

837/60

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-007227- -00001-0000

Fecha: 2008-01-25 15:16:21 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11. PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 60

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1. SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una Solicitud

SOLICITANTE

Nombre:

Exelixis, Inc.

Dirección 210 East Grand Avenue, P.O. Box 511
South San Francisco, California

Nacionalidad o Domicilio:

South San Francisco, California 94083-0511, US

Lugar de Constitución:

DELAWARE

Teléfono

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual _____

Número: _____

3. REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **CARLOS ORLANDO MAYA
RODRIGUEZ**

Dirección: **Cr. 13 A No 28-38, Mz 2**

Bufete 245. Parque Central Bavaria

Teléfono **3419841** Fax: **3368592**

E-mail: **carlos.tamayo@tmtamayo.net**

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual _____

Número: **17.117.818** TP: **17.402**

4. Número de expediente:

08-007227

5.

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

EXPUESTO EN LA MEMORIA DESCRIPTIVA.

SE ANEXAN 43 NUEVAS REIVINDICACIONES

6.

Comprobante de pago No. **08-6,814** Fecha **Enero 25/2008**

7. Anexos

☒ Comprobante de pago de la tasa.

☐ Poderes, si fuere el caso

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

8.

NOMBRE:

CARLOS ORLANDO MAYA RODRIGUEZ

FIRMA:

C.C. **17.117.818** TP **17.402**

856²

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-007227- -00001-0000

Fecha: 2008-01-25 15:16:21 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 60

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 6,814
FECHA : ENERO 25 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CARLOS TAMAYO Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	1921259	25/01/2008	1,279,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

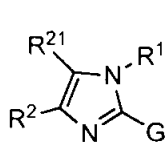
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

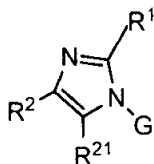
B

857

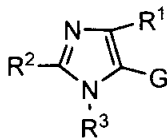
I. A compound according to one of the following formulas,



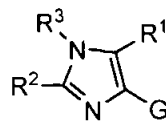
IIa



IIb



IIc



IIId

or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof, wherein,

(A) R^1 is $-L^1-R^5$, wherein

L^1 is a bond, L^5 , L^6 , $-L^5-L^6-L^5-$, or $-L^6-L^5-L^6-$, wherein

each L^5 is independently $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein

each R^{15} is independently hydrogen, halogen, (C_1-C_6) alkyl, (C_3-C_6) cycloalkyl, or (C_1-C_6) haloalkyl; and

each L^6 is independently $-CS-$, $-CO-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-CON(R^{11})-$, $-CONR^{11}N(R^{11})-$, $-C(=NR^{11})-$, $-C(=NOR^{11})-$, or $-C(=NN(R^{11})_2)-$, $-aryl-$, $-C_3-C_8$ cycloalkyl-, $-heteroaryl-$, or $-heterocyclyl-$;

wherein the aryl, cycloalkyl, heteroaryl, or heterocyclyl is optionally substituted with one or more R^{14} ;

or each L^6 is independently C_2-C_6 alidiyl,

wherein the alidiyl chain is optionally interrupted by $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, or $-SO_2N(R^{10})$; and

R^5 is aryl, heterocyclyl, heteroaryl, $-(C_3-C_6)$ cycloalkyl, $-C$, or $-B-C$,

wherein

B is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3-C_8$ cycloalkyl-; and

C is halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-SR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, or $-N(R^{11})_2$,

wherein R^5 is optionally substituted with one or more R^{5a} , wherein

each R^{5a} is independently halogen, nitro, heteroaryl, heterocyclyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_8 cycloalkyl, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkenyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_2-C_6 alkenyl-, aryl, arylalkyl, aryloxy, aryloxyaryl, aryl- C_{1-6} alkoxy, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $SO_2NR^{11}COR^{11}$,

4
898

$C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $CON(R^{11})OR^{11}$, $OCON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$, $NR^{11}CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COOR^{11}$, or $N(R^{11})_2$, wherein

each R^{5a} is optionally substituted with one or more groups which independently are -halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, aryloxy C_{0-6} alkyl SO_2R^{11} , C_{0-6} alkyl $COOR^{11}$, C_{0-6} alkoxyaryl, C_1-C_6 haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-CON(R^{11})OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}CON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, or $-N(R^{11})_2$;

R^2 and R^{21} are $-L^3-R^7$, wherein

each L^3 is independently a bond or $-(CH_2)_m-V^1-(CH_2)_n-$, wherein

n is 0-6; and

V^1 is $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-NR^{11}-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-OCO-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CONR^{10}-$, $-C(=N-R^{11})-$, $-C(=N-OR^{11})-$, $-C[=N-N(R^{11})_2]$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, $-SO_2N(R^{10})-$, $-NR^{10}CONR^{10}-$, $-NR^{10}CSNR^{10}-$, C_3-C_6 cycloalkyl, or C_3-C_6 cyclohaloalkyl;

or each L^3 is independently C_2-C_6 alidiyl,

wherein the alidiyl chain is optionally interrupted by $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-NR^{11}-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, or $-SO_2N(R^{10})-$; and

each R^7 is independently hydrogen, halogen, nitro, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-Z$, $-Y-Z$, or $-X-Y-Z$, wherein

X is $-O-$;

Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$, C_2-C_6 alkenyl, or $-C_3-C_8$ cycloalkyl; and

Z is $-H$, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, or $-OC(=O)-N(R^{11})_2$,

wherein R^7 is optionally substituted with one or more R^{7a} , wherein

R^{7a} is halogen, haloaryl, aryloxy, alkoxy, aryloxyalkyl, aryl C_{0-6} alkylcarboxy, $C(R^{11})=C(R^{11})-COOH$, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, heterocycloxy, heteroaryloxy, $-Z'$, $-Y'-Z'$, or $-X'-Y'-Z'$, wherein

X' is $-O-$;

Y' is $-\text{C}(\text{R}^{15})_2\text{m}-$ or $-\text{C}_3\text{-C}_8\text{cycloalkyl}$; and

Z' is $-\text{H}$, halogen, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{11})\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{OR}^{11})$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{-R}^{11}$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{-OR}^{11}$, $-\text{N}(\text{R}^{11})\text{C}(=\text{O})\text{-R}^{11}$, or $-\text{N}(\text{R}^{11})\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{11}$,

wherein each R^{7a} is optionally substituted with one or more R^8 ,

wherein each R^8 is independently halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkoxy, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl(OR^{11}), $\text{C}_0\text{-C}_6$ alkyl OR^{11} , $\text{C}_0\text{-C}_6$ alkyl $\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{C}_0\text{-C}_6$ alkyl COR^{11} , $\text{C}_0\text{-C}_6$ alkyl COOR^{11} , or $\text{C}_0\text{-C}_6$ alkyl SO_2R^{11} ,

provided that R^2 and R^{21} are not simultaneously hydrogen;

R^3 is $-\text{L-R}^6$, wherein

L is a bond, $-\text{X}^3\text{-(CH}_2)_n\text{-X}^3$, $-(\text{CH}_2)_m\text{-X}^3\text{-(CH}_2)_n-$ or $-(\text{CH}_2)_{1+w}\text{-Y}^3\text{-(CH}_2)_w-$, wherein

n is 0-6; each w is independently 0-5; and

each X^3 is independently a bond, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{11})-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CS}-$, $-\text{CONR}^{10}-$, $-\text{C}(=\text{N})(\text{R}^{11})-$, $-\text{C}(=\text{N-OR}^{11})-$, $-\text{C}[=\text{N-N}(\text{R}^{11})_2]$, $-\text{CO}_2-$, $-\text{SO}_2-$, or $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})-$; and

Y^3 is $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{NR}^7-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}_2-$, $-\text{OCO}-$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{NR}^{10}\text{CONR}^{10}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{SO}_2-$, or $-\text{NR}^{10}\text{CSNR}^{10}-$;

or L is C_{2-6} aldiyl chain wherein the aldiyl chain is optionally interrupted by $-\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{11})-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{O}-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{NR}^{11}-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}_2-$, $-\text{CON}(\text{R}^{10})-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CO}_2-$, $-\text{OC}(=\text{O})-$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{SO}_2-$, or $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})$; and

R^6 is $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, aryl, $\text{C}_3\text{-C}_8$ cycloalkyl, heteroaryl, heterocyclyl, $-\text{CN}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, or $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{OR}^{11})$, wherein

the aryl, heteroaryl, cycloalkyl, or heterocyclyl is optionally substituted with one or more R^{6a} , wherein

each R^{6a} is independently $-\text{Z}''$, $-\text{Y}''\text{-Z}''$, or $-\text{X}''\text{-Y}''\text{-Z}''$, wherein

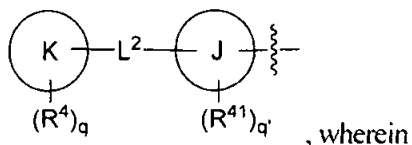
X'' is $-\text{O}-$;

Y'' is $-\text{C}(\text{R}^{15})_2\text{m}-$, $-\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl, $\text{C}_3\text{-C}_8$ cycloalkyl, heterocyclyl, aryl, or heteroaryl, wherein

the aryl, heteroaryl, cycloalkyl, or heterocyclyl is optionally substituted with at least one group which is each independently Z'' ;

Z'' is -H, -CN, halogen, -OR¹¹, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -N(R¹¹)₂, -N₃, -SO₂R¹¹, -S(=O)₂N(R¹¹)₂, -C(=O)N(R¹¹)N(R¹¹)₂, -N(R¹¹)C(=O)N(R¹¹)₂, -OC(=O)-OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)(OR¹¹), -OC(=O)-R¹¹, -OC(=O)-N(R¹¹)₂, or -N(R¹¹)COOR¹¹; and

G is a group of the formula,



J is aryl, heteroaryl, or absent;

K is aryl, heteroaryl, or absent;

provided that

(i) if K is absent, then q is 1 and R⁴ is bonded directly to L²; and

each R⁴ and R⁴¹ is independently halogen, oxo, nitro, CR¹¹=CR¹¹COOR¹¹, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, arylC₀-C₆ alkylcarboxy, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, heteroaryloxy, heterocyclxyloxy, -G¹, -E-G¹ or -D-E-G¹, wherein

D is -O-;

E is -[C(R¹⁵)₂]_m- or -C₃-C₈cycloalkyl; and

G¹ is -C₁-C₆alkyl, -C₁-C₆haloalkyl, -COR¹¹, -COOR¹¹, -CON(R¹¹)₂, -C≡N, -OR¹¹, -OCON(R¹¹)₂, -OCOOR¹¹, -N₃, -NR¹¹COR¹¹, -NR¹¹SO₂R¹¹, -N(R¹¹)₂, -NR¹¹COOR¹¹, -SO₂R¹¹, -SO₂NR¹¹COR¹¹, -SO₂N(R¹¹)₂, -SOR¹¹, or -SR¹¹;

wherein each R⁴ is optionally substituted with one or more R^{4a},

wherein each R^{4a} is independently halogen, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl,

C₁-C₆alkoxyaryl, arylC₀-C₆alkylcarboxy, -G', -E'-G', or -D'-E'-G', wherein

D' is -O-;

E' is -[C(R¹⁵)₂]_m- or -C₃-C₈cycloalkyl; and

G' is -H, -halogen, -COR¹¹, -COOR¹¹, -C≡N, -OR¹¹, -NR¹¹SO₂R¹¹, -SO₂R¹¹, -SO₂N(R¹¹)₂, or -SR¹¹;

L² is a bond or -[C(R¹⁵)₂]_m-V²-[C(R¹⁵)₂]_n-, wherein

V² is independently -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -SO₂-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -CON(R¹⁰)-,

