



**TMTAMAYO**  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

1/81

Señor

**JEFE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
E. S. D.**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**No. 08-044683- -00007-0000**

Fecha: 2012-06-14 15:43:29 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 523 RESPUESTA Folios: 81

**REF: EXPEDIENTE: 08-44683**

**TITULO: "INHIBIDORES MEK Y MÉTODOS PARA SU USO "**

**ACTUACIÓN: RESPUESTA A EXAMEN DE PATENTABILIDAD**

**CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ**, mayor de edad, vecino de esta ciudad, identificado con la Cédula de Ciudadanía No.17.117.818 expedida en Bogotá, Abogado titulado en ejercicio y portador de la Tarjeta Profesional No. 17.402 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad **EXELIXIS INC** Según poderes debidamente conferidos y legalizado, adjunto al expediente de la referencia.

Encontrándome dentro del término legal comparezco para responder el oficio de Requerimiento **No. 02962** del Examen de Patentabilidad emanado de esa Oficina, **del cual pedimos prórroga**, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de 2.000 de C.A.N, damos respuesta en los siguientes términos.

### **3.- De la solicitud de patente**

#### **5.2.- Reivindicaciones**

Para atender el requerimiento, según el artículo 30 de la Decisión 486, del señor Examinador, se presenta un nuevo pliego reivindicatorio de 38 reivindicaciones, en reemplazo del anterior, pliego que está enteramente sustentado en la memoria descriptiva original sin que se amplíe el alcance de la invención

Con estas nuevas reivindicaciones se ha especificado claramente en el final de la cláusula principal, la cantidad de átomos de carbono de cada uno de los radicales mencionado en dicha cláusula.

El sustento para dichas enmiendas puede encontrarse en el texto de la memoria descriptiva presentada originalmente, de acuerdo a la siguiente tabla:



#### **COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### **USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



| Radical                     | Número de Carbonos | Ubicación en la Memoria (párrafo N°)     |
|-----------------------------|--------------------|------------------------------------------|
| Alquenilo                   | C1-C6              | 0030                                     |
| Alquenilcarbonilo           | C1-C6              | 0030, 0031                               |
| Alqueniloxicarbonilo        | C1-C6              | 0030, 0032                               |
| Alcoxi                      | C1-C8              | 0033, 0037                               |
| Alcoxialquilo               | C1-C8              | 0034, 0037                               |
| Alcoxycarbonilo             | C1-C8              | 0035, 0037                               |
| Alquilo                     | C1-C8              | 0037                                     |
| Alquilamino                 | C1-C8              | 0037, 0038                               |
| Alquilaminocarbonilo        | C1-C8              | 0037, 0038, 0040                         |
| Alquinilo                   | C1-C8              | 0037, 0041                               |
| Alquilcarbonilamino         | C1-C8              | 0037, 0042                               |
| Alquilsulfonilamino         | C1-C8              | 0037, 0044                               |
| Alquinilo                   | C2-C8              | 0045                                     |
| Arilo o arileno             | C6-C14             | 0048 (arilo), 0049 (arileno)             |
| Arilalquilo                 | C1-C8              | 0037, 0050                               |
| Arilalquiloxi               | C1-C8              | 0037, 0050, 0070                         |
| Arilalquiloxicarbonilo      | C1-C8              | 0037, 0050, 0071                         |
| Ariloxi                     | C6-C14             | 0048, 0072                               |
| Ariloxicarbonilo            | C6-C14             | 0048, 0072, 0073                         |
| Carboxi éster               | C1-C8              | 0037, 0051                               |
| Cicloalquilo                | C3-C10             | 0052                                     |
| Cicloalquiloxicarbonilo     | C3-C10             | 0052, 0075                               |
| Dialquilamino               | C1-C8              | 0037, 0053                               |
| Dialquilaminocarbonilo      | C1-C8              | 0037, 0038, 0055                         |
| Haloalcoxi                  | C1-C8              | 0037, 0057, 0059                         |
| Haloalquilo                 | C1-C8              | 0037, 0059                               |
| Heteroarilo o heteroarileno | C5-C14             | 0060 (heteroarilo), 0061 (heteroarileno) |
| Heterocicloalquilo          | C3-12              | 0062                                     |
| Hidroxialquilo              | C1-C8              | 0037, 0063                               |

#### 4.- Excepciones de patentabilidad

Atendiendo el requerimiento del señor examinador respecto de que las reivindicaciones 39-43 no son patentables por relacionarse con métodos de tratamientito aplicados a seres humanos o a animales.

Se han eliminado las anteriores cláusulas 39-43, dirigidas al método de tratamiento, cumpliendo así con este requerimiento.

#### 6.- Análisis de Patentabilidad artículo 14 D486



**COLOMBIA:**  
Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**  
COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



**TM TAMAYO**  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

3

### 6.1.- NOVEDAD (Artículo 16 D486)

El Sr. Examinador ha reconsiderado que las reivindicaciones 1, 3-7, 9, 10, 22 y 38 carecen de novedad frente al documento D1 (WO 2004/113347). Estas reivindicaciones se relacionan con el grupo B de fórmula I, D1 también fue citado como afectando la novedad de la presente invención en el Informe Preliminar Internacional sobre la Patentabilidad (IPRP) y durante la prosecución de la solicitud Europea equivalente a la presente solicitud. Al igual que en el caso Europeo, el Solicitante manifiesta lo siguiente con relación a dicha objeción:

En D1, la fórmula (I) tiene un grupo "(Alk1)<sub>n</sub>Cy1" sobre la porción piridina. Aunque N puede ser 0, el grupo Cy1 debe estar presente. Cy1 se define como un grupo cicloalifático, aromático, o heteroaromático. En el grupo B de la fórmula I de la presente solicitud, no hay opción para heteroarileno, para ser sustituido con una porción cíclica. Por lo tanto, las reivindicaciones resultan novedosas respecto a D1.

### 6.2 Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

EL Sr. Examinador considera que las reivindicaciones 1 a 38 carecen de mérito inventivo frente a lo divulgado en los documentos D2 (WO 99/01421) y D3 (WO 2005/051301), incorrectamente citado como WO 2005/051321 en el Examen de Patentabilidad.

