R^{9a} es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo;

alternativamente, R^8 y R^9 , cuando se enlazan al mismo nitrógeno, se combinan para formar un anillo heterocíclico de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 0-2 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es substituido con 0-2 R^d ;

R^{10} es H,

R^{11} es $-(CH_2)_rC(O)NR^bR^g$, alquilo C_{1-6} substituido con 0-3 R^{11a} , $-(CR^{14}R^{15})_r$ -carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^{11b} , o $-(CR^{14}R^{15})_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos

700
900

seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{11b};

R^{11a} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, alquilo C₁₋₄, OR^a, CF₃, SR^a, F, CN, NO₂, NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -S(O)_pR^c, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, y substituido con 0-3 R^d;

R^{11b} es, independientemente cada que se presenta, H, =O, =NR⁸, OR^a, F, Cl, Br, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -SOR^c, -SO₂R^c, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -NR⁸C(O)₂R^c, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^d;

R¹² es, independientemente cada que se presenta, H, F, o alquilo C₁₋₄;

R¹³ es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C₁₋₆, -(CH₂)_n-fenilo, -(CH₂)_n-(heteroarilo de 5 hasta 10 miembros), -C(O)R^c, -C(O)OR^c, -CONR⁸R^c, -OCONR⁸R^c, -S(O)₂R^c, -C(O)O-(alquilo C₁₋₄)-OC(O)-(alquilo C₁₋₄), o -C(O)O-(alquilo C₁₋₄)-OC(O)-(arilo C₆₋₁₀); en donde el alquilo, fenilo, heteroarilo, arilo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f;

R¹⁴ y R¹⁵ son, independientemente cada que se presenta, H, F, o alquilo C₁₋₄;

alternativamente, R¹⁴ se combina con R¹⁵ para formar =O;

R^a es, independientemente cada que se presenta, H, CF₃, alquilo C₁₋₆, -(CH₂)_r-cicloalquilo C₃₋₇, -(CH₂)_r-arilo C₆₋₁₀, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p; en donde los grupos cicloalquilo, arilo y heteroarilo son opcionalmente substituidos con 0-2 R^f.

R^b es, independientemente cada que se presenta, CF₃, OH, alcoxi C₁₋₄, alquilo C₁₋₆, -(CH₂)_r-carbociclo C₃₋₁₀ substituido con 0-3 R^d, o -(CH₂)_r-heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^d;

gol
901

R^c es, independientemente cada que se presenta, CF_3 , alquilo C_{1-6} sustituido con 0-2 R^f , cicloalquilo C_{3-6} sustituido con 0-2 R^f , arilo C_{6-10} , heteroarilo de 5 hasta 10 miembros, (arilo C_{6-10})-alquilo C_{1-4} , o (heteroarilo de 5 hasta 10 miembros)-alquilo C_{1-4} , en donde los grupos arilo y heteroarilo son opcionalmente sustituidos con 0-3 R^f ;

R^d es, independientemente cada que se presenta, H, $=O$, $=NR^8$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^7R^8$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, $-(CF_2)_rCF_3$, alquilo C_{1-6} sustituido con 0-2 R^e , alquenilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^e , o alquinilo C_{2-6} sustituido con 0-2 R^e ;

R^e es, independientemente cada que se presenta, $=O$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^8R^9$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, o $-(CF_2)_rCF_3$;

R^f es, independientemente cada que se presenta, H, $=O$, $-(CH_2)_nOR^g$, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^{9a}R^{9a}$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-NR^{9a}C(O)R^a$, $-C(O)NR^{9a}R^{9a}$, $-SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2$ -alquilo C_{1-4} , $-NR^{9a}SO_2CF_3$, $-NR^{9a}SO_2$ -fenilo, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p$ -alquilo C_{1-4} , $-S(O)_p$ -fenilo, $-(CF_2)_rCF_3$, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo;

R^g es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , o $-(CH_2)_n$ -fenilo;