-CON(R¹¹)-, -CON(R¹¹)O-, -CO-, -CS-, -CO₂-, -OC(=O)-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -N(R¹⁰)SO₂-,
-SO₂N(R¹⁰)-, -NR¹⁰CONR¹⁰-, -NR¹⁰CSNR¹⁰-, C₃-C₆cycloalkyl-, or C₃-C₆cyclohaloalkyl,

or V² is C₂₋₆ alidiyl,

wherein alidiyl chain is optionally interrupted by -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-,
-C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -N(R¹⁰)CO-,
-N(R¹⁰)CO₂-, -CON(R¹⁰)-, -CON(R¹¹)-, -CON(R¹¹)O-, -CO-, -CO₂-, -OC(=O)-,
-OC(=O)N(R¹⁰)-, -SO₂-, -N(R¹⁰)SO₂- or -SO₂N(R¹⁰)-

or V² is aryl, heteroaryl, or heterocyclyl, each of which is optionally substituted with one or more R⁹, wherein

each R⁹ is independently halogen, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkyloxy,
C₀-C₆ alkyl or C₁-C₆ alkylCOOR¹¹;

each m is 0, 1, 2, 3, 4, 5, or 6;

q is 0, 1, 2, 3, 4, or 5, provided that q is 0 if and only if K is not phenyl; and

q^{*} is 0, 1, 2, 3, or 4,

each R¹⁰ is independently -R¹¹-, -C(=O)R¹¹-, -CO₂R¹¹-, or -SO₂R¹¹;

each R¹¹ is independently -hydrogen, -C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₈ cycloalkyl, (C₃-C₈
cycloalkyl)-C₁-C₆ alkyl-, (C₃-C₈ cycloalkenyl)-C₁-C₆ alkyl-, (C₃-C₈ cycloalkyl)-C₂-C₆ alkenyl-, -C₁-C₆ haloalkyl,
-N(R¹²)₂, aryl, -(C₁-C₆)alkyl-aryl, heteroaryl, -(C₁-C₆)alkyl-heteroaryl, heterocyclyl, or
-(C₁-C₆)alkyl-heterocyclyl,

wherein any of R¹¹ is optionally substituted with one or more radicals of R¹²;

each R¹² is independently halogen, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, (C₀-C₆
alkyl)C=O(OR¹³); C₀-C₆ alkylOR¹³, C₀-C₆ alkylCOR¹³, C₀-C₆ alkylSO₂R¹³, C₀-C₆
alkylCON(R¹³)₂, C₀-C₆ alkylCONR¹³OR¹³, C₀-C₆ alkylSO₂N(R¹³)₂, C₀-C₆ alkylSR¹³,
C₀-C₆ haloalkylOR¹³, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, C₀₋₆alkoxyaryl, arylC₀₋₆
alkylcarboxy, -C₀-C₆ alkylN(R¹³)₂, -NR¹³SO₂ R¹³, or -OC₀₋₆ alkylCOOR¹³;

each R¹³ is independently hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₈ cycloalkyl, (C₃-C₈
cycloalkyl)-C₁-C₆ alkyl-, (C₃-C₈ cycloalkenyl)-C₁-C₆ alkyl-, or (C₃-C₈ cycloalkyl)-C₂-C₆ alkenyl-;

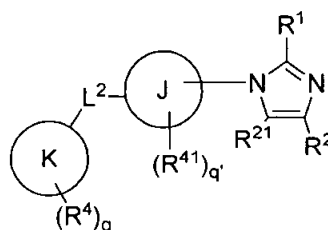
each R¹⁴ is independently C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, halogen, C₁-C₆ haloalkyl, C₀-C₆ alkylCON(R¹¹)₂,
C₀-C₆ alkylCONR¹¹OR¹¹, C₀-C₆ alkylOR¹¹, or C₀-C₆ alkylCOOR¹¹; and

(B) provided that

(i) when L² is a bond, both J and K are not absent;

- (ii) if the compound is defined by formula IIa, then
- if J is phenyl and K is thienyl, furyl, or thiazoyl and q is 0, then R¹ is not 4-(NH₂SO₂)phenyl, 4-(NH₂SO₂)-3-fluorophenyl, p-(CH₃SO₂)phenyl-, or 4p-(CH₃SO₂)-3-fluorophenyl-; and
 - if R⁵ is pyridyl or phenyl optionally substituted with one or more R^{5a} and L¹ is a bond, then G is not p-(NH₂SO₂)phenyl or p-(CH₃SO₂)phenyl-;
- (iii) if the compound is defined by formula IIc or IId, then G is not p-(NH₂SO₂)phenyl or p-(CH₃SO₂)phenyl-;
- (iv) the compound is not 1-(biphenyl-4-yl)-2,5-diphenyl-1H-imidazole.

2. The compound according to claim 1, of the formula,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof, wherein

L¹ is a bond;

R⁵ is aryl optionally substituted with one or more R^{5a};

R²¹ is hydrogen, halogen, nitro, cyano, C₁-C₆alkyl, or C₁-C₆haloalkyl.

3. The compound according to claim 2, wherein L² is a bond.

4. The compound according to claim 2, wherein

R¹ is -L¹-R⁵, wherein

L¹ is a bond, -[C(R¹⁵)₂]_m-, or -C₃-C₈ cycloalkyl-; and

R⁵ is phenyl or pyridyl, each optionally substituted with one or two R^{5a}, wherein

each R^{5a} is independently -halogen, -C₁-C₆ alkoxy, -C₁-C₆ alkyl, or -C₁-C₆ haloalkyl;

R² and R²¹ are each independently -H, -[C(R¹⁵)₂]_m-OH, -C₁-C₆ alkyl, -C₁-C₆ haloalkyl, halogen, -C(O)N(R¹¹)₂, or -COOR¹¹;

L² is a bond;

J is phenyl, pyridyl, or thienyl;

K is phenyl, or pyridyl;

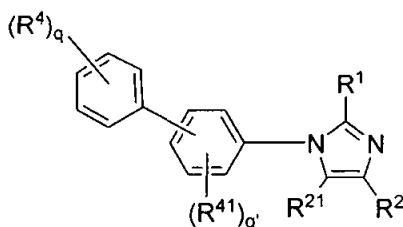
each R^{41} is -halogen, -C₁-C₆ alkyl, or C₁-C₆ haloalkyl; and

each R^4 is -halogen, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-C(O)N(R^{11})_2$, $-COOR^{11}$, -C₁-C₆ alkyl, or -C₁-C₆ haloalkyl.

5. The compound according to claim 2, wherein at least one of J and K is phenyl.

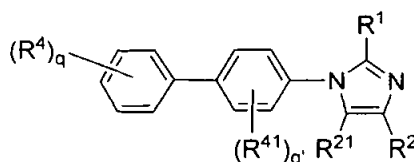
6. The compound according to claim 5, wherein J and K are both phenyl.

7. The compound according to claim 6, of the formula,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof.

8. The compound according to claim 7, of the formula,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof, wherein R^{21} is -H, -halogen, -C₁-C₆alkyl, or -C₁-C₆haloalkyl.

9. The compound according to claim 8, wherein

each R^4 is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-G^1$, or $-E-G^1$, wherein

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^1 is -C₁-C₆alkyl, -C₁-C₆haloalkyl, halogen, $-OR^{11}$, or $-SO_2R^{11}$.

10. The compound according to claim 8, wherein

each R^{41} is independently halogen, $-G^2$, or $-E-G^2$, wherein

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^2 is -C₁-C₆alkyl, -C₁-C₆haloalkyl, or halogen;

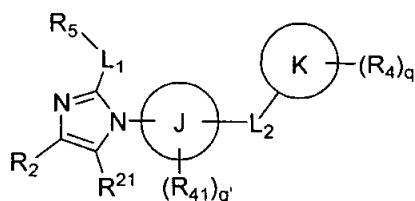
and

70
864

each R^4 is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-G^1$, or $-E-G^1$, wherein
 E is $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and
 G^1 is $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, halogen, $-OR^{11}$, or $-SO_2R^{11}$.

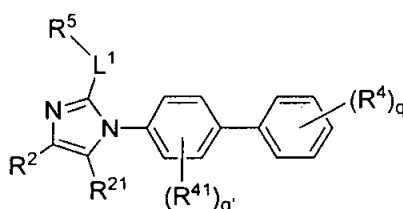
11. The compound according to claim 9, wherein R^2 is $-L^3-R^7$, wherein
 L^3 is a bond; and
 R^7 is hydrogen, halogen, $-Z$, or $-Y-Z$, wherein
 Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or C_2-C_6 alkenyl,
wherein each R^{15} is independently H, halogen, or (C_1-C_6) alkyl; and
 Z is $-H$, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, or
 $-C(=S)N(R^{11})_2$.
12. The compound according to claim 8, wherein each R^{5a} is independently halogen, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6
haloalkyl, C_3-C_8 cycloalkyl, OR^{11} , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$,
 $NR^{11}COR^{11}$, or $N(R^{11})_2$.
13. The compound according to claim 8, wherein
 R^2 is $-L^3-R^7$, wherein
 L^3 is a bond; and
 R^7 is hydrogen, halogen, or $-[C(R^{15})_2]-Z$, wherein
each R^{15} is independently H, halogen, or (C_1-C_2) alkyl; and
 Z is $-H$, halogen, $-OR^{11''}$, $-C(=O)R^{11''}$, $-C(=O)OR^{11''}$, $-C(=O)N(R^{11''})_2$, $-C(=N-OH)R^{11''}$, or
 $-C(=S)N(R^{11''})_2$,
wherein $R^{11''}$ is $-H$ or $-(C_1-C_6$ alkyl).
14. The compound according to claim 8, wherein R^2 is $-halogen$, $-CF_3$, $-CH_2OH$, or $-C(CH_3)_2OH$.
15. The compound according to claim 1, wherein
 L_1 is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3-C_8$ cycloalkyl; wherein m' is any of 1 to 3; and
each R^{15} is independently hydrogen, halogen, (C_1-C_6) alkyl, or (C_1-C_6) haloalkyl; and
 R^{21} is hydrogen, halogen, nitro, cyano, C_1-C_6 alkyl, or C_1-C_6 haloalkyl.
16. The compound according to claim 15, of the formula,

77
865



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof.

17. The compound according to claim 16, wherein at least one of J and K is phenyl.
18. The compound according to claim 17, wherein J and K are both phenyl.
19. The compound according to claim 18, wherein L₂ is a bond.
20. The compound according to claim 19, of the formula,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof.

21. The compound according to claim 20, wherein
each R¹⁵ is independently -H or -(C₁-C₂)alkyl;
m' is 1 or 2; and
R⁵ is phenyl optionally substituted with one or more R^{5a}.
22. The compound according to claim 21, wherein
R² is -L³-R⁷, wherein
L³ is a bond; and
R⁷ is hydrogen, halogen, -Z, or -Y-Z, wherein
Y is -[C(R¹⁵)₂]_m- or C₂-C₆alkenyl,
wherein each R¹⁵ is independently H, halogen, or (C₁-C₆)alkyl; and
Z is -H, halogen, -OR¹¹, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -C(=N-OH)R¹¹, or
-C(=S)N(R¹¹)₂.
23. The compound according to claim 21, wherein
each R⁴ is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, -G¹, or -E-G¹, wherein

72
866

E is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and
 G^1 is $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{haloalkyl}$, halogen, $-\text{OR}^{11}$, or $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$.

24. The compound according to claim 21, wherein
 each R^{41} is independently halogen, $-\text{G}^1$, or $-\text{E-G}^1$, wherein

E is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and
 G^1 is $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{haloalkyl}$, or halogen.

25. The compound according to claim 20, wherein

R^{15} is $-\text{H}$;

m is 1, 2, or 3; and

R^5 is heterocyclyl optionally substituted with one or more R^{5a} .

26. The compound according to claim 25, wherein

R^2 is $-\text{L}^3\text{-R}^7$, wherein

L^3 is a bond; and

R^7 is hydrogen, halogen, $-\text{Z}$, or $-\text{Y-Z}$, wherein

Y is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$ or $\text{C}_2\text{-C}_6\text{alkenyl}$,

wherein each R^{15} is independently H, halogen, or $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$; and

Z is $-\text{H}$, halogen, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{C(=O)R}^{11}$, $-\text{C(=O)OR}^{11}$, $-\text{C(=O)N(R}^{11})_2$, $-\text{C(=N-OH)R}^{11}$, or
 $-\text{C(=S)N(R}^{11})_2$.

27. The compound according to claim 25, wherein

each R^4 is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-\text{G}^1$, or $-\text{E-G}^1$, wherein

E is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^1 is $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{haloalkyl}$, halogen, $-\text{OR}^{11}$, or $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$.

28. The compound according to claim 25, wherein

each R^{41} is independently halogen, $-\text{G}^1$, or $-\text{E-G}^1$, wherein

E is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^1 is $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl}$, $-\text{C}_1\text{-C}_6\text{haloalkyl}$, or halogen.

29. The compound according to claim 20, wherein

each R^{15} is independently $-\text{H}$ or $-(\text{C}_1\text{-C}_2)\text{alkyl}$;

m' is 1 or 2; and

R^5 is heteroaryl optionally substituted with one or more R^{5a} .