El Sr. Examinador afirma que las diferencias entre los compuestos reivindicados en la presente invención y los compuestos revelados en D2 y D3 es que los compuestos reivindicados identifican específicamente el anillo de azetidina. D2 y D3, junto a una referencia adicional, también fueron citados como afectando el mérito inventivo de la presente invención en el Informe Preliminar Internacional sobre la Patentabilidad (IPRP) y durante la prosecución de la solicitud Europea equivalente a la presente solicitud. Al igual que en el caso Europeo, el Solicitante manifiesta lo siguiente con relación a dicha objeción:



#### COLOMBIA:

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### USA:

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



**TMTAMAYO**  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

4

El Solicitante ha descubierto que el grupo azetidina puede estar unido a través de un carbonilo a una variedad de anillos que tienen un sustituyente orto-fenilamino, que produce compuestos que son inhibidores de MEK. El anillo A en la presente invención puede ser arileno (Grupo A), heteroarileno (Grupo B), piridinona o piridazinona (Grupo C), y piridiminona (Grupo D). D2 está solamente dirigido a fenileno, y D3 está dirigido solamente a pirazinona, piridinona, piridazinona. Ninguna de estas referencias sugiere que la azetidina podría combinarse con los posibles anillos en los grupos A, B, C y D. Las reivindicaciones presentan mérito inventivo frente a D2 y D3, ya porque el Solicitante ha descubierto que la porción de azetidina puede combinarse con una amplia variedad de anillos A para dar los compuestos de la invención.

Las divulgaciones de D2 y D3 no se acercan a identificar a la azetidina con ninguna particularidad. NO se revela ningún compuesto específico con azetidina. No hay esquemas en ningún documento que enseñe cómo hacer los intermediarios azetidínicos para hacer los compuestos de la presente invención. No hay ninguna sugerencia en estos documentos que pudiera conducir a un experto en la materia a seleccionar un grupo  $-C(O)$ -azetidínico de las muchas porciones cíclicas y acíclicas posibles. La azetidina no está citada como una opción posible para el anillo R6/R7 en D2, y D3 cita a la azetidina dentro de la definición de heteroarilo dentro de una lista que contiene más de 40 opciones.

Además, D2 y D3 no revelan ningún compuesto específico con un anillo de cualquier medida en donde los presentes compuestos tienen azetidina. En D2, los ejemplos específicos para  $-C(O)-N$  R6/R7 se limitan a compuestos en donde uno de R6 o R7 es tetrazolilo, ciclohexilo, ciclopropilo o fenilo y no hay compuestos en donde R6 y R7 junto con el átomo de nitrógeno forman un anillo. En D3, los compuestos incluyen heteroarilos unidos directamente, pero no revela anillos unidos a carbonilo.

Las divulgaciones de D2 y D3 son tan amplias, y los compuestos revelados específicamente son tan distintos, que no hay enseñanza, sugerencia o



**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



TM TAMAYO  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

5

motivación para hacer las modificaciones estructurales particulares, necesarias para llegar a la presente invención.

Por estas razones, el Solicitante considera que los compuestos tal como se encuentran reivindicados en el actual pliego reivindicatorio son inventivos frente a D2 y D3.

Por lo antes expuesto, ruego a usted dar por subsanado dicho requerimiento, sin perjuicio de lo cual desde ya nos acogemos a lo dispuesto por el inciso segundo del artículo 45 de la decisión 486 de la Comunidad Andina de Naciones que a la letra dice: "(...) Cuando la oficina nacional competente estimare que ello es necesario para los fines del examen de patentabilidad, podrá notifica al solicitante dos o más veces (...)" (Subrayado para destacar).

#### NOTIFICACIONES

Mi poderdante y yo recibiremos notificaciones en la Secretaría de su Despacho o en mi Oficina de Abogado ubicada en la Carrera 13A No. 28-38 Ofc. 230 MZ. 2 Parque Central Bavaria de la ciudad de Bogotá D.C.

Del señor Jefe,

CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ

No.17.117.818 expedida en Bogotá,

T.P No. 17.402 del C.S.J.



#### COLOMBIA:

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### USA:

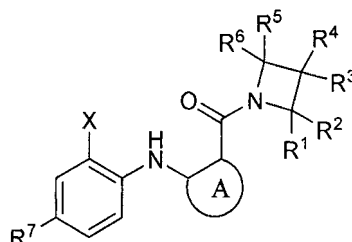
COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto caracterizado por la Fórmula I



5

I

o un estereoisómero simple o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente como una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él, en donde A, X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, y R<sup>7</sup> son lo definido en el Grupo A, el Grupo B, el Grupo C, o el Grupo

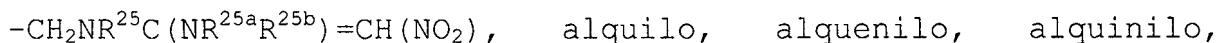
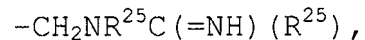
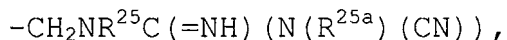
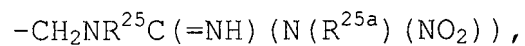
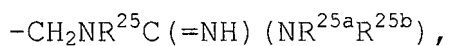
10 D:

Grupo A:

A es arileno optativamente sustituido con uno, dos, tres o cuatro grupos seleccionados de R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>14</sup>, y R<sup>16</sup> donde R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>14</sup> y R<sup>16</sup> son independientemente hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halo, haloalcoxi, hidroxilo, alcoxi, amino, alquilamino, dialquilamino, haloalquilo, -NHS(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, -CN, -C(O)R<sup>8</sup>, -C(O)OR<sup>8</sup>, -C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup> y -NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8'</sup>

X es alquilo, halo, haloalquilo, o haloalcoxi;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son independientemente hidrógeno, halo, nitro, -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -OR<sup>8</sup>, -NHS(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, -CN, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>8</sup>, -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -C(O)R<sup>8</sup>, -C(O)OR<sup>8</sup>, -C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8'</sup>R<sup>8''</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8'</sup>, -CH<sub>2</sub>N(R<sup>25</sup>)(NR<sup>25a</sup>R<sup>25b</sup>),



cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo; donde el

5 alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, y

heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente

con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos

seleccionados independientemente de halo, alquilo,

haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido,

10 heterocicloalquilo optativamente sustituido, ariko

optativamente sustituido, arilalquilo optativamente

sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $-\text{OR}^8$ ,  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ,

$-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^9$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ,

$-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{NR}^{8'}\text{R}^{8''}$ ,  $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8'}$  y  $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^{8'}$ ; o uno de  $\text{R}^1$  y  $\text{R}^2$  junto

15 con el carbono al cual están unidos,  $\text{R}^3$  y  $\text{R}^4$  junto con el

carbono al cual están unidos, y  $\text{R}^5$  y  $\text{R}^6$  junto con el carbono al

cual están unidos, forma  $\text{C}(\text{O})$  o  $\text{C}(=\text{NOH})$ ;

$m$  es 0, 1, o 2;

$\text{R}^7$  es hidrógeno, halo o alquilo;