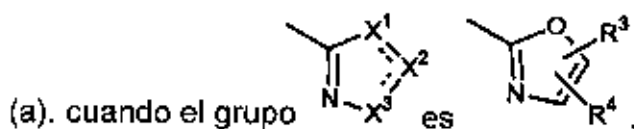
n, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, 2, 3, y 4;

p, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, y 2;

r, cada que se presenta, se selecciona de 0, 1, 2, 3, y 4; y

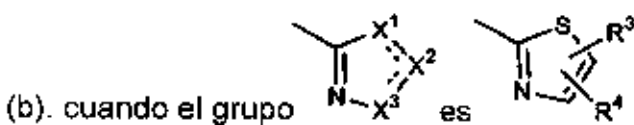
s, cada que se presenta, se selecciona de 1, 2, 3, y 4;

con la condición de que:



i. y cuando L es $-NHC(O)-$, R^{14} no se combina con R^{15} para formar $=O$;

ii. y cuando L es $-C(O)NH-$ y A es fenilo, R^1 no es $-NHC(O)H$;



- i. y cuando L es -NHC(O)- y R^3 se combina con R^4 para formar un anillo fenilo fusionado con el tiazol, el anillo fenilo es substituido con al menos un R^{3a} ;
- ii. y cuando L es -C(O)NH- y A es fenilo, R^1 no es -NHC(O)H ; y
- (c). A no es oxazolinona, tiofeno, oxadiazol o furano substituidos o no substituidos.

13. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque:

A es cicloalquilo C_{3-8} substituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , cicloalqueno C_{4-8} substituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , fenilo substituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , naftilo substituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p , en donde el heterociclo es substituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 ; con la condición de que cuando A es un heterociclo que contiene uno o más átomos de nitrógeno, A no es unido a L por medio de los átomos de nitrógeno en el anillo A;

Z es $\text{-C(R}^{11}\text{)(R}^{12}\text{)-}$;

R^3 es, independientemente cada que se presenta, $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -cicloalquilo C_{3-8} substituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -fenilo substituido con 0-3 R^{3a} y R^{3d} , $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -naftilo substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -indanilo substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , o $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p , en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^4 es H, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN, NO_2 , -C(O)R^a , -C(O)OR^a , $\text{-NR}^7\text{R}^8$, $\text{-C(O)NR}^8\text{R}^9$, $\text{-NR}^7\text{C(O)R}^b$, $\text{-S(O)}_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $\text{-NR}^8\text{S(O)}_p\text{R}^c$, -S(O)R^c , $\text{-S(O)}_2\text{R}^c$, o alquilo C_{1-6} ;

R^6 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C_{1-6} , $\text{-CH}_2\text{OR}^a$, -C(O)R^c , $\text{-C(O)}_2\text{R}^c$, o $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -fenilo substituido con 0-3 R^d ; Y

R^{11} es $\text{-(CH}_2\text{)}_r\text{C(O)NR}^8\text{R}^9$, alquilo C_{1-6} substituido con 0-3 R^{11a} , $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -carbociclo C_{3-10} substituido con 0-3 R^{11b} , o $\text{-(CH}_2\text{)}_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p , en donde el heterociclo es substituido con 0-3 R^{11b} .

14. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque:

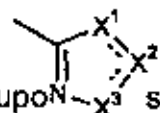
903
9-3

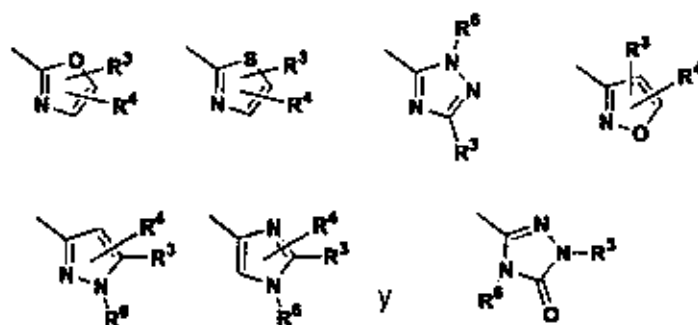
A es cicloalquilo C_{5-6} sustituido con 0-1 R^1 y 0-2 R^2 , cicloalquenilo C_{5-6} sustituido con 0-1 R^1 y 0-2 R^2 , fenilo sustituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , naftilo sustituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 , o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-1 R^1 y 0-3 R^2 ; con la condición de que cuando A es un heterociclo que contiene uno o más átomos de nitrógeno, A no es unido a L por medio a cualquiera de los átomos de nitrógeno en el anillo A;

R^3 es, independientemente cada que se presenta, $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -indanilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ; y

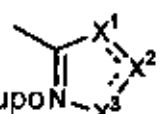
R^6 es, independientemente cada que se presenta, H o alquilo C_{1-6} .