30. The compound according to claim 29, wherein

R^2 is $-L^3-R^7$, wherein

L^3 is a bond; and

R^7 is hydrogen, halogen, $-Z$, or $-Y-Z$, wherein

Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or C_2-C_6 alkenyl,

wherein each R^{15} is independently H, halogen, or (C_1-C_6) alkyl; and

Z is $-H$, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, or $-C(=S)N(R^{11})_2$.

31. The compound according to claim 29, wherein

each R^4 is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-G^1$, or $-E-G^1$, wherein

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^1 is $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, halogen, $-OR^{11}$, or $-SO_2R^{11}$.

32. The compound according to claim 29, wherein

each R^{41} is independently halogen, $-G^1$, or $-E-G^1$, wherein

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and

G^1 is $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, or halogen.

33. The compound according to claim 1, wherein

R^1 is $-L^1-R^5$, wherein

L^1 is a bond, $-[C(R^{15})_2]_m-$, or $-C_3-C_8$ cycloalkyl; and

R^5 is phenyl or pyridyl, each optionally substituted with one or two R^{5a} , wherein

each R^{5a} is independently $-halogen$, $-C_1-C_6$ alkoxy, $-C_1-C_6$ alkyl, or $-C_1-C_6$ haloalkyl;

R^2 , R^{21} , and R^3 are each independently $-H$, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, halogen, $-C(O)N(R^{11})_2$, or $-COOR^{11}$;

L^2 is a bond;

J is phenyl, pyridyl, or thienyl;

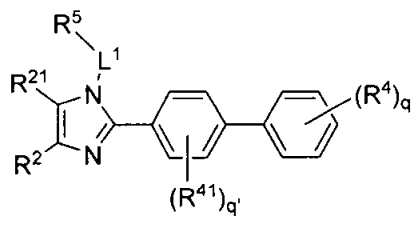
K is phenyl, or pyridyl;

each R^{41} is $-halogen$, $-C_1-C_6$ alkyl, or C_1-C_6 -haloalkyl; and

869

each R^4 is -halogen, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-C(O)N(R^{11})_2$, $-COOR^{11}$, $-C_1-C_6$ alkyl, or $-C_1-C_6$ haloalkyl.

34. The compound according to claim 15 of the formula,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof, wherein each R^{15} is independently $-H$ or $-(C_1-C_2)alkyl$; m' is 1 or 2; and R^5 is heteroaryl optionally substituted with one or more R^{5a} .

35. The compound according to claim 34, wherein R^2 is $-L^3-R^7$, wherein

L^3 is a bond; and R^7 is hydrogen, halogen, $-Z$, or $-Y-Z$, wherein Y is $-[C(R^{15})_2]_{m'}$ or $C_2-C_6alkenyl$, wherein each R^{15} is independently H , halogen, or $(C_1-C_6)alkyl$; and Z is $-H$, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, or $-C(=S)N(R^{11})_2$.

36. The compound according to claim 34, wherein each R^4 is independently halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-G^1$, or $-E-G^1$, wherein E is $-[C(R^{15})_2]_{m'}$, wherein each R^{15} is independently hydrogen or halogen; and G^1 is $-C_1-C_6alkyl$, $-C_1-C_6haloalkyl$, halogen, $-OR^{11}$, or $-SO_2R^{11}$.

37. The compound according to claim 1, wherein R^1 is $-L^1-R^5$, wherein L^1 is a bond, L^5 , L^6 , $-L^5-L^6-L^5-$, or $-L^6-L^5-L^6-$, wherein each L^5 is independently $-[C(R^{15})_2]_{m'}$, wherein m is 0, 1, 2, 3, or 4; and each R^{15} is independently hydrogen, halogen, $(C_1-C_6)alkyl$, or $(C_1-C_6)haloalkyl$; and L^6 is $-CO-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-CON(R^{11})-$, $-C_3-C_6cycloalkyl-$, or $-heterocyclyl-$.

wherein the cycloalkyl, or heterocyclyl is optionally substituted with one or more R^{14} ;
and

R^5 is aryl, heterocyclyl, heteroaryl, -C, or -B-C, wherein

B is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3-C_6$ cycloalkyl-; and

C is halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, or $-C_1-C_6$ haloalkyl;

wherein R^5 is optionally substituted with one or more R^{5a} , wherein

each R^{5a} is independently halogen, nitro, heteroaryl, heterocyclyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkenyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_2-C_6 alkenyl-; aryl, arylalkyl, aryloxy, aryloxyaryl, aryl C_{1-6} alkoxy, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_3-C_6 cycloalkyl, SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $SO_2NR^{11}COR^{11}$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $CON(R^{11})OR^{11}$, $OCON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$, $NR^{11}CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COOR^{11}$, or $N(R^{11})_2$, wherein

each R^{5a} is optionally substituted with one or more groups which independently are
-halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, aryloxy C_{0-6} alkyl SO_2R^{11} , C_{0-6} alkyl $COOR^{11}$, C_{0-6} alkoxyaryl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-CON(R^{11})OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}CON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, or $-N(R^{11})_2$;

R^2 is L^3-R^7 , wherein

L^3 is a bond wherein and

R^7 is, halogen, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, -Z, or -Y-Z, wherein

Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3-C_6$ cycloalkyl; and

Z is -H, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, or $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$;

wherein R^7 is optionally substituted with one or more R^{7a} , wherein

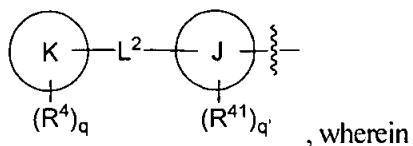
R^{7a} is halogen -Z', -Y'-Z', or -X'-Y'-Z', wherein

X' is -O-;

Y' is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3-C_6$ cycloalkyl; and

Z' is -H, halogen, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-S(=O)_2R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, or $-N(R^{11})S(=O)_2R^{11}$;

R^{21} and R^3 are each independently hydrogen, halogen, C_1 - C_6 alkyl, or C_1 - C_6 haloalkyl; and
G is a group of the formula,



J is aryl or heteroaryl;

K is aryl or heteroaryl;

each R^4 and R^{41} is independently halogen, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, aryl- C_0 - C_6 alkylcarboxy, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, heteroaryloxy, heterocyclyloxy, $-G^1$, $-E-G^1$, or $-D-E-G^1$, wherein

D is $-O-$;

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3$ - C_6 cycloalkyl; and

G^1 is $-C_1$ - C_6 alkyl, $-C_1$ - C_6 haloalkyl, $-COR^{11}$, $-COOR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-C\equiv N$, $-OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}SO_2R^{11}$, $-N(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, $-SOR^{11}$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, or $-SR^{11}$,

L^2 is a bond;

q is 1, 2, or 3; and

q' is 0, 1, 2, or 3;

each R^{10} is independently $-R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-CO_2R^{11}$, or $-SO_2R^{11}$;

each R^{11} is independently -hydrogen, $-C_1$ - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, or $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-; C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-, $-C_3$ - C_8 cycloalkyl, $-C_1$ - C_6 haloalkyl, $-N(R^{12})_2$, aryl, $-(C_1$ - C_6)alkyl-aryl, heteroaryl, $-(C_1$ - C_6)alkyl-heteroaryl, heterocyclyl, or $-(C_1$ - C_6)alkyl-heterocyclyl.

wherein any of R^{11} is optionally substituted with one or more radicals of R^{12} ;

each R^{12} is independently halogen, C_0 - C_6 alkyl- $N(R^{13})_2$, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 alkoxy, $(C_0$ - C_6 alkyl) $C=O(OR^{13})$, C_0 - C_6 alkyl- OR^{13} , C_0 - C_6 alkyl- COR^{13} , C_0 - C_6 alkyl- SO_2R^{13} , C_0 - C_6 alkyl- $CON(R^{13})_2$, C_0 - C_6 alkyl- $CONR^{13}OR^{13}$, C_0 - C_6 alkyl- $SO_2N(R^{13})_2$, C_0 - C_6 alkyl- SR^{13} , C_0 - C_6 haloalkyl- OR^{13} , aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, C_0 - C_6 alkoxyaryl, aryl- C_0 - C_6 alkylcarboxy, C_0 - C_6 alkyl, $-NR^{13}SO_2R^{13}$, or $-OC_0$ - C_6 alkyl- $COOR^{13}$;

each R^{13} is independently hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, or $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-; and
each R^{14} is independently C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 alkoxy, halogen, C_1 - C_6 haloalkyl, C_0 - C_6 alkylCON(R^{11})₂, C_0 - C_6 alkylCONR¹¹OR¹¹, C_0 - C_6 alkylOR¹¹, or C_0 - C_6 alkylCOOR¹¹.

38. The compound according to claim 1, wherein

R^1 is $-L^1-R^5$, wherein

L^1 is a bond, $-C_3$ - C_8 cycloalkyl- or L^5 , wherein

each L^5 is independently $-[C(R^{15})_2]_m-$, wherein

m is 0, 1, 2, or 3; and

each R^{15} is independently hydrogen, halogen, $(C_1$ - C_6)alkyl, or $(C_1$ - C_6)haloalkyl; and

R^5 is aryl, heterocyclyl, heteroaryl, $-C$, or $-B-C$, wherein

B is $-[C(R^{15})_2]_m-$, $-C_3$ - C_6 cycloalkyl-; and

C is $-C_1$ - C_6 alkyl or $-C_1$ - C_6 haloalkyl;

wherein R^5 is optionally substituted with one or more R^{5a} , wherein

each R^{5a} is independently halogen, nitro, heteroaryl, heterocyclyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-, aryl, arylalkyl, aryloxy, aryloxyaryl, arylC₁₋₆ alkoxy, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $SO_2NR^{11}COR^{11}$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $CON(R^{11})OR^{11}$, $OCON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$, $NR^{11}CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COOR^{11}$, or $N(R^{11})_2$, wherein

each R^{5a} is optionally substituted with one or more groups which independently are
-halogen, $-C_1$ - C_6 alkyl, aryloxy, C_0 - C_6 alkyl SO_2R^{11} , C_0 - C_6 alkyl $COOR^{11}$, C_0 - C_6 alkoxyaryl, $-C_1$ - C_6 haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-CON(R^{11})OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}CON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, or $-N(R^{11})_2$;

R^2 is $-L^3-R^7$, wherein

L^3 is a bond; and

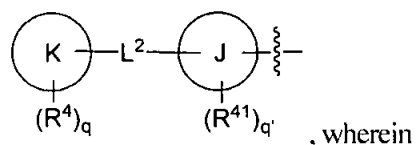
R^7 is $-Z$ or $-Y-Z$, wherein

Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$, or $-C_3$ - C_6 cycloalkyl; and

Z is $-H$, halogen, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-OC(=O)-R^{11}$, or $-OC(=O)-N(R^{11})_2$;

R^{21} and R^3 are each independently hydrogen, halogen, C_1 - C_6 alkyl, or C_1 - C_6 haloalkyl; and

G is a group of the formula,



J is aryl or heteroaryl;

K is aryl or heteroaryl;

each R^4 and R^{41} is independently halogen, heteroaryl, heterocyclyl, $-G^1$, $-E-G^1$, or $-D-E-G^1$, wherein

D is $-O-$;

E is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or $-C_3$ - C_6 cycloalkyl; and

G^1 is $-C_1$ - C_6 alkyl, $-C_1$ - C_6 haloalkyl, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{SOR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, or $-\text{SR}^{11}$,

L^2 is a bond;

q is 1, 2, or 3, and

q' is 0, 1, 2 or 3,

each R^{10} is independently $-\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{11}$, or $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$;

each R^{11} is independently -hydrogen, $-C_1$ - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-, $-C_3$ - C_8 cycloalkyl, $-(C_1$ - C_6)alkyl- $(C_3$ - C_8)cycloalkyl, $-C_1$ - C_6 haloalkyl, $-\text{N}(\text{R}^{12})_2$, aryl, $-(C_1$ - C_6)alkyl-aryl, heteroaryl, $-(C_1$ - C_6)alkyl-heteroaryl, heterocyclyl, or $-(C_1$ - C_6)alkyl-heterocyclyl,