20  $\text{R}^8$ ,  $\text{R}^{8'}$  y  $\text{R}^{8''}$  se seleccionan independientemente de hidrógeno,

hidroxi, alcoxi optativamente sustituido, alquilo, alquenilo,

alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, y

heterocicloalquilo; donde el alquilo, alquenilo, alquinilo,

arilo, cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se

25 sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres,

cuatro o cinco grupos seleccionados independientemente de  
 alquilo, halo, hidroxilo, hidroxialquilo, alcoxi optativamente  
 sustituido, alcoxialquilo, haloalquilo, carboxi,  
 alcoxycarbonilo, alquenoiloxycarbonilo, cicloalquilo  
 5 optativamente sustituido, cicloalquiloiloxycarbonilo  
 optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido,  
 ariloxi optativamente sustituido, ariloxycarbonilo  
 optativamente sustituido, arilalquilo optativamente  
 sustituido, arilalquiloiloxi optativamente sustituido,  
 10 arilalquiloiloxycarbonilo optativamente sustituido, nitro, ciano,  
 heterocicloalquilo optativamente sustituido, heteroarilo  
 optativamente sustituido,  $-S(O)_nR^{31}$  (donde  $n$  es 0, 1, o 2 y  $R^{31}$   
 es alquilo optativamente sustituido, arilo optativamente  
 sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o  
 15 heteroarilo optativamente sustituido),  $-NR^{34}SO_2R^{34a}$  (donde  $R^{34}$   
 es hidrógeno o alquilo y  $R^{34a}$  es alquilo, alquenoilo,  
 cicloalquilo, arilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo),  
 $-SO_2NR^{35}R^{35a}$  (donde  $R^{35}$  es hidrógeno o alquilo y  $R^{35a}$  es alquilo,  
 alquenoilo, cicloalquilo, arilo, heteroarilo, o  
 20 heterocicloalquilo),  $-NR^{32}C(O)R^{32a}$  (donde  $R^{32}$  es hidrógeno o  
 alquilo y  $R^{32a}$  es alquilo, alquenoilo, alcoxi, o cicloalquilo),  
 $-NR^{30}R^{30'}$  (donde  $R^{30}$  y  $R^{30'}$  son independientemente hidrógeno,  
 alquilo o hidroxialquilo), y  $-C(O)NR^{33}R^{33a}$  (donde  $R^{33}$  es  
 hidrógeno o alquilo y  $R^{33a}$  es alquilo, alquenoilo, alquinoilo o  
 25 cicloalquilo); y

$R^9$  es alquilo, alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo; donde el alquilo, alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo se sustituyen optativa e independientemente con uno, dos, tres, cuatro, o cinco grupos seleccionados de halo, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, haloalcoxi, amino, alquilamino, y dialquilamino;

$R^{25}$  y  $R^{25b}$  son independientemente hidrógeno, alquilo, alqueno, cicloalquilo optativamente sustituido, o arilo optativamente sustituido; y

$R^{25a}$  es hidrógeno, alquilo, o alqueno;

Grupo B:

A es heteroarileno optativamente sustituido con uno, dos, tres o cuatro grupos seleccionados de  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{16}$  y  $R^{19}$  donde  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son independientemente hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, halo, haloalcoxi, hidroxilo, alcoxi, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, haloalquilo, alquilsulfonilamino, alquilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquenoiloxycarbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, o alquilcarbonilamino; donde  $R^{19}$  es hidrógeno, alquilo o alqueno; y donde cada alquilo y alqueno, solo o como parte de otro grupo dentro de  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{16}$ , y  $R^{19}$ , se sustituye optativamente con halo, hidroxilo, o alcoxi;

X es alquilo, halo, haloalquilo, o haloalcoxi;

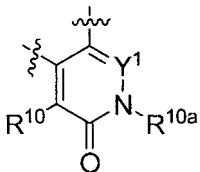
- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $R^6$  son independientemente hidrógeno, halo, nitro,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-OR^8$ ,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ , alquilo, alquenilo, alquinilo,
- 5 cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo, donde el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo,
- 10 haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,
- 15  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ; o uno de  $R^1$  y  $R^2$  junto con el carbono al cual están unidos,  $R^3$  y  $R^4$  junto con el carbono al cual están unidos, y  $R^5$  y  $R^6$  junto con el carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ;
- $m$  es 1 o 2;
- 20  $R^7$  es hidrógeno, halo o alquilo; y  $R^8$ ,  $R^{8'}$  y  $R^{8''}$  se seleccionan independientemente de hidrógeno, hidroxilo, alcoxi optativamente sustituido, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo, donde el alquilo,
- 25 aluquenilo, alquinilo, arilo, cicloalquilo, heteroarilo y

heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente  
 con uno, dos, tres, cuatro o cinco grupos seleccionados  
 independientemente de alquilo, halo, hidroxilo, hidroxialquilo,  
 alcoxi optativamente sustituido, alcoxialquilo, haloalquilo,  
 5 carboxi, carboxi éster, nitro, ciano,  $-S(O)_nR^{31}$  (donde n es 0,  
 1, o 2 y  $R^{31}$  es alquilo optativamente sustituido, arilo  
 optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente  
 sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o  
 heteroarilo optativamente sustituido),  $-NR^{36}S(O)_2R^{36a}$  (donde  $R^{36}$   
 10 es hidrógeno, alquilo, o alquenilo y  $R^{36a}$  es alquilo,  
 alquenilo, arilo optativamente sustituido, cicloalquilo  
 optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente  
 sustituido, o heteroarilo optativamente sustituido),  
 $-S(O)_2NR^{37}R^{37a}$  (donde  $R^{37}$  es hidrógeno, alquilo, o alquenilo y  
 15  $R^{37a}$  es alquilo, alquenilo, arilo optativamente sustituido,  
 cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo  
 optativamente sustituido, o heteroarilo optativamente  
 sustituido), cicloalquilo optativamente sustituido,  
 heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo  
 20 optativamente sustituido, arilalquilo optativamente  
 sustituido, ariloxi optativamente sustituido, arilalquiloxi  
 optativamente sustituido, heteroarilo optativamente  
 sustituido,  $-NHC(O)R^{32}$  (donde  $R^{32}$  es alquilo, alquenilo, alcoxi,  
 o cicloalquilo) y  $-NR^{30}R^{30'}$  (donde  $R^{30}$  y  $R^{30'}$  son  
 25 independientemente hidrógeno, alquilo, o hidroxialquilo), y

$-C(O)NHR^{33}$  (donde  $R^{33}$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, o cicloalquilo);

Grupo C:

A es



donde  $R^{10}$  es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halo, haloalcoxi, hidroxí, alcoxi, amino, alquilamino, dialquilamino, haloalquilo,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ;