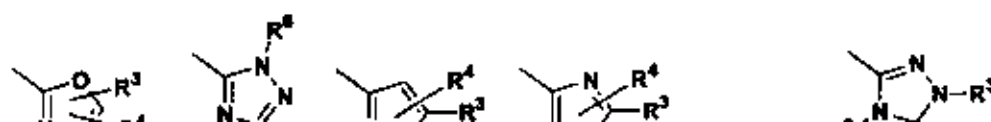
15. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque:

el grupo  se selecciona de:



16. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque:

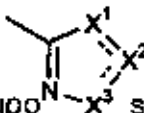
el grupo  se selecciona de:

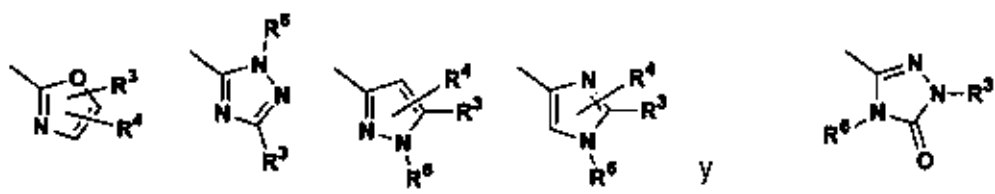


904
704

17. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque:

A es sustituido con 0-1 R^1 y 0-2 R^2 y seleccionados de: cicloalquilo C_{3-7} , fenilo, naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, piridilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, isoquinolinilo, 5,6,7,8-tetrahidroisoquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, quinazolinilo, 1H-quinazolin-4-onilo, 2H-isoquinolin-1-onilo, 3H-quinazolin-4-onilo, 3,4-dihidro-2H-isoquinolin-1-onilo, 2,3-dihidroisoindolinonilo, y ftalazinilo;

el grupo  se selecciona de:



Z es $-\text{CH}(\text{R}^{12})-$;

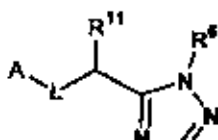
R^3 es, independientemente cada que se presenta, $-(\text{CH}_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r$ -indanilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} o $-(\text{CH}_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y $\text{S}(\text{O})_p$, y sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^4 es, independientemente cada que se presenta, H, =O, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , CN, NO_2 , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$ o alquilo C_{1-6} ;

R^6 es H, alquilo C_{1-6} , o $-(\text{CH}_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-3 R^d ; y

R^{12} es, independientemente cada que se presenta, H, F, o Me.

18. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (VI):



gos
405

o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R^3 es $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-2 R^{3a} , $-(CH_2)_r$ -indanilo sustituido con 0-2 R^{3a} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^6 es, independientemente cada que se presenta, H, alquilo C₁₋₆, $-CH_2OR^a$, $-C(O)R^c$, $-C(O)_2R^c$, o $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-3 R^d ; y

R^{11} es $-(CH_2)_rC(O)NR^8R^9$, alquilo C₁₋₆ sustituido con 0-3 R^{11a} , $-(CH_2)_r$ -carbociclo C₃₋₁₀ sustituido con 0-3 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-3 R^{11b} .

19. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 18, caracterizado porque:

R^1 es, independientemente cada que se presenta, F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t-Bu)$, $-CH(Me)NH_2$, $-CMe_2NH_2$, $-NHet$, $-NHCO_2(t-Bu)$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a , o $-CH_2R^{1a}$;

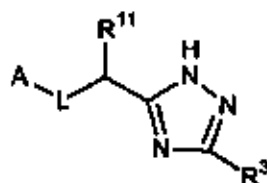
R^3 es $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , naftilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , indanilo sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} , o un $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-2 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-2 R^{3a} y 0-1 R^{3d} ;

R^6 es H; y

R^{11} es alquilo C₁₋₆, $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-(CH_2)_r$ -cicloalquilo C₃₋₇ sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-2 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ -heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N, O, y S(O)_p, en donde el heterociclo es sustituido con 0-2 R^{11b} .

gol
906

20. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 12, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula (VII):



(VII)

o sus estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos del mismo farmacéuticamente aceptable,

A es sustituido con 0-2 R^1 y 0-1 R^2 y seleccionado de: cicloalquilo C_{3-7} , fenilo, naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, piridilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, isoquinolinilo, 5,6,7,8-tetrahidroisoquinolinilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, quinazolinilo, 1H-quinazolin-4-onilo, 2H-isoquinolin-1-onilo, 3H-quinazolin-4-onilo, 3,4-dihidro-2H-isoquinolin-1-onilo, 2,3-dihidroisoindolinonilo, y ftalazinilo;

R^1 es, independientemente cada que se presenta, F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t-Bu)$, $-CH(Me)NH_2$, $-CMe_2NH_2$, $-NHEt$, $-NHCO_2(t-Bu)$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a , o $-CH_2R^{1a}$;

R^3 es fenilo sustituido con 0-2 R^{3a} , naftilo sustituido con 0-2 R^{3a} , indanilo sustituido con 0-2 R^{3a} , o un heterociclo de 5 hasta 10 miembros que comprende: átomos de carbono y 1-2 heteroátomos seleccionados de N, O, y $S(O)_p$, en donde el heterociclo es sustituido con 0-2 R^{3a} ;

R^4 es H, F, Cl, Br, CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , o alquilo C_{1-6} ;

R^{11} es alquilo C_{1-6} , $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-(CH_2)_r$ -cicloalquilo C_{3-7} sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -fenilo sustituido con 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -naftilo sustituido con 0-2 R^{11b} , o $-(CH_2)_r$ -heteroarilo de 5 hasta 10 miembros sustituidos con 0-2 R^{11b} y seleccionados de tiazolilo, oxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, imidazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, indolilo, isoindolilo, indolinilo, isoindolinilo, benzimidazolilo, benzotiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, y tetrahydroisoquinolinilo;

R^{11b} es, independientemente cada que se presenta, H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, OEt, $O(i-Pr)$, OCF_3 , $OCHF_2$, CN, OPh, OBn, NO_2 , $-NH_2$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-NR^7C(O)R^b$, $-NR^8C(O)_2R^c$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^c$, $-SO_2R^c$, alquilo C_{1-4} , Ph, o Bn;

907
907

21. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 19, caracterizado porque:

A es 4-CH₂NH₂-ciclohexilo o 4-amidino-fenilo; y

R³ es fenilo, 3-CN-fenilo, 4-CN-fenilo, 3-Br-fenilo, 4-Br-fenilo, 3-OMe-fenilo, 4-OMe-fenilo, 3-CF₃-fenilo, 4-CF₃-fenilo, 3-CO₂H-fenilo, 4-CO₂H-fenilo, 4-CO₂Me-fenilo, 4-CH₂CO₂H-fenilo, 4-CH₂CO₂Me-fenilo, 3-CONH₂-fenilo, 4-CONH₂-fenilo, 4-CONHMe-fenilo, 4-CON(Me)₂-fenilo, 4-CH₂CONH₂-fenilo, 4-amidino-fenilo, o 2,4-diF-fenilo.

22. Un compuesto, caracterizado porque se selecciona de:

(S)-4-carbamimidoil-N-(2-fenil-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil)benzamida,

(S)-4-(aminometil)-N-(2-fenil-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(4-ciano-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(4-bromo-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(4-metoxi-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(1-bencil-1H-imidazol-4-il)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

éster de metilo del ácido (S)-3-(2-{1-[*trans*-(4-aminometil)-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil}-1H-imidazol-4-il)-benzoico,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(3-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(3-bromo-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(3-clorofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{2-(4-clorofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-2-(2-piridil)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-fenil-1-(4-tiazol-2-il-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-fenil-1-(4-piridin-2-il-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