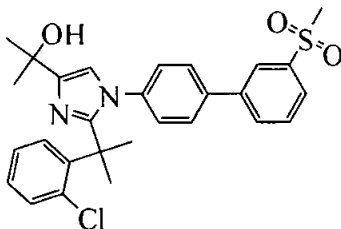
wherein any of R^{11} is optionally substituted with one or more radicals of R^{12} ;

each R^{12} is independently halogen, OR^{13} , $\text{N}(\text{R}^{13})_2$, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 alkoxy, $(C_0$ - C_6 alkyl) $\text{C}=\text{O}(\text{OR}^{13})$, C_0 - C_6 alkyl OR^{13} , C_0 - C_6 alkyl COR^{13} , C_0 - C_6 alkyl SO_2R^{13} , C_0 - C_6 alkyl $\text{CON}(\text{R}^{13})_2$, C_0 - C_6 alkyl $\text{CONR}^{13}\text{OR}^{13}$, C_0 - C_6 alkyl $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$, C_0 - C_6 alkyl SR^{13} , C_0 - C_6 haloalkyl OR^{13} , aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, C_0 - C_6 alkoxyaryl, aryl C_0 - C_6 alkylcarboxy, C_0 - C_6 alkyl, $-\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$, or $-\text{OC}_0$ - C_6 alkyl COOR^{13} ;

each R^{13} is independently hydrogen C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_1 - C_6 alkyl-, $(C_3$ - C_8 cycloalkenyl)- C_1 - C_6 alkyl-, or $(C_3$ - C_8 cycloalkyl)- C_2 - C_6 alkenyl-;

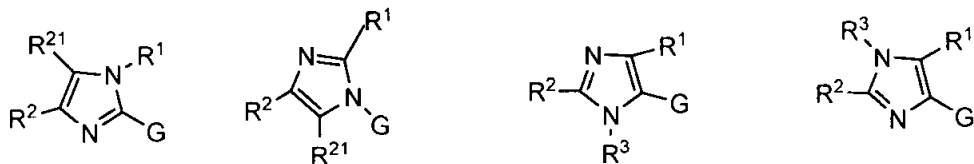
each R^{14} is independently C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 alkoxy, halogen, C_1 - C_6 haloalkyl, C_0 - C_6 alkyl $\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, C_0 - C_6 alkyl $\text{CONR}^{11}\text{OR}^{11}$, C_0 - C_6 alkyl OR^{11} , or C_0 - C_6 alkyl COOR^{11} .

39. The compound according to claim 1 which is one of the species listed in Table 1.
40. The compound according to claim 1 which is



or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

41. The compound according to claim 1, of one of the formulas,



or a pharmaceutically acceptable salt, isomer, or prodrug thereof, wherein,

R¹ is -L¹-R⁵, wherein

L¹ is a bond, L⁵, L⁶, -L⁵-L⁶-L⁵-, or -L⁶-L⁵-L⁶-, wherein

each L⁵ is independently -[C(R¹⁵)₂]_m-, wherein

each R¹⁵ is independently hydrogen, halogen, (C₁-C₆)alkyl, or (C₁-C₆)haloalkyl; and

each L⁶ is independently -CS-, -CO-, -SO₂-, -O-, -CON(R¹¹)-, -CONR¹¹N(R¹¹)-, -C(=NR¹¹)-, -C(=NOR¹¹)-, or -C(=NN(R¹¹)₂)-, aryl-, -C₃-C₈cycloalkyl-, heteroaryl-, or heterocyclyl-

wherein the aryl, cycloalkyl, heteroaryl, or heterocyclyl is optionally substituted with one or more R¹⁴;

or each L⁶ is independently C₂-C₆ aldiyl

wherein the aldiyl chain is optionally interrupted by -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -CON(R¹⁰)-, -CO-, -CO₂-, -OC(=O)-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -SO₂-, -N(R¹⁰)SO₂-, or -SO₂N(R¹⁰); and

R⁵ is aryl, heterocyclyl, heteroaryl, -C-, or -B-C

wherein

B is -[C(R¹⁵)₂]_m- or -C₃-C₈ cycloalkyl-; and

C is halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, $-C_1-C_6$ haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-SR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, or $-N(R^{11})_2$,

wherein R^5 is optionally substituted with one or more R^{5a} , wherein

each R^{5a} is independently halogen, nitro, heteroaryl, heterocyclyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_8 cycloalkyl, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkenyl)- C_1-C_6 alkyl-, $(C_3-C_8$ cycloalkyl)- C_2-C_6 alkenyl-, aryl, arylalkyl, aryloxy, aryloxyaryl, aryl- C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $SO_2NR^{11}COR^{11}$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $CON(R^{11})OR^{11}$, $OCON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$, $NR^{11}CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COOR^{11}$, or $N(R^{11})_2$, wherein

each R^{5a} is optionally substituted with one or more groups which independently are -halogen, $-C_1-C_6$ alkyl, aryloxy C_0-6 alkyl, SO_2R^{11} , C_0-6 alkyl, $COOR^{11}$, C_0-6 alkoxyaryl, C_1-C_6 haloalkyl, $-SO_2R^{11}$, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-CON(R^{11})OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}CON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, or $-N(R^{11})_2$;

R^2 and R^{21} are $-L^3-R^7$, wherein

each L^3 is independently a bond or $-(CH_2)_m-V^1-(CH_2)_n-$ wherein

n is 0-6; and

V^1 is $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-NR^{11}-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-OCO-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CONR^{10}-$, $-C(=N-R^{11})-$, $-C(=N-OR^{11})-$, $-C[=N-N(R^{11})_2]$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, $-SO_2N(R^{10})-$, $-NR^{10}CONR^{10}-$, $-NR^{10}CSNR^{10}-$, C_3-C_6 cyclo alkyl, or C_3-C_6 cyclohaloalkyl;

or each L^3 is independently C_2-C_6 alidiyl,

wherein the alidiyl chain is optionally interrupted by $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-NR^{11}-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, or $-SO_2N(R^{10})-$; and

each R^7 is independently hydrogen, halogen, nitro, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-Z$, $-Y-Z$, or $-X-Y-Z$, wherein

X is $-O-$;

Y is $-[C(R^{15})_2]_m-$ or C_2-C_6 alkenyl, $-C_3-C_8$ cycloalkyl; and

Z is -H, halogen, -OR¹¹, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -N(R¹¹)₂, -C(=N-OH)R¹¹, -C(=S)N(R¹¹)₂, -CN, -S(=O)₂N(R¹¹)₂, -C(=O)N(R¹¹)N(R¹¹)₂, -C(=O)N(R¹¹)(OR¹¹), -OC(=O)-R¹¹, -OC(=O)-N(R¹¹)₂,

wherein R⁷ is optionally substituted with one or more R^{7a}, wherein

R^{7a} is halogen, haloaryl, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, arylC₀-C₆ alkylcarboxy, C(R¹¹)=C(R¹¹)-COOH, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, heterocyclyloxy, heteroaryloxy, -Z', -Y'-Z', or -X'-Y'-Z', wherein

X' is -O-;

Y' is -[C(R¹⁵)₂]_m- or -C₃-C₈cycloalkyl; and

Z' is -H, halogen, -OR¹¹, -SR¹¹, -S(=O)₂R¹¹, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)N(R¹¹)₂, -N(R¹¹)₂, -N(R¹¹)C(=O)R¹¹, -S(=O)₂N(R¹¹)C(=O)R¹¹, -CN, -S(=O)₂N(R¹¹)₂, -C(=O)N(R¹¹)N(R¹¹)₂, -C(=O)N(R¹¹)(OR¹¹), -OC(=O)-R¹¹, -OC(=O)-OR¹¹, -N(R¹¹)C(=O)-R¹¹, -N(R¹¹)S(O=)₂R¹¹,

wherein each R^{7a} is optionally substituted with one or more R⁸,

wherein each R⁸ is independently halogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl(OR¹¹), C₀-C₆ alkylOR¹¹, C₀-C₆ alkylCON(R¹¹)₂, C₀-C₆ alkylCOR¹¹, C₀-C₆ alkylCOOR¹¹, or C₀-C₆ alkylSO₂R¹¹,

provided that R² and R²¹ are not simultaneously hydrogen

R³ is -L-R⁶, wherein

L is a bond, -X³-(CH₂)_n-X³-, -(CH₂)_m-X³-(CH₂)_n- or -(CH₂)_{l+w}-Y³-(CH₂)_w- wherein

n is 0-6; each w is independently 0-5; and

each X³ is independently a bond, -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C≡C-, -CO-, -CS-, -CONR¹⁰-, -C(=N)(R¹¹)-, -C(=N-OR¹¹)-, -C[=N-N(R¹¹)₂], -CO₂-, -SO₂-, or -SO₂N(R¹⁰)-; and

Y³ is -O-, -S-, -NR⁷-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -OCO-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -NR¹⁰CONR¹⁰-, -N(R¹⁰)SO₂-, or -NR¹⁰CSNR¹⁰-;

or L is C₂₋₆ alidiyl chain wherein the alidiyl chain is optionally interrupted by -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -CON(R¹⁰)-, -CO-, -CO₂-, -OC(=O)-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -SO₂-, -N(R¹⁰)SO₂-, or -SO₂N(R¹⁰)-; and

877

each R^{6a} is independently $-Z''$, $-Y''-Z''$, or $-X''-Y''-Z''$, wherein

Y" is $-[C(R^{15})_2]_m-$, $-C_2-C_6$ alkenyl, C_3-C_8 cycloalkyl, heterocyclyl, aryl, or heteroaryl, wherein

Z^{''} is -H, -CN, halogen, -OR^{II}, -C(=O)R^{II}, -C(=O)OR^{II}, -C(=O)N(R^{II})₂, -N(R^{II})₂, -N₃, -SO₂R^{II}, -S(=O)₂N(R^{II})₂, -C(=O)N(R^{II})N(R^{II})₂, -N(R^{II})C(=O)N(R^{II})₂, -OC(=O)-OR^{II}, -C(=O)N(R^{II})(OR^{II}), -OC(=O)-R^{II}, -OC(=O)-N(R^{II})₂, or -N(R^{II})COOR^{II}; and



each R⁴¹ is independently -halogen, nitro, CR¹¹=CR¹¹COOR¹¹, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, arylC₀-C₆ alkylcarboxy, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, heteroaryloxy, heterocyclyloxy, -G¹-E-G¹ or -D-E-G¹, wherein

G¹ is -C₁-C₆alkyl, -C₁-C₆haloalkyl, -COR¹¹, -COOR¹¹, -CON(R¹¹)₂, -C≡N, -OR¹¹, -OCON(R¹¹)₂, -OCOOR¹¹, -N₃, -NR¹¹COR¹¹, -NR¹¹SO₂R¹¹, -N(R¹¹)₂, -NR¹¹COOR¹¹, -SOR¹¹, -SO₂R¹¹, -SO₂NR¹¹COR¹¹, -SO₂N(R¹¹)₂, or -SR¹¹

wherein each R^{4a} is independently halogen, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, C₁-C₆ alkoxyaryl, arylC₀-C₆ alkylcarboxy, -G', -E'-G', or -D'-E'-G', wherein

D' is -O-;

E' is $-\text{[C(R}^{15})_2]_m-$ or $-\text{C}_3\text{-C}_8\text{cycloalkyl-}$; and

G' is -H, -halogen, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$, $\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N(R}^{11})_2$, or $-\text{SR}^{11}$;

each m is 0, 1, 2, 3, 4, 5, or 6; and

q' is 0, 1, 2, 3, or 4,

each R^{10} is independently $-\text{R}^{11}$, $-\text{C(=O)R}^{11}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{11}$, or $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$;

each R^{11} is independently -hydrogen, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkynyl, $\text{C}_3\text{-C}_8$ cycloalkyl, $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkyl})\text{-C}_1\text{-C}_6$ alkyl-, $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkenyl})\text{-C}_1\text{-C}_6$ alkyl-, $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkyl})\text{-C}_2\text{-C}_6$ alkenyl-, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, $-\text{N(R}^{12})_2$, aryl, $-(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl-aryl}$, heteroaryl, $-(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl-heteroaryl}$, heterocyclyl, or $-(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl-heterocyclyl}$,

wherein any of R^{11} is optionally substituted with one or more radicals of R^{12} ;

each R^{12} is independently halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkoxy, $(\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkyl})\text{C=O(OR}^{13})$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylOR}^{13}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCOR}^{13}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylSO}_2\text{R}^{13}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCON(R}^{13})_2$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCONR}^{13}\text{OR}^{13}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylSO}_2\text{N(R}^{13})_2$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylSR}^{13}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ haloalkylOR}^{13}$, aryloxy, aralkyloxy, aryloxyalkyl, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{alkoxyaryl}$, $\text{arylC}_0\text{-C}_6\text{ alkylcarboxy}$, $-\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylN(R}^{13})_2$, $-\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$, or $-\text{OC}_0\text{-C}_6\text{ alkylCOOR}^{13}$;

each R^{13} is independently hydrogen, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkenyl, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alkynyl, $\text{C}_3\text{-C}_8$ cycloalkyl, $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkyl})\text{-C}_1\text{-C}_6$ alkyl-, $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkenyl})\text{-C}_1\text{-C}_6$ alkyl-, or $(\text{C}_3\text{-C}_8\text{ cycloalkyl})\text{-C}_2\text{-C}_6$ alkenyl-;

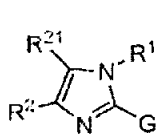
each R^{14} is independently $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkoxy, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCON(R}^{11})_2$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCONR}^{11}\text{OR}^{11}$, $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylOR}^{11}$, or $\text{C}_0\text{-C}_6\text{ alkylCOOR}^{11}$.