10  $R^{10a}$  es hidrógeno, alquilo, o alquenilo;

$Y^1$  es  $=CH-$  o  $=N-$ ;

X es alquilo, halo, haloalquilo, o haloalcoxi;

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  and  $R^6$  son independientemente hidrógeno, halo, nitro,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-OR^8$ ,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,

15  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$ ,

$-NR^8C(O)NR^8R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$ ,  $-NR^8C(O)R^8$ , alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo, donde el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo se sustituyen independiente y

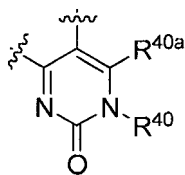
20 optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo, haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo

optativamente sustituido, arilalquilo optativamente  
 sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ; o uno de  $R^1$  y  $R^2$  junto  
 5 con el carbono al cual están unidos,  $R^3$  y  $R^4$  junto con el  
 carbono al cual están unidos, y  $R^5$  y  $R^6$  junto con el carbono al  
 cual están unidos, forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ;  
 m es 1 o 2;  
 $R^7$  es hidrógeno, halo o alquilo; y  
 10  $R^8$ ,  $R^{8'}$  y  $R^{8''}$  se seleccionan independientemente de hidrógeno,  
 hidroxilo, alcoxi optativamente sustituido, alquilo,  
 haloalquilo, alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo,  
 heteroarilo, y heterocicloalquilo, donde el alquilo,  
 alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo y  
 15 heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente  
 con uno, dos, tres, cuatro o cinco grupos seleccionados  
 independientemente de alquilo, halo, hidroxilo, hidroxialquilo,  
 alcoxi optativamente sustituido, alcoxialquilo, haloalquilo,  
 carboxi, carboxi éster, nitro, ciano,  $-S(O)_nR^{31}$  (donde n es 0,  
 20 1, o 2 y  $R^{31}$  es alquilo optativamente sustituido, arilo  
 optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente  
 sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o  
 heteroarilo optativamente sustituido),  $-NR^{36}S(O)_2R^{36a}$  (donde  $R^{36}$   
 es hidrógeno, alquilo, o alqueno y  $R^{36a}$  es alquilo,  
 25 alqueno, arilo optativamente sustituido, cicloalquilo

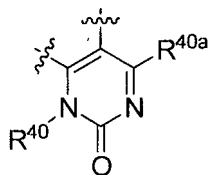
optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente  
 sustituido, o heteroarilo optativamente sustituido),  
 $-S(O)_2NR^{37}R^{37a}$  (donde  $R^{37}$  es hidrógeno, alquilo, o alquenilo y  
 $R^{37a}$  es alquilo, alquenilo, arilo optativamente sustituido,  
 5 cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo  
 optativamente sustituido, o heteroarilo optativamente  
 sustituido), cicloalquilo optativamente sustituido,  
 heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo  
 optativamente sustituido, arilalquilo optativamente  
 10 sustituido, ariloxi optativamente sustituido, arilalquiloxi  
 optativamente sustituido, heteroarilo optativamente  
 sustituido,  $-NHC(O)R^{32}$  (donde  $R^{32}$  es alquilo, alquenilo, alcoxi,  
 o cicloalquilo) y  $-NR^{30}R^{30'}$  (donde  $R^{30}$  y  $R^{30'}$  son  
 independientemente hidrógeno, alquilo, o hidroxialquilo), y  
 15  $-C(O)NHR^{33}$  (donde  $R^{33}$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, o  
 cicloalquilo); o

Grupo D:

A es



(b) o



(c)

R<sup>40</sup> y R<sup>40a</sup> son independientemente hidrógeno o alquilo;

X es alquilo, halo, haloalquilo, o haloalcoxi;

- 5 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son independientemente hidrógeno, halo, nitro, -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -OR<sup>8</sup>, -NHS(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, -CN, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>8</sup>, -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -C(O)R<sup>8</sup>, -C(O)OR<sup>8</sup>, -C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8'</sup>R<sup>8''</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8'</sup>, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo, donde el
- 10 alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo, haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido,
- 15 heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido, -OR<sup>8</sup>, -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -CN, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>9</sup>, -C(O)R<sup>8</sup>, -C(O)OR<sup>8</sup>, -C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8'</sup>R<sup>8''</sup>, -NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8'</sup> y -NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8'</sup>; o uno de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto
- 20 con el carbono al cual están unidos, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> junto con el carbono al cual están unidos, y R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> junto con el carbono al cual están unidos, forman C(O) o C(=NOH);
- m es 1 o 2;

$R^7$  es hidrógeno, halo o alquilo; y  
 $R^8$ ,  $R^{8'}$  y  $R^{8''}$  se seleccionan independientemente de hidrógeno, hidroxilo, alcoxi optativamente sustituido, alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo, donde el alquilo, alqueno, alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se sustituyen optativa e independientemente con uno, dos, tres, cuatro, o cinco grupos seleccionados independientemente de alquilo, halo, hidroxilo, hidroxialquilo, alcoxi optativamente sustituido, alcoxialquilo, haloalquilo, carboxi, carboxi éster, nitro, ciano,  $-S(O)_nR^{31}$  (donde  $n$  es 0, 1, o 2 y  $R^{31}$  es alquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o heteroarilo optativamente sustituido),  $-NR^{36}S(O)_2R^{36a}$  (donde  $R^{36}$  es hidrógeno, alquilo, o alqueno y  $R^{36a}$  es alquilo, alqueno, arilo optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o heteroarilo optativamente sustituido);  $-S(O)_2NR^{37}R^{37a}$  (donde  $R^{37}$  es hidrógeno, alquilo, o alqueno y  $R^{37a}$  es alquilo, alqueno, arilo, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, o heteroarilo optativamente sustituido), cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo

optativamente sustituido, ariloxi optativamente sustituido, arilalquiloxi optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $\text{-NHC(O)R}^{32}$  (donde  $\text{R}^{32}$  es alquilo, alquenilo, alcoxi, o cicloalquilo) y  $\text{-NR}^{30}\text{R}^{30'}$  (donde  $\text{R}^{30}$  y  $\text{R}^{30'}$  son independientemente hidrógeno, alquilo, o hidroxialquilo), y  $\text{-C(O)NHR}^{33}$  (donde  $\text{R}^{33}$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, o cicloalquilo);

en donde, todos los grupos alquenilo, alquenilcarbonilo y alqueniloxycarbonilo de la presente reivindicación contienen de 1 a 6 átomos de carbono;

todos los grupos alcoxi, alcoxialquilo, alcoxycarbonilo, alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo, arilalquiloxi, arilalquiloxyccarbonilo, carboxiéster, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi, haloalquilo e hidroxialquilo de la presente reivindicación contienen de 1 a 8 átomos de carbono;

todos los grupos alquinilo de la presente reivindicación contienen de 2 a 8 átomos de carbono;

todos los grupos arilo, arileno, ariloxi, ariloxycarbonilo, de la presente reivindicación contienen de 6 a 14 átomos de carbono;

todos los grupos cicloalquilo y cicloalquiloxyccarbonilo de la presente reivindicación contienen de 3 a 10 átomos de carbono;

todos los grupos heteroarilo y heteroarileno de la presente reivindicación contienen de 5 a 14 átomos de carbono; y todos los grupos heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de 3 a 12 átomos de carbono.