ácido (S)-[4-(2-{1-[*trans*-(4-Aminometil)-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil}-1H-imidazol-4-il)-fenil]-acético,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[(4-carbamoilmetil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-[4-(2-{1-[(4-aminometil)-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil}-1H-imidazol-4-il)]-benzamida,

(S)-[3-(2-{1-[(4-Aminometil)-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil}-1H-imidazol-4-il)]-benzamida,

(S)-4-(2-(1-*trans*-(4-aminometil)-ciclohexancarboxamido)-2-feniletil)-1H-imidazol-4-il)-N,N-dimetilbenzamida,

(S)-2-(1-*trans*-(4-aminometil)-ciclohexancarboxamido)-2-feniletil)-1H-benzo[d]imidazol-5-carboxamida,

N-(4-carbamimidoilfenil)-3-fenil-2-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)propanamida,

4-(2-(1-(4-carbamimidoilfenilamino)-1-oxo-3-fenilpropan-2-il)-1H-imidazol-4-il)benzamida,

4-(2-(1-(1-aminoisoquinolin-6-ilamino)-1-oxo-3-fenilpropan-2-il)-1H-imidazol-4-il)benzamida,

4-(2-(4-(4-carbamimidoilfenil)-1H-imidazol-2-il)-3-fenilpropanamido)benzamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(2,4-difluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-{1-[4-(4-fluoro-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

ácido (S)-3-(2-(1-*trans*-(4-aminometil)-ciclohexancarboxamido)-2-fenil-etil)-1H-imidazol-4-il)-benzoico,

(S)-N-(1-(4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il)-2-feniletil)-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-[2-[1-[4-(4-(carbamimidoilfenil)-1H-imidazol-2-il)-2-feniletil]-1H-imidazol-4-il]-benzamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-2-(4-piridinil)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]amino]-2-feniletil]-4-(bromo-1H-imidazol-5-il)-benzamida,

ácido (S)-3-[2-[1-[4-(aminometil) ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-1H-imidazol-4-il]-fenilacético,

(S)-3-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-1H-imidazol-4-il]-fenilacetamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[1-[4-(3-hidroxifenil)-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

éster de etilo del ácido (S)-3-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-1H-imidazol-4-il]-fenilacético

2-[4-(4-carbamimidoil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-3,N-difenil-propionamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(4-fluorofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-[4-(benciloxi)fenil]-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(4-benzoilfenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-2-[3-(trifluorometil)fenil]etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(3-nitrofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(2-clorofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(1-naftalenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(2-naftalenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[1-[4,5-bis(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-4-(trifluorometil)-1H-imidazol-5-il]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-[4-(carbamimidoil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-benzamida,

(S)-4-(aminometil)-N-[2-(2-bromofenil)-1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-bromo-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

910
3
910

éster de metilo del ácido (S)-5-[4-(carbamoilfenil)-2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-1H-imidazol-4-carboxílico,

4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-[2-(trifluorometoxi)fenil]etil]-1H-imidazol-4-il]-benzamida,

4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-[2-(difluorometoxi)fenil]etil]-1H-imidazol-4-il]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-[4-(carbamoil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-benzamida,

(S)-N-[1-[4-[4-(carbamoil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-2-fluoro-benzamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-benzamida,

(S)-3-amino-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-1H-indazol-6-carboxamida,

(S)-3-amino-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-1,2-benzisoxazol-6-carboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-2-fluoro-benzamida,

(S)-N-[1-[4-[4-(carbamimidoil)fenil]-1-(2-feniletil)-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-[4-(carbamimidoil)fenil]-1-metil-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-2-fluoro-5-metoxi-benzamida,

(S)-4-[2-[(1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-4-cloro-1H-imidazol-5-il]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-1,4-bencendicarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(2,2-dimetil-1,3-benzodioxol-4-il)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-[3-(difluorometoxi)fenil]etil]-1H-imidazol-4-il]-benzamida,

(S)-4-[2-[1-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]-2-feniletil]-4-fenil-1H-imidazol-5-il]-benzamida,

311
11

(S)-1-amino-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-6-isoquinolincarboxamida,