42. A pharmaceutical composition comprising a compound of claim 1, or a pharmaceutically acceptable derivative thereof in a pharmaceutically acceptable carrier.
43. A method of treating, preventing, inhibiting or ameliorating the symptoms of a disease or disorder that is modulated or otherwise affected by nuclear receptor activity or in which nuclear receptor activity is implicated, comprising administering to a subject in need thereof a therapeutically effective amount of a compound according to part (A) of claim 1, wherein the disease or disorder is hypercholesterolemia, hyperlipoproteinemia, hypertriglyceridemia, lipodystrophy, hyperglycemia, diabetes mellitus, dyslipidemia, atherosclerosis, gallstone disease, acne vulgaris, acneiform skin conditions, diabetes, Parkinson's disease, cancer, Alzheimer's disease, inflammation, immunological disorders, lipid disorders,

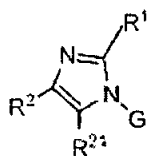
obesity, conditions characterized by a perturbed epidermal barrier function, conditions of disturbed differentiation or excess proliferation of the epidermis or mucous membrane, or cardiovascular disorders.

REIVINDICACIONES

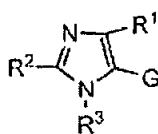
1. Un compuesto de acuerdo con una de las siguientes fórmulas:



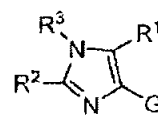
IIa



IIb



IIc



IIId

O una sal farmacéuticamente aceptable, isómero, o profármaco de él, en donde:

(A) R^1 es $-L^1-R^5$, en donde

L^1 es un enlace, L^5 , L^6 , $-L^5-L^6-L^5-$ o $-L^6-L^5-L^6-$, en donde:

Cada L^5 es independientemente $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde

Cada R^{15} es independientemente hidrógeno, alquilo (de C_1-C_6), cicloalquilo (de C_3-C_6) o haloalquilo (de C_1-C_6); y

Cada L^6 es independientemente $-CS-$, $-CO-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-CON(R^{11})-$, $-CONR^{11}N(R^{11})-$, $-C(=NR^{11})-$, $-C(=NOR^{11})-$, o $-C(=NN(R^{11})_2)-$, $-arilo-$, $-cicloalquilo$ de C_3-C_8- , $-heteroarilo-$, o $-heterociclilo-$,

En donde el arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterociclilo se sustituye optativamente con uno o más R^{14} ;

O cada L^6 se selecciona independientemente de alidilo de C_2-C_6 ,

En donde la cadena de alidilo está interrumpida optativamente

por $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-CON(R^{10})-$,

26
881

$-\text{CO}-$, $-\text{CO}_2-$, $-\text{OC}(=\text{O})-$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{SO}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{SO}_2-$, o $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})$; y

R^5 es arilo, heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo (de C_3-C_6), $-\text{C}$ o $-\text{B}-\text{C}-$, en donde

B es $-\text{C}(\text{R}^{15})_2]_{\text{m}}-$, o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

C es halógeno, $-\text{alquilo}$ de C_1-C_6 , $-\text{haloalquilo}$ de C_1-C_6 , $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, o $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$,

En donde R^5 se sustituye optativamente con uno o más R^{5a} , en donde

Cada R^{5a} es independientemente halógeno, nitro, heteroarilo, heterociclilo, alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 , arilo, arilalquilo, ariloxi, ariloxiarilo, arilalcoxi de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $\text{C}\equiv\text{N}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{CON}(\text{R}^{11})\text{OR}^{11}$, $\text{OCON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $\text{NR}^{11}\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{NR}^{11}\text{COOR}^{11}$, o $\text{N}(\text{R}^{11})_2$, en donde

Cada R^{5a} se sustituye optativamente con uno o más grupos que son independientemente $-\text{halógeno}$, alquilo de C_1-C_6 , ariloxi alquilo de C_0-C_6 , SO_2R^{11} , alquilo COOR^{11} , alcoxiarilo de C_0-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{N}_3$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{SON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, -

CON(R¹¹)OR¹¹, -OCON(R¹¹)₂, -NR¹¹COR¹¹, -NR¹¹CON(R¹¹)₂, -NR¹¹COOR¹¹, o -N(R¹¹)₂;

R² y R²¹ son -L³-R⁷, en donde

Cada L³ es independientemente un enlace o -(CH₂)_m-V¹-(CH₂)_n-, en donde

n es 0-6; y

V¹ es -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)-, -C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -NR¹¹-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -OCO-, -CO-, -CS-, -CONR¹⁰-, -C(=N-R¹¹)-, -C(=N-OR¹¹)-, -C[=N-N(R¹¹)₂], -CO₂-, -OC(=O)-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -SO₂-, -N(R¹⁰)SO₂-, -SO₂N(R¹⁰)-, -NR¹⁰CONR¹⁰-, -NR¹⁰CSNR¹⁰-, cicloalquilo de C₃-C₆ o ciclohaloalquilo de C₃-C₆;

O cada L³ es independientemente alidilo de C₂-C₆,

En donde la cadena de alidilo está interrumpida optativamente por -C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)₂C(R¹¹)₂-, -C(R¹¹)=C(R¹¹)₂O-, -C(R¹¹)₂NR¹¹-, -C≡C-, -O-, -S-, -N(R¹⁰)CO-, -N(R¹⁰)CO₂-, -NR¹¹-, -CON(R¹⁰)-, -CO-, -CO-, -OC(=O)-, -OC(=O)N(R¹⁰)-, -SO₂-, -N(R¹⁰)SO₂-, o -SO₂N(R¹⁰)-; y

Cada R⁷ es independientemente hidrógeno, halógeno, nitro, arilo, heteroarilo, heterociclilo, -Z-, -Y-Z-, o -X-Y-Z, en donde

X es -O-;

Y es -[C(R¹⁵)₂]_m-, alqueno de C₂-C₆, o cicloalquilo de C₃-C₆; y

Z es -H, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, o $-OC(=O)-N(R^{11})_2$,

En donde R^7 se sustituye optativamente con uno o más R^{7a} , en donde

R^{7a} es halógeno, haloarilo, ariloxi, aralquilo, ariloxialquilo, aril alquilcarboxi de C_0-C_6 , $C(R^{11})=C(R^{11})-COOH$, arilo, heteroarilo, heterociclilo, heterocicliloxi, heteroariloxi, $-Z'$, $-Y'-Z'$, o $-X'-Y'-Z'$, en donde

X' es $-O-$;

Y' es $-[C(R^{15})_2]_m$ o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

Z' es -H, halógeno, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-S(=O)_2R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})$, $-N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, $-OC(=O)-OR^{11}$, $-N(R^{11})C(=O)-R^{11}$, o $-N(R^{11})S(O=)_2R^{11}$,

En donde cada R^{7a} se sustituye optativamente con uno o más R^6 ,

En donde cada R^6 es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de $C_1-C_6(OR^{11})$, alquilo de $C_0-C_6OR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_0-C_6COR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$, o alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{11}$,

Siempre que R^2 y R^{21} no sean simultáneamente hidrógeno,

R^3 es $-L-R^6$, en donde

L es un enlace, $-X^3-(CH_2)_n-X^3-$, $-(CH_2)_m-X^3-(CH_2)_n-$ o $-(CH_2)_{1+w}-Y^3-(CH_2)_w-$, en donde

n es 0-6; cada w es independientemente 0-5; y

cada X^3 es independientemente un enlace, $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C\equiv C$, $-CO-$, $-CS-$, $-CONR^{10}-$, $-C(=N)(R^{11})-$, $-C(=N-OR^{11})-$, $-[N=N(R^{11})_2]$, $-CO_2-$, $-SO_2-$, o $-SO_2N(R^{10})-$; y

Y^3 es $-O-$, $-S-$, $-NR^7-$, $-N(R^{10})CO-$, $N(R^{10})CO_2-$, $-OCO-$, $OC(=O)N(R^{10})-$, $-NR^{10}CONR^{10}-$, $-N(R^{10})SO_2-$, o $-NR^{10}CSNR^{10}-$;

o L es una cadena de alidilo en donde la cadena de alidilo está optativamente interrumpida por $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO-$, o $-SO_2N(R^{10})$; y

R^6 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , arilo, cicloalquilo de C_3-C_8 , heteroarilo, heterociclilo, $-CN$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2-$, $-N(R^{11})_2$, $-SO_2R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(OR^{11})$, en donde el arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterociclilo se sustituye optativamente con uno o más R^{6a} , en donde

cada R^{6a} es independientemente $-Z''$, $-Y''-Z''$, o $-X''-Y''-Z''$, en donde

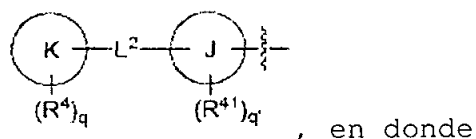
X'' es $-O-$;

Y'' es $-[C(R^{15})_2]_m-$, alqueno de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , heterociclilo, arilo o heteroarilo, en donde

El arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterociclilo optativamente se sustituye con por lo menos un grupo que es cada uno independientemente Z'' ;

Z'' es $-H$, $-CN$, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})C(=O)N(R^{11})_2$, $-OC(=O)-OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, $-OC(=O)-N(R^{11})_2$, o $-N(R^{11})COOR^{11}$; y

G es un grupo de la fórmula



J es arilo, heteroarilo, o está ausente;

K es arilo, heteroarilo, o está ausente;

Siempre que

(i) si K está ausente, entonces q es 1 y R^4 está unido a L^2 ; y cada R^4 y R^{41} es independientemente halógeno, oxo, nitro, $CR^{11}=CR^{11}COOR^{11}$, ariloxi, aralquiloxi, ariloxialquilo, aril alquilcarboxi de C_0-C_6 , arilo, heteroarilo, heterociclilo, heteroariloxi, heterocicliloxi, $-G^1$, $-E-G^1$, o $-D-E-G^1$, en donde D es $-O-$;

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , $-COR^{11}$, $-COOR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-C\equiv N$, $-OR^{11}$, $-OCN(R^{11})_2$, $-OCOOR^{11}$, $-N_3$, $-NR^{11}COR^{11}$, -

30
886

$\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{NR}^{11}\text{COOR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SOR}^{11}$, o $-\text{SR}^{11}$,

En donde cada R^4 se sustituye optativamente con uno o más R^{4a} ,

En donde cada R^{4a} es independientemente halógeno, ariloxi, analquiloxi, ariloxialquilo, alcoxiarilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, aril alquilcarboxi de $\text{C}_0\text{-C}_6$, $-\text{G}'$, $-\text{E}'\text{-G}'$, o $-\text{D}'\text{-E}'\text{-G}'$, en donde D' es $-\text{O}-$;

E' es $-\text{C}(\text{R}^{15})_m-$ o cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_8$; y

G' es $-\text{H}$, halógeno, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, o $-\text{SR}^{11}$,

L^2 es un enlace o $-\text{C}(\text{R}^{15})_2]_m\text{-V}^2\text{-C}(\text{R}^{15})_2]_n-$, en donde