5

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A, el Grupo B y el Grupo C, donde

Grupo A

10 A es fenileno optativamente sustituido con uno o dos grupos seleccionados de  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$ , y  $R^{16}$  donde  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son independientemente hidrógeno o halo;

X es halo;

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$  y  $R^6$  son hidrógeno;

15  $R^3$  es hidrógeno, halo, hidroxilo, alcoxi, o amino;

$R^4$  es hidrógeno,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,

$-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,

$-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,

$-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquilo,

20 alqueno, cicloalquilo, heterocicloalquilo, o heteroarilo;

donde el alquilo se sustituye optativamente con uno, dos, o

tres grupos seleccionados independientemente de  $-OR^8$ , halo,

nitro,  $-S(O)_mR^9$ , heterocicloalquilo optativamente sustituido,

$-NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ , y arilo; donde el

25 cicloalquilo se sustituye optativamente con uno o dos grupos

seleccionados independientemente de  $-OR^8$  y  $-NR^8R^{8'}$ ; donde el heterocicloalquilo se sustituye optativamente con uno o dos grupos seleccionados independientemente de alquilo y  $-C(O)OR^8$ ; y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$ ;

5 o

$R^3$  y  $R^4$  junto con el carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ;

m es 0;

$R^7$  es halo;

10  $R^8$  y  $R^{8'}$  se seleccionan independientemente de hidrógeno, hidroxilo, alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heterocicloalquilo, heteroarilo, y cicloalquilo;

donde el alquilo de  $R^8$  y  $R^{8'}$  se sustituye optativamente con uno, dos, o tres grupos seleccionados independientemente de

15 hidroxilo,  $-NR^{30}R^{30'}$  (donde  $R^{30}$  y  $R^{30'}$  son independientemente hidrógeno, alquilo, o hidroxialquilo), heteroarilo optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente sustituido), alcoxi optativamente sustituido, cicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido,

20 heterocicloalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $-C(O)NR^{33}R^{33a}$  (donde  $R^{33}$  es hidrógeno o alquilo y  $R^{33a}$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, o cicloalquilo), ariloxi optativamente sustituido,  $-S(O)_nR^{31}$  (donde n es 0 y  $R^{31}$  es alquilo), carboxi, alcoxycarbonilo, y

25  $-NR^{32}C(O)R^{32a}$  (donde  $R^{32}$  es hidrógeno o alquilo y  $R^{32a}$  es alquilo,

alquenilo, alcoxi, o cicloalquilo); o donde el alquilo se  
sustituye optativamente con uno, dos, tres, cuatro o cinco  
halo;

donde el heteroarilo de  $R^8$  y  $R^{8'}$  se sustituye independiente y  
5 optativamente con uno o dos grupos seleccionados  
independientemente de amino y alquilo;

donde el heterocicloalquilo de  $R^8$  y  $R^{8'}$  se sustituye  
independiente y optativamente con uno, dos o tres grupos  
seleccionados independientemente de alquilo, alcoxicarbonilo,  
10 arilalquilo optativamente sustituido, hidroxil, alcoxi, y  
hidroxialquilo;

donde el arilo de  $R^8$  y  $R^{8'}$  se sustituye independiente y  
optativamente con uno o dos grupos seleccionados  
independientemente de hidroxil, alcoxi, halo,  $-NR^{32}C(O)R^{32a}$   
15 (donde  $R^{32}$  es hidrógeno o alquilo y  $R^{32a}$  es alquilo, alquenilo,  
alcox, o cicloalquilo), y  $-NR^{34}SO_2R^{34a}$  (donde  $R^{34}$  es hidrógeno o  
alquilo y  $R^{34a}$  es alquilo, alquenilo, cicloalquilo, arilo,  
heteroarilo, o heterocicloalquilo); y

donde el cicloalquilo de  $R^8$  y  $R^{8'}$  se sustituye independiente y  
20 optativamente con uno, dos o tres grupos seleccionados  
independientemente de hidroxil, hidroxialquilo, alcoxi,  
carboxi,  $-C(O)NR^{33}R^{33a}$  (donde  $R^{33}$  es hidrógeno o alquilo  $R^{33a}$  es  
alquilo, alquenilo, alquinilo, o cicloalquilo), cicloalquilo  
optativamente sustituido; y

25  $R^9$  es alquilo o arilo;

Grupo B

A es tien-3,4-diilo, benzo[d]isoxazol-5,6-diilo, 1H-indazol-5,6-diilo (optativamente sustituido en la posición N1 con  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquenilo), benzo[d]oxazol-5,6-diilo, 5 1H-benzo[d]imidazol-5,6-diilo (optativamente sustituido en la posición N1  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquenilo), 1H-benzo[d][1,2,3]triazol-5,6-diilo (optativamente sustituido en la posición N1 con  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquenilo), imidazo[1,2-a]piridin-6,7-diilo, cinolin-6,7-diilo, quinolin-10 6,7-diilo, piridin-3,4-diilo, 1-oxido-piridin-3,4-diilo, [1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-6,7-diilo, o 2,3-dihidroimidazo[1,2-a]piridin-6,7-diilo; donde A se sustituye optativamente con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente de  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{16}$  y  $R^{19}$  donde 15  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son independientemente hidrógeno, alquilo, halo, o amino; y  $R^{19}$  es hidrógeno o alquilo;

X es halo;

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$  y  $R^6$  son hidrógeno;

$R^3$  es hidrógeno o hidroxilo;

20  $R^4$  es  $-NR^8R^{8'}$ , heterocicloalquilo, heteroarilo, o alquilo; donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo;

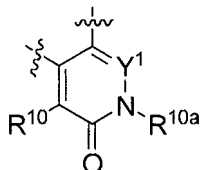
$R^7$  es halo;

$R^8$  es hidrógeno o alquilo; y

$R^{8'}$  es hidrógeno, alquilo, o cicloalquilo; donde el cicloalquilo se sustituye optativamente con uno o dos grupos seleccionados independientemente de hidroxilo y alquilo;