(S)-1-amino-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-5,6,7,8-tetrahidro-6-isoquinolincarboxamida,

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(3-fenoxifenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(2-fenoxifenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

1-amino-N-[(1S)-1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-5,6,7,8-tetrahidro-(6S)-6-isoquinolincarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(2-nitrofenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(3-nitrofenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(2-aminofenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(3-aminofenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[1,1'-bifenil]-2-iletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[1,1'-bifenil]-3-iletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-1,2,3,4-tetrahidro-6-isoquinolincarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[3-[(fenilsulfonil)amino]fenil]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[2-(2S)-[2-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[[*trans*-[4-(aminometil)ciclohexancarboxamida]etil]fenil]-fenilacetamida,

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[(2S)-2-metil-2-(2-feniletil)-1,3-benzodioxol-4-il]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[(2R)-2-metil-2-(2-feniletil)-1,3-benzodioxol-4-il]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

giz
AR

(S)-4-(aminometil)-N-[1-[4-(4-amino-7-quinazolinil)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[2-[(2S)-2-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[[[*trans*-4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]etil]-fenil]-bencenpropanamida,

(S)-N-1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[2-[(fenilsulfonil)amino]fenil]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[2-(fenilmetoxi)fenil]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-[2-[(2S)-2-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[[[*trans*-4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]etil]fenil]-benzamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(2-bromofenil)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-3,3-dimetilbutil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(R)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-(fenilmetoxi)etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(R)-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-1H-imidazol-2-il]-2-[(fenilmetil)tio]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-4-fluoro-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-5-fluoro-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

éster de metilo del ácido
3-[2-[4-[4-(aminocarbonil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-[[[*trans*-4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]etil]-benzoico

N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-[3-(difluorometoxi)fenil]etil]-4-(aminometil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-3-amino-N-[1-[4-[4-(carbamimidoil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-feniletil]-1H-indazol-5-carboxamida,

ácido 3-[2-[4-[4-(aminocarbonil)fenil]-1H-imidazol-2-il]-2-[[[*trans*-4-(aminometil)ciclohexancarboxamido]etil]-benzoico,

(S)-3-Amino-N-[1-[4-(4-carbamimidoil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-1H-indazol-6-carboxamida,

(S)-N-[1-[4-(4-carbamimidoil-fenil)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-1H-indazol-6-carboxamida,

(S)-N-{1-[4-(4-carbamimidoil-fenil)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-1*H*-indol-6-carboxamida,

(S)-N-{1-[4-(4-carbamimidoil-fenil)-1-etil-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-benzamida,

N¹-{(S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-2-fluoro-tereftalamida,

N¹-{(S)-1-[4-(4-amino-quinazolin-7-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-2-fluoro-tereftalamida,

1-amino-N-[(1S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-(6R)-6-isoquinolincarboxamida,

(S)-1-amino-N-{1-[4-(4-amino-quinazolin-7-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

(S)-1-amino-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-3-metil-isoquinolin-6-carboxamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido)]-2-[3-(piperidin-1-carbonil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido)]-2-[3-(o-tolilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido)]-2-[3-(metil-fenilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido)]-2-[3-(bencilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

(S)-N-{1-[4-(3-amino-7-fluoro-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-5-il)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-{1-[4-(3-hidroxi-1*H*-indazol-5-il)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-aminometil-N-[1-(4-bifenil-4-il-1*H*-imidazol-2-il)-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-aminometil-N-[1-(4-benzo[1,3]dioxol-5-il-1*H*-imidazol-2-il)-2-fenil-etil]-ciclohexancarboxamida,

(S)-4-aminometil-N-[1-(4-naftalen-2-il-1*H*-imidazol-2-il)-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N⁴-{(S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-2-metoxi-tereftalamida,

91k
914

(S)-4-aminometil-N-{1-[4-(3-amino-fenil)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-ciclohexancarboxamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-isobutil-carbamoil-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(3-metil-butilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-terc-butilcarbamoil-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(4-cloro-bencilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(4-cloro-bencilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(4-metoxi-bencilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-fenetilcarbamoil-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-[2-(4-cloro-fenil)-etilcarbamoil]-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-[2-(4-metoxi-fenil)-etilcarbamoil]-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(3-fenil-propilcarbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(bencil-metil-carbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(metil-fenetil-carbamoil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-*m*-tolil-carbamoil-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