V^2 es independientemente $-\text{C}(\text{R}^{11})_m$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{11})-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{O}-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{NR}^{11}-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}_2-$, $-\text{CON}(\text{R}^{10})-$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})-$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})\text{O}-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CS}-$, $-\text{CO}_2-$, $-\text{OC}(=\text{O})-$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{SO}_2-$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{NR}^{10}\text{CONR}^{10}-$, $-\text{NR}^{10}\text{CSNR}^{10}-$, cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_8$, o ciclohaloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_6$,

o V es alidilo de C_{2-6} ,

en donde la cadena de alidilo está interrumpida optativamente por $-\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{C}(\text{R}^{11})_2-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{11})-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{O}-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{O}-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})\text{NR}^{11}$, $-\text{C}(\text{R}^{11})_2\text{NR}^{11}-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{CO}_2-$, $-\text{CON}(\text{R}^{10})-$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})-$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})\text{O}-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CO}_2-$, $-\text{OC}(=\text{O})-$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})\text{SO}_2-$, o $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})-$;

o V^2 es arilo, heteroarilo, o heterociclilo, cada uno de los cuales se sustituye optativamente con uno o más R^9 , en donde cada R^9 es independientemente halógeno, haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$;

cada m es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;

q es 0, 1, 2, 3, 4, o 5; siempre que q sea 0 si y sólo si K no es fenilo; y

q' es 0, 1, 2, 3, o 4

cada R^{10} es independientemente $-R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-CO_2R^{11}$, o $-SOR^{11}$;

cada R^{11} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalqueno de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalqueno de C_3-C_8)-alqueno de C_2-C_6 , -haloalquilo de C_1-C_6 , $-N(R^{12})_2$, arilo, alquilo (de C_1-C_6)-arilo, heteroarilo, alquilo (de C_1-C_6)heteroarilo, heterociclilo, o alquilo (de C_1-C_6)-heterociclilo,

en donde cualquiera de R^{11} se sustituye optativamente con uno o más radicales de R^{12} ;

cada R^{12} es independientemente halógeno, haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , (alquilo de C_0-C_6) $C=O(OR^{13})$; alquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6COR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{13}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{13}OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2N(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6SR^{13}$, haloalquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, ariloxi, aralquilo, ariloxialquilo, alcoxiarilo de C_0-C_6 ,

arilalquilcarboxi de C_{0-6} , alquilo de $C_0-C_6N(R^{13})_2$, $-NR^{13}SO_2R^{13}$, o -Oalquilo de $C_{0-6}COOR^{13}$;

cada R^{13} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , o (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 ;

cada R^{14} es independientemente alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de $C_1-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{11}OR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6OR^{11}$, o alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$; y

(B) siempre que

(i) cuando L^2 es un enlace, tanto J como K no están ausentes;

(ii) si el compuesto definido por la fórmula IIa, entonces

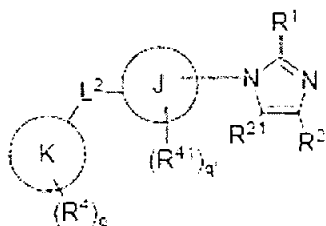
a. si J es fenilo y K es tienilo, furilo o tiazolo y q es 0, entonces R^1 no es 4-(NH_2SO_2)fenilo, 4-(NH_2SO_2)-3-fluorofenilo-, y

b. si R^5 es piridilo o fenilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a} y L^1 es un enlace, entonces G no es p-(NH_2SO_2)fenilo o p-(CH_3SO_2)fenilo-;

(iii) si el compuesto se define con la fórmula IIc o IIId, entonces G no es p-(NH_2SO_2)fenilo o p-(CH_3SO_2)fenilo;

(iv) el compuesto no es 1-(bifenil-4-il)-2,5-difenil-1H-imidazol.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, de la fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptable, isómero o profármaco de él, en donde:

L¹ es un enlace;

R⁵ es arilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a};

R²¹ es hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo de C₁-C₆ o haloalquilo de C₁-C₆.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde L² es un enlace.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde:

R¹ es -L¹-R⁵, en donde

L¹ es un enlace, -[C(R¹⁵)₂]_m o cicloalquilo de C₃-C₈, y

R⁵ es fenilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno o más R^{5a}, en donde

Cada R^{5a} es independientemente -halógeno, alcoxi de C₁-C₆, alquilo de C₁-C₆, o haloalquilo de C₁-C₆;

R^2 y R^{21} son cada uno independientemente $-H$, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-C(O)N(R^{11})_2$ o $-COOR^{11}$;

L^2 es un enlace,

J es fenilo, piridilo o tienilo,

K es fenilo o piridilo,

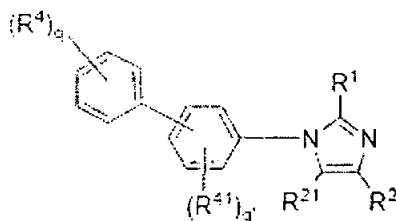
Cada R^{41} es halógeno, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6 y

Cada R es halógeno, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-C(O)N(R^{11})_2$, $-COOR^{11}$, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6 .

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde por lo menos uno de J y K es fenilo.

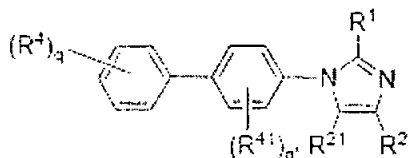
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, en donde J y K son ambos fenilo.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, de la fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero o un profármaco de él.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, de la fórmula:



O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero o un profármaco de él, en donde R^{21} es -H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6 .

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en donde Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno, y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

10. El compuesto de acuerdo con reivindicación 8, en donde

cada R^{41} es independientemente halógeno, $-G^2$ o $-E-G^2$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^2 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 o halógeno, y

Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m$, en donde cada R^1 es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, en donde R^2 es $-L^3-R^7$, en donde

L^5 es un enlace y

R^7 es hidrógeno, halógeno, $-Z$ o $-Y-Z$, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m$ o alquénilo de C_2-C_6 ,

En donde cada R^{15} es independientemente H, halógeno, o alquilo de C_1-C_6 y

Z es $-H$, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})$, $-C(=N-OH)R^{11}$ o $-C(=S)N(R^{11})_2$.

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, cada R^{5a} es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , OR^{11} , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$ o $N(R^{11})_2$.

13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en donde

R^2 es $-L^3-R^7$, en donde

L^3 es un enlace y

R^7 es hidrógeno, halógeno o $-[C(R^{15})_2]-Z$, en donde

Cada R^{15} es H, halógeno o alquilo (de C_1-C_2) y

37
893

Z es -H, halógeno, $-OR^{11''}$, $-C(=O)R^{11''}$, $-C(=O)OR^{11''}$, $-C(=O)N(R^{11''})_2$,
 $-C(=N-OH)R^{11''}$ o $-C(=S)N(R^{11''})$,

En donde $R^{11''}$ es H o (alquilo de C_1-C_6)-

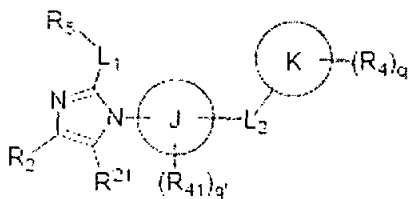
14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en donde
 R^2 es halógeno, $-CF_3$, $-CH_2OH$, o $-C(CH_3)_2OH$.

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 L_1 es $-[C(R^{15})_2]_{m'}$ o cicloalquilo de C_3-C_8 , en donde m' es
 cualquiera de 1 a 3; y

Cada R^{15} es independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo (de
 C_1-C_6) o haloalquilo de (C_1-C_6) ; y

R^{21} es hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo de C_1-C_6 o
 haloalquilo de C_1-C_6 .

16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 15, de la
 fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero o un
 profármaco de él.

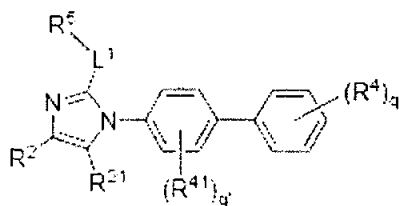
38
894

17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 16, en donde al menos uno de J o K es fenilo.

18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, en donde J y K son ambos fenilo.

19. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 18, en donde L_2 es un enlace.

20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 19, de la fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero o un profármaco de él.

21. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, en donde Cada R^{15} es independientemente -H o alquilo (de C_1 - C_2), m' es 1 o 2 y

R^5 es fenilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a} .

22. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 21, en donde R^2 es $-L^3-R^7$, en donde

L^3 es un enlace y

R^7 es hidrógeno, halógeno, $-Z$ o $-Y-Z$, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o alquénilo de C_2-C_6

En donde cada R^{15} es independientemente H, halógeno, alquilo (de C_1-C_6) y

Z es H, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$ o $-C(=S)N(R^{11})_2$.

23. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 21, en donde Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$, o $-E-G^1$ en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

24. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 21, en donde Cada R^{41} es independientemente halógeno, $-G^1$ o $-E-G^1$ en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 o halógeno.

25. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, en donde R^{15} es $-H$

m es 1, 2 o 3 y

R^5 es heterociclilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a} .

26. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 25, en donde

R^2 es $-L^3-R^7$ en donde

L^3 es un enlace, y

R^7 es hidrógeno, halógeno, Z o $-Y-Z$, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o alquenilo de C_2-C_6 ,

En donde cada R^{15} es independientemente H, halógeno, o alquilo (de C_1-C_6) y

Z es H, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, o $-C(=S)N(R^{11})$.

27. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 25, en donde

Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$, o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

28. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 25, en donde

Cada R^{41} es independientemente halógeno, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 o halógeno.

4
897

29. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, en donde
Cada R^{15} es independientemente -H o alquilo (de C_1-C_2),

m' es 1 o 2 y

R^5 es heteroarilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a} .

30. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, en donde

R^2 es $-L^3-R^7$ en donde

L^3 es un enlace, y

R^7 es hidrógeno, halógeno, -Z o -Y-Z, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$, o alqueno de C_2-C_6 ,

En donde cada R^{15} es independientemente H, halógeno, o alquilo
(de C_1-C_6) y

Z es H, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, o $-C(=S)N(R^{11})$.

31. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, en donde

Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo,
heterociclilo, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente
hidrógeno o halógeno, y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

32. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, en donde

Cada R^{41} es independientemente halógeno, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 o halógeno.

33. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^1 es $-L^1-R^5$, en donde

L^1 es un enlace, $-[C(R^{15})_2]_m$ o cicloalquilo de C_3-C_8 , y

R^5 es fenilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno o más R^{5a} , en donde

Cada R^{5a} es independientemente -halógeno, alcoxi de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , o haloalquilo de C_1-C_6 ;

R^2 , R^{21} y R^3 son cada uno independientemente -H, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-C(O)N(R^{11})_2$ o $-COOR^{11}$;

L^2 es un enlace,

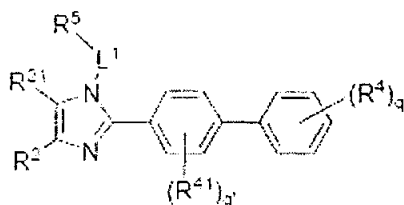
J es fenilo, piridilo o tienilo,

K es fenilo o piridilo,

Cada R^{41} es halógeno, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6 y

Cada R^4 es halógeno, $-[C(R^{15})_2]_m-OH$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-C(O)N(R^{11})_2$, $-COOR^{11}$, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6 .

34. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 15, de la fórmula



O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero o un profármaco de él, en donde

Cada R^{15} es independientemente -H o alquilo (de C_1-C_2);

m' es 1 o 2; y

R^5 es heteroarilo optativamente sustituido con uno o más R^{5a} .

35. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 14, en donde

R^2 es $-L^3-R^7$, en donde

L^3 es un enlace,

R^7 es hidrógeno, halógeno, -Z o -Y-Z, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o alquénilo de C_2-C_6 ,

En donde cada R^{15} es independientemente H, halógeno o alquilo (de C_1-C_6); y

Z es H, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$ o $-C(=S)N(R^{11})_2$.

36. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, en donde

Cada R^4 es independientemente halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$ o $-E-G^1$, en donde

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde cada R^{15} es independientemente hidrógeno o halógeno, y

44
900

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , halógeno, $-OR^{11}$ o $-SO_2R^{11}$.

37. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^1 es $-L^1-R^5$, en donde L^1 es un enlace, L^5 , L^6 , $-L^5-L^6-L^5-$ o $-L^6-L^5-L^6-$, en donde:

Cada L^5 es independientemente $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde

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

Cada R^{15} es independientemente hidrógeno, alquilo (de C_1-C_6), o haloalquilo (de C_1-C_6); y

L^6 es $-CO-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-CON(R^{11})-$, $-cicloalquilo$ de C_3-C_8- , o $-heterociclilo-$,

En donde el cicloalquilo, o heterociclilo se sustituye optativamente con uno o más R^{14} ; y

R^5 es arilo, heterociclilo, heteroarilo, $-C$ o $-B-C-$, en donde

B es $-[C(R^{15})_2]_m-$, o cicloalquilo de C_3-C_8- ; y

C es halógeno, $-alquilo$ de C_1-C_6 , o $-haloalquilo$ de C_1-C_6 ,

En donde R^5 se sustituye optativamente con uno o más R^{5a} , en donde

Cada R^{5a} es independientemente halógeno, nitro, heteroarilo, heterociclilo, alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 , arilo, arilalquilo, ariloxi, ariloxiarilo, arilalcoxi de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 ,

45
901

SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $\text{C}\equiv\text{N}$,
 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{CON}(\text{R}^{11})\text{OR}^{11}$, $\text{OCON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$,
 $\text{NR}^{11}\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $\text{NR}^{11}\text{COOR}^{11}$, o $\text{N}(\text{R}^{11})_2$, en donde

Cada R^{5a} se sustituye optativamente con uno o más grupos que son independientemente -halógeno, alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, ariloxi alquilo de $\text{C}_{0-6}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, alquilo COOR^{11} , alcoxiarilo de C_{0-6} , haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{N}_3$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{SON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})\text{OR}^{11}$, $-\text{OCON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{NR}^{11}\text{COOR}^{11}$, o $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$;

R^2 es $-\text{L}^3\text{-R}^7$, en donde

L^3 es un enlace y

R^7 es halógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-\text{Z}-$, o $-\text{Y-Z}-$, en donde

Y es $-\text{C}(\text{R}^{15})_2]_{\text{m}}-$, o cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_6$; y

Z es $-\text{H}$, halógeno, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{N-OH})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{OR}^{11})$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{-R}^{11}$, o $-\text{OC}(=\text{O})\text{-N}(\text{R}^{11})_2$,

En donde R^7 se sustituye optativamente con uno o más R^{7a} , en donde

R^{7a} es halógeno, $-\text{Z}'$, $-\text{Y}'\text{-Z}'$, o $-\text{X}'\text{-Y}'\text{-Z}'$, en donde

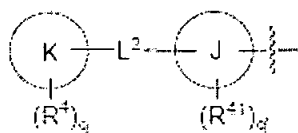
X' es $-\text{O}-$;

Y' es $-\text{C}(\text{R}^{15})_2]_{\text{m}}$ o cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_8$; y

Z' es $-H$, halógeno, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-S(=O)_2R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})$, $-N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, $-OC(=O)-OR^{11}$, $-N(R^{11})C(=O)-R^{11}$, o $-N(R^{11})S(=O)_2R^{11}$,

R^{21} y R^3 son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , o haloalquilo de C_1-C_6 , y

G es un grupo de la fórmula



en donde

J es arilo o heteroarilo;

K es arilo o heteroarilo;

cada R^4 y R^{41} es independientemente halógeno, ariloxi, aralquilo, ariloxialquilo, aril alquilcarboxi de C_0-C_6 , arilo, heteroarilo, heterociclilo, heteroariloxi, heterocicliloxi, $-G^1$, $-E-G^1$, o $-D-E-G^1$, en donde

D es $-O-$;

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , $-COR^{11}$, $-COOR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-C\equiv N$, $-OR^{11}$, $-OCN(R^{11})_2$, $-OCOOR^{11}$, $-N_3$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}SO_2R^{11}$, $-N(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SOR^{11}$, o $-SR^{11}$,

L^2 es un enlace,

q es 1, 2, o 3; y

q' es 0, 1, 2, o 3,

cada R^{10} es independientemente $-R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-CO_2R^{11}$, o $-SOR^{11}$;

cada R^{11} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 , -haloalquilo de C_1-C_6 , $-N(R^{12})_2$, arilo, alquilo (de C_1-C_6)-arilo, heteroarilo, alquilo (de C_1-C_6)heteroarilo, heterociclilo, o alquilo (de C_1-C_6)-heterociclilo,

en donde cualquiera de R^{11} se sustituye optativamente con uno o más radicales de R^{12} ;

cada R^{12} es independientemente halógeno, alquilo de $C_0-C_6N(R^{13})_2$, haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , (alquilo de C_0-C_6) $C=O(OR^{13})$; alquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6COR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{13}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{13}OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2N(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6SR^{13}$, haloalquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, ariloxi, aralquiloxi, ariloxialquilo, alcoxiarilo de C_0-C_6 , arilalquilcarboxi de C_0-C_6 , alquilo de $C_0-C_6N(R^{13})_2$, $-NR^{13}SO_2R^{13}$, o -Oalquilo de $C_0-C_6COOR^{13}$;

cada R^{13} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , o (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 ;

cada R^{14} es independientemente alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de $C_1-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{11}OR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6OR^{11}$, o alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$.

38. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^1 es $-L^1-R^5$, en donde

L^1 es un enlace, cicloalquilo de C_3-C_8 o L^5 , en donde:

Cada L^5 es independientemente $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde

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

Cada R^{15} es independientemente hidrógeno, alquilo (de C_1-C_6), o haloalquilo (de C_1-C_6); y

R^5 es arilo, heterociclilo, heteroarilo, $-C$ o $-B-C-$, en donde

B es $-[C(R^{15})_2]_m-$, o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

C es $-alquilo$ de C_1-C_6 , o $-haloalquilo$ de C_1-C_6 ,

En donde R^5 se sustituye optativamente con uno o más R^{5a} , en donde

Cada R^{5a} es independientemente halógeno, nitro, heteroarilo, heterociclilo, alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalqueno de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalqueno de C_3-C_8)-alqueno de C_2-C_6 , arilo, arilalquilo, ariloxi, ariloxiarilo, arilalcoxi de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , SO_2R^{11} , OR^{11} , SR^{11} , N_3 , SO_2R^{11} , COR^{11} , $SO_2N(R^{11})_2$, $SO_2NR^{11}COR^{11}$, $C\equiv N$, $C(O)OR^{11}$, $CON(R^{11})_2$, $CON(R^{11})OR^{11}$, $OCON(R^{11})_2$, $NR^{11}COR^{11}$, $NR^{11}CON(R^{11})_2$, $NR^{11}COOR^{11}$, o $N(R^{11})_2$, en donde

Cada R^{5a} se sustituye optativamente con uno o más grupos que son independientemente -halógeno, alquilo de C_1-C_6 , ariloxi alquilo de $C_0-6SO_2R^{11}$, alquiloCOOR¹¹, alcoxiarilo de C_0-6 , haloalquilo de C_1-C_6 , $-SO_2R^{11}$, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-COR^{11}$, $-SON(R^{11})_2$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-C\equiv N$, $-C(O)OR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-CON(R^{11})OR^{11}$, $-OCON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}CON(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, o $-N(R^{11})_2$;

R^2 es $-L^3-R^7$, en donde

L^3 es un enlace y

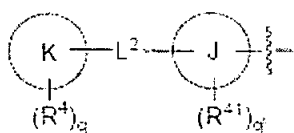
R^7 es $-Z-$, o $-Y-Z-$, en donde

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$, o cicloalquilo de C_3-C_6 ; y

Z es $-H$, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, o $-OC(=O)-N(R^{11})_2$,

R^{21} y R^3 son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , o haloalquilo de C_1-C_6 , y

G es un grupo de la fórmula



, en donde

J es arilo o heteroarilo;

K es arilo o heteroarilo;

cada R^4 y R^{41} es independientemente halógeno, heteroarilo, heterociclilo, $-G^1$, $-E-G^1$, o $-D-E-G^1$, en donde

D es -O-;

E es $-[C(R^{15})_2]_m-$ o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

G^1 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , $-COR^{11}$, $-COOR^{11}$, $-CON(R^{11})_2$, $-C\equiv N$, $-OR^{11}$, $-OCN(R^{11})_2$, $-OCOOR^{11}$, $-N_3$, $-NR^{11}COR^{11}$, $-NR^{11}SO_2R^{11}$, $-N(R^{11})_2$, $-NR^{11}COOR^{11}$, $-SO_2R^{11}$, $-SO_2NR^{11}COR^{11}$, $-SO_2N(R^{11})_2$, $-SOR^{11}$, o $-SR^{11}$,

L^2 es un enlace,

q es 1, 2, o 3; y

q' es 0, 1, 2, o 3,

cada R^{10} es independientemente $-R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-CO_2R^{11}$, o $-SOR^{11}$;

cada R^{11} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalqueno de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alqueno de C_2-C_6 , -haloalquilo de C_1-C_6 , $-N(R^{12})_2$, arilo, alquilo (de C_1-C_6)-arilo, heteroarilo, alquilo (de C_1-C_6)-heteroarilo, heterociclilo, o alquilo (de C_1-C_6)-heterociclilo,

en donde cualquiera de R^{11} se sustituye optativamente con uno o más radicales de R^{12} ;

cada R^{12} es independientemente halógeno, alquilo de $C_0-C_6N(R^{13})_2$, haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , (alquilo de C_0-C_6) $C=O(OR^{13})$; alquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6COR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{13}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{13}OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2N(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6SR^{13}$, haloalquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, ariloxi, aralquiloxi,

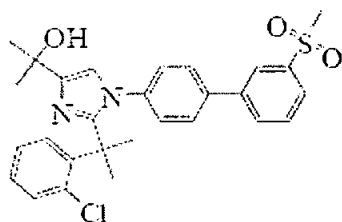
ariloxialquilo, alcoxiarilo de C_{0-6} , arilalquilcarboxi de C_{0-6} , alquilo de $C_{0-6}N(R^{13})_2$, $-NR^{13}SO_2R^{13}$, o $-O$ alquilo de $C_{0-6}COOR^{13}$;

cada R^{13} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , o (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 ;

cada R^{14} es independientemente alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de $C_1-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_{0-6}CONR^{11}OR^{11}$, alquilo de $C_{0-6}OR^{11}$, o alquilo de $C_{0-6}COOR^{11}$.

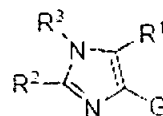
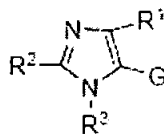
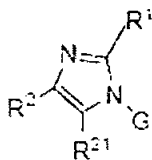
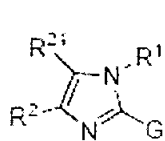
39. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que es una de las especies enumeradas en la Tabla 1.

40. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que es



O una sal farmacéuticamente aceptable de él.

41. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, de uno de las fórmulas:

52
908

O una sal farmacéuticamente aceptable, un isómero, o un profármaco de él, en donde

R^1 es $-L^1-R^5$, en donde

L^1 es un enlace, L^5 , L^6 , $-L^5-L^6-L^5-$ o $-L^6-L^5-L^6-$, en donde:

Cada L^5 es independientemente $-[C(R^{15})_2]_m-$, en donde

Cada R^{15} es independientemente hidrógeno, alquilo (de C_1-C_6), o haloalquilo (de C_1-C_6); y

Cada L^6 es independientemente $-CS-$, $-CO-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-CON(R^{11})-$, $-CONR^{11}N(R^{11})-$, $-C(=NR^{11})-$, $-C(=NOR^{11})-$, o $-C(=NN(R^{11})_2)-$, $-arilo-$, $-cicloalquilo$ de C_3-C_8- , $-heteroarilo-$, o $-heterociclilo-$,

En donde el arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterociclilo se sustituye optativamente con uno o más R^{14} ;

O cada L^6 es independientemente alidilo de C_2-C_6 ,

En donde la cadena de alidilo está interrumpida optativamente por $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO-$, $-N(R^{10})SO_2-$, o $-SO_2N(R^{10})$; y

R^5 es arilo, heterociclilo, heteroarilo, $-C$ o $-B-C-$, en donde

B es $-[C(R^{15})_2]_m-$, o cicloalquilo de C_3-C_8- ; y

C es halógeno, -alquilo de C₁-C₆, -haloalquilo de C₁-C₆, -SO₂R¹¹, -SR¹¹, -SO₂N(R¹¹)₂, -SO₂NR¹¹COR¹¹, -C≡N, -C(O)OR¹¹, -CON(R¹¹)₂, o -N(R¹¹)₂,