Grupo C

5 A es



(a)

$R^{10}$  es hidrógeno o halo;

$R^{10a}$  es hidrógeno o alquilo;

10  $Y^1$  es  $=CH-$  o  $=N-$ ;

X es halo;

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$  y  $R^6$  son hidrógeno;

$R^3$  es hidrógeno o hidroxilo;

$R^4$  es  $-NR^8R^{8'}$ , heterocicloalquilo, heteroarilo, o alquilo; donde

15 el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo;

$R^7$  es halo;

$R^8$  es hidrógeno o alquilo; y

$R^{8'}$  es hidrógeno, alquilo, o cicloalquilo; donde el

20 cicloalquilo se sustituye optativamente con uno o dos grupos seleccionados independientemente de hidroxilo y alquilo; o

un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él,

en donde, todos los grupos alquenilo, alquenilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxycarbonilo, alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo, arilalquiloxi, arilalquiloxy, carboxiéster, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi, haloalquilo, hidroxialquilo, alquinilo, arilo, arileno, ariloxi, ariloxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalquiloxy, heteroarilo, heteroarileno y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

15

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^3$  es halo, nitro,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-OR^8$ ,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo; donde el alquilo, alquenilo, alquinilo,

25

cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo, haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido, heteroarilalquilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$  y  $-NR^8C(O)R^8$ ; y  $R^4$  es lo definido en la reivindicación 1; o  $R^3$  y  $R^4$  junto con el carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos alquenilo, alquenilcarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo, arilalquiloxi, arilalquiloxicarbonilo, carboxiéster, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi, haloalquilo, hidroxialquilo, alquinilo, arilo, arileno, ariloxi, ariloxicarbonilo, cicloalquilo, cicloalquiloxicarbonilo, heteroarilo, heteroarileno y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^3$  y  $R^4$  son independientemente halo, nitro,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-OR^8$ ,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  
5  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$ ,  $-NR^8C(O)NR^8R^{8''}$ ,  
 $-NR^8C(O)OR^8$ ,  $-NR^8C(O)R^8$ ,  $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquilo, alquenilo, alquinilo,  
10 cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo; donde el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo,  
15 haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido, heteroarilalquilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  
20  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8C(O)NR^8R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$  y  $-NR^8C(O)R^8$ ; o  $R^3$  y  $R^4$  junto con el carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable  
25 de él,

en donde, todos los grupos alquenoilo, alquenoilcarbonilo, alquenoiloxycarbonilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxycarbonilo, alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo, 5 arilalquiloxi, arilalquiloxyccarbonilo, carboxiéster, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi, haloalquilo, hidroxialquilo, alquinoilo, arilo, arileno, ariloxi, ariloxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalquiloxyccarbonilo, heteroarilo, heteroarileno y 10 heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque  $R^7$  es halo; o un solo estereoisómero o una 15 mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque X es halo; o un solo estereoisómero o una 20 mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$  y  $R^6$  son hidrógeno; o un solo 25 estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y

optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1,  
 5 caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es  
 fenileno; y  $R^4$  es  $-NR^8R^{8'}$  (donde  $R^8$  es hidrógeno, hidroxí,  
 alquilo, alcoxi, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o  
 heterocicloalquilo y  $R^{8'}$  es hidroxí, alcoxi, arilo,  
 cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo),  $-NHS(O)_2R^8$ ,  
 10  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  
 $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquénilo, o  
 15 alquínilo; donde el alquénilo y alquínilo se sustituyen  
 optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis, o siete  
 grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo,  
 haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido,  
 heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo  
 20 optativamente sustituido, arilalquilo optativamente  
 sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  
 heteroarilalquilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  
 $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ; o  $R^3$  y  $R^4$  junto con el  
 25 carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ; o un solo

estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos alquenilo, alquenilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxycarbonilo, alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo, arilalquiloxi, arilalquiloxy, carboxiéster, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi, haloalquilo, hidroxialquilo, alquinilo, arilo, arileno, ariloxi, ariloxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalquiloxy, heteroarilo, heteroarileno y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

15

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^3$  es hidrógeno, halo, hidroxilo, amino o  $C_1-C_8$  alcoxi; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

20

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^4$  es hidrógeno,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,

25

$-\text{CH}_2\text{NR}^{25}\text{C}(=\text{NH})(\text{N}(\text{R}^{25a})(\text{CN})),$   $-\text{CH}_2\text{NR}^{25}\text{C}(=\text{NH})(\text{R}^{25}),$   
 $-\text{CH}_2\text{NR}^{25}\text{C}(\text{NR}^{25a}\text{R}^{25b})=\text{CH}(\text{NO}_2),$  alquilo, alquenilo, cicloalquilo,  
 heterocicloalquilo, o heteroarilo; donde el alquilo se  
 sustituye optativamente con uno o dos grupos seleccionados  
 5 independientemente de  $-\text{OR}^8$ , halo, nitro,  $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^9$ ,  
 heterocicloalquilo optativamente sustituido,  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ,  
 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^{8'}$ ,  $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ ,  $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8'}$ , arilo; donde el arilo se  
 sustituye optativamente con uno o dos  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ; donde el  
 heterocicloalquilo se sustituye optativamente con uno o dos  
 10 grupos seleccionados independientemente de alquilo y  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$ ;  
 y donde el heteroarilo se sustituye optativamente cono  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ;  
 o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él  
 y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente  
 aceptable de él;  
 15 en donde, todos los grupos alquenilo, alquenilcarbonilo,  
 alqueniloxicarbonilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo,  
 alquilo, alquilamino, alquilaminocarbonilo,  
 alquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino, arilalquilo,  
 arilalquiloxi, arilalquiloxicarbonilo, carboxiéster,  
 20 dialquilamino, dialquilaminocarbonilo, haloalcoxi,  
 haloalquilo, hidroxialquilo, alquinilo, arilo, arileno,  
 ariloxi, ariloxicarbonilo, cicloalquilo,  
 cicloalquiloxicarbonilo, heteroarilo, heteroarileno y  
 heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de  
 25 la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo B donde A es fenileno optativamente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente de  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  donde  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son independientemente hidrógeno o halo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

10

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno;  $R^3$  es hidrógeno; y  $R^4$  es hidrógeno,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  $C_1-C_8$  alquilo, o  $C_3-C_{12}$  heterocicloalquilo; donde el alquilo se sustituye optativamente con uno o dos grupos seleccionados independientemente de  $-OR^8$  y  $-NR^8R^{8'}$ ; y donde el heterocicloalquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