915

915

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-*p*-tolil-carbamoi]-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(4-fluoro-fenilcarbamoi)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(naftalen-1-ilcarbamoi)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(4-fenil-piperidin-1-carbonil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(3,4-dihidro-1*H*-isoquinolin-2-carbonil)-fenil]-etil}-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

(S)-N-[1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-(3-bencensulfonilamino-fenil)-etil]-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-{1-[4-(4-benciloxi-fenil)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-1-oxo-1,2-dihidro-isoquinolin-6-carboxamida,

(S)-N-{1-[5-cloro-4-(2,4-diamino-quinazolin-7-il)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

(S)-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-3-amino-1*H*-indazol-5-carboxamida,

4-(2-{(S)-1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarbonil)-amino]-2-fenil-etil}-5-bromo-1*H*-imidazol-4-il)-2-fluoro-benzamida,

4-(2-{(S)-1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarbonil)-amino]-2-fenil-etil}-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-2-fluoro-benzamida,

(S)-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-1-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

(S)-N-[1-(5-metil-4-fenil-1*H*-imidazol-2-il)-2-fenil-etil]-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-(2-{(S)-1-[(4-aminometil-*trans*-ciclohexancarbonil)-amino]-2-fenil-etil}-5-metil-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

gib
916

(S)-N-{1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-metil-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-4-aminometil-*trans*-ciclohexancarboxamida,

1-amino-N-[(S)-1-[4-(4-carbamoil-fenil)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

ácido 1-amino-N-[(S)-1-[4-(4-carbamoil-fenil)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxílico,

1-amino-N-[(S)-1-[4-(4-carbamoil-fenil)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

ácido 1-amino-N-[(S)-1-[4-(4-carbamoil-fenil)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxílico,

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(6-amino-piridin-3-il)-5-metil-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(3-cloro-fenil)-5-metil-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

ácido 5-(2-[(S)-1-[4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil]-5-metil-1*H*-imidazol-4-il)-tiofen-2-carboxílico,

5-(2-[(S)-1-[4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil]-5-metil-1*H*-imidazol-4-il)-tiofen-2-carboxamida,

N⁴-[(S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-2-fenoximetil-tereftalamida,

N-[(S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-4-aminometil-2-bencil-benzamida,

6(S)-1-amino-N-[(S)-1-[5-cloro-4-(4-ciano-fenil)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

6(R)-1-amino-N-[(S)-1-[5-cloro-4-(4-ciano-fenil)-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida,

N-[(S)-1-[4-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-5-cloro-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-4-metil-benzamida,

4-(2-[(S)-2-(3-acetilamino-fenil)-1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[5-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-1*H*-imidazol-2-il]-3-[(5-metil-pirazin-2-ilmetil)-carbamoil]-propil]-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[5-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-1*H*-imidazol-2-il]-3-(bencil-metil-carbamoi)-propil]-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[5-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-1*H*-imidazol-2-il]-3-(bencil-carbamoi)-propil]-ciclohexancarboxamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(etil-metil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(isopropil-metil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(isobutil-metil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(metil-fenil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(etil-fenil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(metil-*m*-toluil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-(metil-*p*-toluil-carbamoi)-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-[(3-cloro-bencil)-metil-carbamoi]-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-[(4-cloro-bencil)-metil-carbamoi]-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-[2-(2-cloro-fenil)etilcarbamoi]-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-[2-(3-cloro-fenil)etilcarbamoi]-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido)-2-[3-[2-(4-cloro-fenil)etilcarbamoi]-fenil]-etil]-5-cloro-1*H*-imidazol-4-il)-benzamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(4-metansulfonilamino-fenil)-5-metil-1*H*-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[5-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-1*H*-imidazol-2-il]-3-(ciclopropilmetil-carbamoi)-propil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[5-(3-amino-1*H*-indazol-6-il)-1*H*-imidazol-2-il]-3-(2-fenil)etil-carbamoi]-propil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