En donde R⁵ se sustituye optativamente con uno o más R^{5a}, en donde

Cada R^{5a} es independientemente halógeno, nitro, heteroarilo, heterociclilo, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₈, (cicloalquilo de C₃-C₈)-alquilo de C₁-C₆, (cicloalquenilo de C₃-C₈)-alquilo de C₁-C₆, (cicloalquilo de C₃-C₈)-alquenilo de C₂-C₆, arilo, arilalquilo, ariloxi, ariloxiarilo, arilalcoxi de C₁-C₆, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, SO₂R¹¹, OR¹¹, SR¹¹, N₃, SO₂R¹¹, COR¹¹, SO₂N(R¹¹)₂, SO₂NR¹¹COR¹¹, C≡N, C(O)OR¹¹, CON(R¹¹)₂, CON(R¹¹)OR¹¹, OCON(R¹¹)₂, NR¹¹COR¹¹, NR¹¹CON(R¹¹)₂, NR¹¹COOR¹¹, o N(R¹¹)₂, en donde

Cada R^{5a} se sustituye optativamente con uno o más grupos que son independientemente -halógeno, alquilo de C₁-C₆, ariloxi alquilo de C₀-C₆SO₂R¹¹, alquiloCOOR¹¹, alcoxiarilo de C₀-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, -SO₂R¹¹, -OR¹¹, -SR¹¹, -N₃, -SO₂R¹¹, -COR¹¹, -SON(R¹¹)₂, -SO₂NR¹¹COR¹¹, -C≡N, -C(O)OR¹¹, -CON(R¹¹)₂, -CON(R¹¹)OR¹¹, -OCON(R¹¹)₂, -NR¹¹COR¹¹, -NR¹¹CON(R¹¹)₂, -NR¹¹COOR¹¹, o -N(R¹¹)₂;

R² y R²¹ son -L³-R⁷, en donde

Cada L³ es independientemente un enlace o -(CH₂)_m-V¹-(CH₂)_n-, en donde

n es 0-6; y

V^1 es $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-NR^{11}-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-OCO-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CONR^{10}-$, $-C(=N-R^{11})-$, $-C(=N-OR^{11})-$, $-C[=N-N(R^{11})_2]$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, $-SO_2N(R^{10})-$, $-NR^{10}CONR^{10}-$, $-NR^{10}CSNR^{10}-$, cicloalquilo de C_3-C_6 o ciclohaloalquilo de C_3-C_6 ;

O cada L^3 es independientemente alidilo de C_2-C_6 ,

En donde la cadena de alidilo está interrumpida optativamente por $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-NR^{11}-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO_2-$, o $-SO_2N(R^{10})-$; y

Cada R^7 es independientemente hidrógeno, halógeno, nitro, arilo, heteroarilo, heterociclilo, $-Z-$, $-Y-Z-$, o $-X-Y-Z$, en donde

X es $-O-$;

Y es $-[C(R^{15})_2]_m-$, alqueno de C_2-C_6 , o cicloalquilo de C_3-C_6 ; y

Z es $-H$, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-C(=N-OH)R^{11}$, $-C(=S)N(R^{11})_2$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, o $-OC(=O)-N(R^{11})_2$,

En donde R^7 se sustituye optativamente con uno o más R^{7a} , en donde

58
911

R^{7a} es halógeno, haloarilo, ariloxi, aralquilo, ariloxialquilo, aril alquilcarboxi de C_0-C_6 , $C(R^{11})=C(R^{11})-COOH$, arilo, heteroarilo, heterociclilo, heterociclioxi, heteroariloxi, $-Z'$, $-Y'-Z'$, o $-X'-Y'-Z'$, en donde

X' es $-O-$;

Y' es $-[C(R^{15})_2]_m$ o cicloalquilo de C_3-C_8 ; y

Z' es $-H$, halógeno, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-S(=O)_2R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})$, $-N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})C(=O)R^{11}$, $-CN$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, $-OC(=O)-OR^{11}$, $-N(R^{11})C(=O)-R^{11}$, o $-N(R^{11})S(=O)_2R^{11}$,

En donde cada R^{7a} se sustituye optativamente con uno o más R^8 ,

En donde cada R^8 es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de $C_1-C_6(OR^{11})$, alquilo de $C_0-C_6OR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_0-C_6COR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$, o alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{11}$,

Siempre que R^2 y R^{21} no sean simultáneamente hidrógeno,

R^3 es $-L-R^6$, en donde

L es un enlace, $-X^3-(CH_2)_n-X^3-$, $-(CH_2)_m-X^3-(CH_2)_n-$ o $-(CH_2)_{1+w}-Y^3-(CH_2)_w-$, en donde

n es 0-6; cada w es independientemente 0-5; y

cada X^3 es independientemente un enlace, $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C\equiv C$, $-CO-$, $-CS-$, $-CONR^{10}-$, $-C(=N)(R^{11})-$, $-C(=N-OR^{11})-$, $-[N-N(R^{11})_2]$, $-CO_2-$, $-SO_2-$, o $-SO_2N(R^{10})-$; y

86
912

Y^3 es $-O-$, $-S-$, $-NR^7-$, $-N(R^{10})CO-$, $N(R^{10})CO_2-$, $-OCO-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-NR^{10}CONR^{10}-$, $-N(R^{10})SO_2-$, o $-NR^{10}CSNR^{10}-$;

o L es una cadena de alidilo en donde la cadena de alidilo está optativamente interrumpida por $-C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})_2C(R^{11})_2-$, $-C(R^{11})=C(R^{11})-$, $-C(R^{11})_2O-$, $-C(R^{11})_2NR^{11}-$, $-C\equiv C-$, $-O-$, $-S-$, $-N(R^{10})CO-$, $-N(R^{10})CO_2-$, $-CON(R^{10})-$, $-CO-$, $-CO_2-$, $-OC(=O)-$, $-OC(=O)N(R^{10})-$, $-SO_2-$, $-N(R^{10})SO-$, o $-SO_2N(R^{10})$; y

R^6 es alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , arilo, cicloalquilo de C_3-C_8 , heteroarilo, heterociclilo, $-CN$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2-$, $-N(R^{11})_2$, $-SO_2R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(OR^{11})$, en donde el arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterociclilo se sustituye optativamente con uno o más R^{6a} , en donde cada R^{6a} es independientemente $-Z''$, $-Y''-Z''$, o $-X''-Y''-Z''$, en donde

X'' es $-O-$;

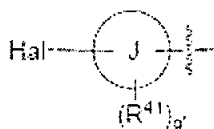
Y'' es $-[C(R^{15})_2]_m-$, alquenilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , heterociclilo, arilo o heteroarilo, en donde

El arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterociclilo optativamente se sustituye con por lo menos un grupo que es cada uno independientemente Z'' ;

Z'' es $-H$, $-CN$, halógeno, $-OR^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})_2$, $-N_3$, $-SO_2R^{11}$, $-S(=O)_2N(R^{11})_2$, $-C(=O)N(R^{11})N(R^{11})_2$, $-N(R^{11})C(=O)N(R^{11})_2$, $-OC(=O)-OR^{11}$, $-C(=O)N(R^{11})(OR^{11})$, $-OC(=O)-R^{11}$, $-OC(=O)-N(R^{11})_2$, o $-N(R^{11})COOR^{11}$; y

57
913

G es un grupo de la fórmula



, en donde

Hal es halógeno;

J es arilo o heteroarilo;

cada R^{41} es independientemente halógeno, nitro, $\text{CR}^{11}=\text{CR}^{11}\text{COOR}^{11}$, ariloxi, aralquilo, ariloxialquilo, aril alquilcarboxi de $\text{C}_0\text{-C}_6$, arilo, heteroarilo, heterociclilo, heteroariloxi, heterociclioxi, $-\text{G}^1$, $-\text{E}-\text{G}^1$, o $-\text{D}-\text{E}-\text{G}^1$, en donde

D es $-\text{O}-$;

E es $-\text{C}(\text{R}^{15})_2\text{-}$ o cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_8$; y

G^1 es alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$, $-\text{CON}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{OCN}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{OCOOR}^{11}$, $-\text{N}_3$, $-\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{NR}^{11}\text{COOR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{COR}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, $-\text{SOR}^{11}$, o $-\text{SR}^{11}$,

En donde cada R^4 se sustituye optativamente con uno o más R^{4a} ,

En donde cada R^{4a} es independientemente halógeno, ariloxi, analquilo, ariloxialquilo, alcoxiarilo de $\text{C}_1\text{-C}_6$, aril alquilcarboxi de $\text{C}_0\text{-C}_6$, $-\text{G}'$, $-\text{E}'-\text{G}'$, o $-\text{D}'-\text{E}'-\text{G}'$, en donde

D' es $-\text{O}-$;

E' es $-\text{C}(\text{R}^{15})_2\text{-}$ o cicloalquilo de $\text{C}_3\text{-C}_8$; y

G' es $-\text{H}$, halógeno, $-\text{COR}^{11}$, $-\text{COOR}^{11}$, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$, o $-\text{SR}^{11}$,

cada m es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;

q' es 0, 1, 2, 3, o 4

cada R^{10} es independientemente $-R^{11}$, $-C(=O)R^{11}$, $-CO_2R^{11}$, o $-SOR^{11}$;

cada R^{11} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 , -haloalquilo de C_1-C_6 , $-N(R^{12})_2$, arilo, alquilo (de C_1-C_6)-arilo, heteroarilo, alquilo (de C_1-C_6)heteroarilo, heterociclilo, o alquilo (de C_1-C_6)-heterociclilo,

en donde cualquiera de R^{11} se sustituye optativamente con uno o más radicales de R^{12} ;

cada R^{12} es independientemente halógeno, haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , (alquilo de C_0-C_6) $C=O(OR^{13})$; alquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6COR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2R^{13}$, alquilo de $C_0-C_6CON(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{13}OR^{13}$, alquilo de $C_0-C_6SO_2N(R^{13})_2$, alquilo de $C_0-C_6SR^{13}$, haloalquilo de $C_0-C_6OR^{13}$, ariloxi, aralquiloxi, ariloxialquilo, alcoxiarilo de C_0-C_6 , arilalquilcarboxi de C_0-C_6 , alquilo de $C_0-C_6N(R^{13})_2$, $-NR^{13}SO_2R^{13}$, o -Oalquilo de $C_0-C_6COOR^{13}$;

cada R^{13} es independientemente hidrógeno, alquilo de C_1-C_6 , alquenilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_8 , (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , (cicloalquenilo de C_3-C_8)-alquilo de C_1-C_6 , o (cicloalquilo de C_3-C_8)-alquenilo de C_2-C_6 ;

cada R^{14} es independientemente alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alquilo de $C_1-C_6CON(R^{11})_2$, alquilo de $C_0-C_6CONR^{11}OR^{11}$, alquilo de $C_0-C_6OR^{11}$, o alquilo de $C_0-C_6COOR^{11}$.

42. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o un derivado farmacéuticamente aceptable de él en un portador farmacéuticamente aceptable.

43. Un método para tratar, prevenir, inhibir o mejorar los síntomas de una enfermedad o trastorno que está modulado o afectado de otro modo por la actividad de un receptor nuclear o en el cual está implicada la actividad de un receptor nuclear, que comprende administrar a un sujeto que lo necesita, una cantidad terapéuticamente aceptable de un compuesto de acuerdo con la parte (A) de la reivindicación 1, en donde la enfermedad o el trastorno es hipercolesterolemia, hiperlipoproteinemia, hipertrigliceridemia, lipodistrofia, hiperglucemia, diabetes mellitus, dislipidemia, aterosclerosis, enfermedad de cálculos biliares, acné común, condiciones de la piel acneiforme, diabetes, enfermedad de Parkinson, cáncer, enfermedad de Alzheimer, inflamación, trastornos inmunológicos, trastornos de los lípidos, obesidad, condiciones caracterizadas por una función de la barrera epidérmica perturbada, condiciones de diferenciación

60.
9/6

interrumpida, o exceso de la proliferación de la epidermis o de la membrana mucosa, trastornos cardiovasculares.

917

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
MAYA RODRIGUEZ CARLOS ORLANDO
Apoderado(a) y/o Representante de
EXELIXIS, INC

REFERENCIA	Radicación No.	08 7227
	Solicitud internacional	PCT/US2006/024757
	Fecha inicio fase nacional	27/01/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	3947

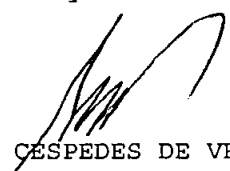
Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

2. El solicitante deberá presentar el correspondiente pago por excedente de palabras para publicación en la gaceta de propiedad industrial.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 14 MAR. 2008
adpall