918
918

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(4-acetilamino-fenil)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(4-hidroxí-fenil)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-[2-(1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-[metil-(2-piridin-2-il-etil)-carbamoil]-fenil]-etil)-5-cloro-1H-imidazol-4-il]-benzamida,

4-(2-[1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(2,3-dihidro-indol-1-carbonil)-fenil]-etil]-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-[1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(1,3-dihidro-isoindol-2-carbonil)-fenil]-etil]-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-[1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(2,3-dihidro-1,4-benzoxazin-4-carbonil)-fenil]-etil]-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-[1-[(4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(6-metil-3,4-dihidro-2H-quinolin-1-carbonil)-fenil]-etil]-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-aminometil-N-[(S)-1-[4-(1H-indazol-6-il)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

7-amino-N-[(S)-1-[4-(3-amino-7-fluoro-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-5,6,7,8-tetrahidro-isoquinolin-6-carboxamida;

4-aminometil-N-[1-[4-(1H-indazol-6-il)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[1-[4-(3-acetilamino-fenil)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

ácido 5-(2-[1-[*trans*-4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil]-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-tiofen-2-carboxílico,

N1-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-2-cloro-tereftalamida,

4-aminometil-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-3-[(tiazol-2-ilmetil)-carbamoil]-propil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-3-[(piridin-2-ilmetil)-carbamoil]-propil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-[1-[5-metil-4-(3-oxo-2,3-dihidro-1H-isoindol-5-il)-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil]-*trans*-ciclohexancarboxamida,

éster de metilo del ácido[4-(2-[1-[*trans*-4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-fenil-etil]-5-metil-1H-imidazol-4-il)-fenil]-carbámico,

9/19
9/19

4-(2-{1-[*trans*-4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(metil-fenil-sulfamoyl)-fenil]-etil}-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[*trans*-4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-(3-bencensulfonil-metil-amino-fenil)-etil}-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-(2-{1-[*trans*-4-aminometil-ciclohexancarboxamido]-2-[3-(benzoyl-metil-amino)-fenil]-etil}-5-cloro-1H-imidazol-4-il)-benzamida,

4-aminometil-N-{1-[4-(1-imino-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-ftalazin-6-il)-5-metil-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-*trans*-ciclohexancarboxamida,

4-aminometil-N-(1-{5-metil-4-[3-(2H-tetrazol-5-il)-fenil]-1H-imidazol-2-il}-2-fenil-etil)-*trans*-ciclohexancarboxamida,

N-{1-[4-(3-amino-1H-indazol-6-il)-5-cloro-1H-imidazol-2-il]-2-fenil-etil}-2-fluoro-4-metil-benzamida,

o estereoisómeros, tautómeros, sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de los mismos.

23. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende: un portador farmacéuticamente aceptable y una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-22.

24. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-22, caracterizado porque es para su uso en la terapia.

25. El uso de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-22, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de un trastorno tromboembólico o inflamatorio.

26. El uso de acuerdo con la reivindicación 25, en donde el desorden trombótico se selecciona del grupo que consiste de desordenes tromboembólicos cardiovasculares, desordenes tromboembólicos cardiovasculares venosos, y desordenes tromboembólicos en las cámaras del corazón.

27. El uso de acuerdo con la reivindicación 25, en donde el desorden tromboembólico se selecciona de angina inestable, un síndrome coronario agudo, fibrilación atrial, primer infarto del miocardio, infarto del miocardio

920
920

recurrente, muerte súbita isquémica, ataque isquémico *transitorio*, paro cardíaco, arteroesclerosis, enfermedad oclusiva periférica arterial, trombosis venosa, trombosis venosa profunda, tromboflebitis, embolia arterial, trombosis arterial coronaria, trombosis arterial cerebral, embolia cerebral, embolia renal, embolia pulmonar, y trombosis resultante de (a) válvulas prostéticas u otros implantes, (b) catéteres insertados, (c) sondas, (d) desviaciones cardiopulmonares, (e) hemodiálisis, o (f) otros procedimientos en los cuales la sangre es expuesta a una superficie artificial que promueve la trombosis.