20

13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno; R es alcoxi; y  $R^4$  es  $C_1-C_8$  alquilo o  $C_3-C_{12}$

25

heterocicloalquilo donde el alquilo se sustituye con  $-NR^8R^{8'}$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

5

14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno;  $R^3$  es halo; y  $R^4$  es  $C_1-C_8$  alquilo o  $C_3-C_{12}$  heterocicloalquilo donde el alquilo se sustituye con  $-NR^8R^{8'}$ ; o  
 10 un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno; y  $R^3$  y  $R^4$  junto con el carbono al cual están unidos forman  $C(O)$  o  $C(=NOH)$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla  
 15 de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

20

16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es hidrógeno,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  
 $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  
 25  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,

$-\text{CH}_2\text{NR}^{25}\text{C}(=\text{NH})(\text{R}^{25})$ ,  $-\text{CH}_2\text{NR}^{25}\text{C}(\text{NR}^{25a}\text{R}^{25b})=\text{CH}(\text{NO}_2)$ , alquilo,  
 alquenilo, heterocicloalquilo, cicloalquilo,  
 heterocicloalquilo, o heteroarilo; donde el alquilo se  
 sustituye optativamente con uno, dos, o tres grupos  
 5 seleccionados independientemente de  $-\text{OR}^8$ , halo, nitro,  
 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^9$ , heterocicloalquilo optativamente sustituido,  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$ ,  
 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^{8'}$ , heteroarilo optativamente sustituido,  $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ ,  
 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8'}$ , y arilo; donde el cicloalquilo se sustituye  
 optativamente con uno o dos grupos seleccionados  
 10 independientemente de  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$  y  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{33}\text{R}^{33a}$ ; donde el  
 heterocicloalquilo se sustituye optativamente con uno, dos o  
 tres grupos seleccionados independientemente de alquilo y  
 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$ ; y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con  $-\text{NR}^8\text{R}^{8'}$   
 ; o un solo estereoisómero o una mezcla de  
 15 estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato  
 farmacéuticamente aceptable de él;  
 en donde, todos los grupos alquenilo, alquilo, arilo,  
 cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo de la presente  
 reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono  
 20 definida en la cláusula 1.

17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17,  
 caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es  
 fenileno;  $\text{R}^7$  es yodo o bromo; X es fluro o cloro; y  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^5$  y  
 25  $\text{R}^6$  son hidrógeno; y  $\text{R}^{10}$ ,  $\text{R}^{12}$ ,  $\text{R}^{14}$  y  $\text{R}^{16}$  son independientemente

hidrógeno o fluoro; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

5 18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, caracterizado porque  $R^{10}$  es 3-fluoro y  $R^{12}$  y  $R^{14}$  son hidrógeno o halo;  $R^{10}$  es 3-fluoro,  $R^{12}$  es 4-fluoro y  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son hidrógeno;  $R^{10}$  es 4-fluoro,  $R^{12}$  es 5-fluoro y  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son hidrógeno;  $R^{10}$  es 4-fluoro,  $R^{12}$  es 6-fluoro y  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son hidrógeno; o  $R^1$  es 4-fluoro y  $R^{10}$ ,  $R^{14}$  y  $R^{16}$  son hidrógeno; o un solo estereoisómero  
10 o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

15 19. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo A donde A es fenileno y  $R^3$  es hidroxilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

20 20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 19 caracterizado porque  $R^4$  es  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ ,  
 $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquilo, cicloalquilo,  
25 heterocicloalquilo, o heteroarilo; donde el alquilo,

cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se sustituye optativamente con uno, dos, tres o cuatro grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo, haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido, heteroarilalquilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^8$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ;  
10 o donde el alquilo se sustituye optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete halo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

15 en donde, todos los grupos alquilo, arilo, arilalquilo, cicloalquilo, haloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

20 21. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, caracterizado porque  $R^4$  es alquilo, heterocicloalquilo, o heteroarilo; donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$ ; donde el heterocicloalquilo se sustituye optativamente con alquilo o  $-C(O)OR^8$ ; y donde el heteroarilo se sustituye  
25 optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una

mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos alquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de  
5 la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

22. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque  $R^1$  es halo, nitro,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-OR^8$ ,  $-NHS(O)_2R^8$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-S(O)_2NR^8R^{8'}$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  
10  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ,  $-CH_2N(R^{25})(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(NR^{25a}R^{25b})$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(NO_2))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(N(R^{25a})(CN))$ ,  $-CH_2NR^{25}C(=NH)(R^{25})$ , o  $-CH_2NR^{25}C(NR^{25a}R^{25b})=CH(NO_2)$ , alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo, o  
15 heterocicloalquilo; donde el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heteroarilo y heterocicloalquilo se sustituyen independiente y optativamente con uno, dos, tres, cuatro, cinco, seis o siete grupos seleccionados independientemente de halo, alquilo, haloalquilo, nitro, cicloalquilo optativamente  
20 sustituido, heterocicloalquilo optativamente sustituido, arilo optativamente sustituido, arilalquilo optativamente sustituido, heteroarilo optativamente sustituido,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8S(O)_2R^9$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_mR^9$ ,  $-C(O)R^8$ ,  $-C(O)OR^8$ ,  $-C(O)NR^8R^{8'}$ ,  $-NR^8C(O)NR^{8'}R^{8''}$ ,  $-NR^8C(O)OR^{8'}$  y  $-NR^8C(O)R^{8'}$ ;

$R^3$  es hidroxí; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de  
5 estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos alquilo, alquénilo, alquínilo, arilo, arilalquilo, cicloalquilo, haloalquilo, heteroarilo, y heterocicloalquilo de la presente reivindicación contienen de  
10 la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

23. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo B donde A es tien-3,4-diilo, benzo[d]isoxazol-5,6-diilo, 1H-indazol-5,6-  
15 dilo (optativamente sustituido en la posición N1 con  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquénilo), benzo[d]oxazol-5,6-diilo, 1H-benzo[d]imidazol-5,6-diilo (optativamente sustituido en la posición N1 con  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquénilo),  
1H-benzo[d][1,2,3]triazol-5,6-diilo (optativamente sustituido  
20 en la posición N1 con  $R^{19}$  donde  $R^{19}$  es alquilo o alquénilo), imidazo[1,2-a]piridin-6,7-diilo, cinolin-6,7-diilo, quinolin-6,7-diilo, piridin-3,4-diilo, 1-óxido-piridin-3,4-diilo, [1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-6,7-diilo, o 2,3-dihidroimidazo[1,2-a]piridin-6,7-diilo; o un solo estereoisómero o una

mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos alquilo, y alquenilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono  
5 definida en la cláusula 1.

24. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque A es tien-3,4-diilo;  $R^{10}$  y  $R^{12}$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo; y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; o  
10 un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él.

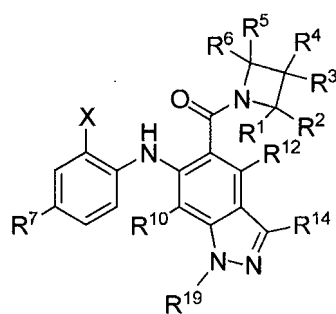
25. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 24,  
15 caracterizado porque  $R^3$  es hidrógeno o hidroxilo; y  $R^4$  es  $-NR^8R^{8'}$ , heterocicloalquilo, heteroarilo, o alquilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$ ; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable  
20 de él.

26. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del Grupo B donde A es benzo[d]isoxazol-5,6-diilo;  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ , y  $R^{14}$  son  
25 independientemente hidrógeno, halo, o alquilo;  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$

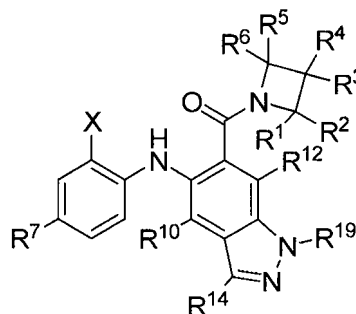
son hidrógeno; X y R<sup>7</sup> son halo; R<sup>3</sup> es hidroxil; y R<sup>4</sup> es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup> y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo  
 5 estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la  
 10 cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

27. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(g) o I(h):



I(g);



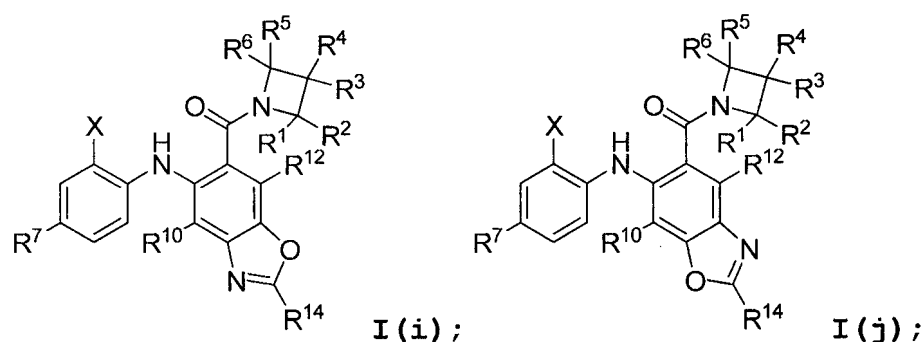
I(h);

15 donde R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, y R<sup>14</sup> son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo; R<sup>19</sup> es alquilo o alquenilo; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, y R<sup>6</sup> son hidrógeno; X y R<sup>7</sup> son halo; R<sup>3</sup> es hidroxil; y R<sup>4</sup> es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup> y donde el heteroarilo  
 20 se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y

optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, alquenoilo, y heteroarilo de la presente reivindicación  
5 contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

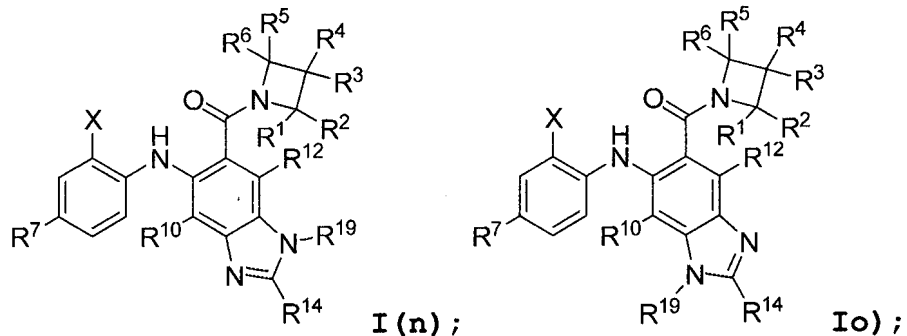
28. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(i) o I(j):



donde  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ , y  $R^{14}$  son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo;  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  sin hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde  
15 el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y  
20 heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

29. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(n) o I(o):



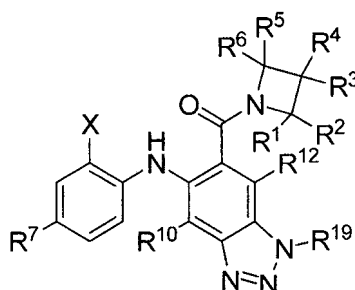
5    donde  $R^7$  es halo o alquilo; X es halo;  $R^{19}$  es alquilo;  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno;  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ , y  $R^{14}$  son independientemente hidrógeno o halo;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye

10    optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la

15    cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

30. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(p):

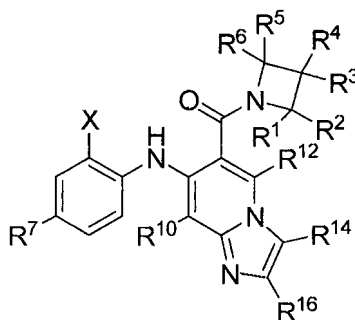


I (p)

donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, y R<sup>6</sup> son hidrógeno; X y R<sup>7</sup> son halo; R<sup>10</sup> y R<sup>12</sup> son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo; R<sup>19</sup> es  
 5 hidrógeno o alquilo; R<sup>3</sup> es hidroxilo; y R<sup>4</sup> es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup> y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una  
 10 mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

15 31. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(q):

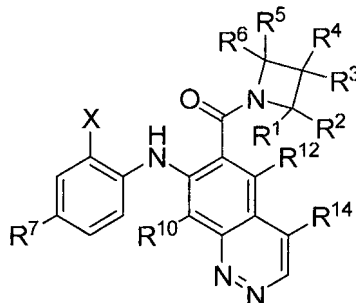


I (q)

donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{14}$ , y  $R^{16}$  son independientemente hidrógeno o halo;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde  
 5 el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y  
 10 heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

32. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(r):



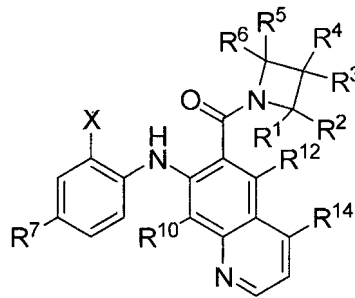
I(r)

donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^{10}$  y  $R^{12}$  son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo;  $R^{14}$  es hidrógeno, halo, alquilo, o amino;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es  
 20 heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo

estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

33. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(s):

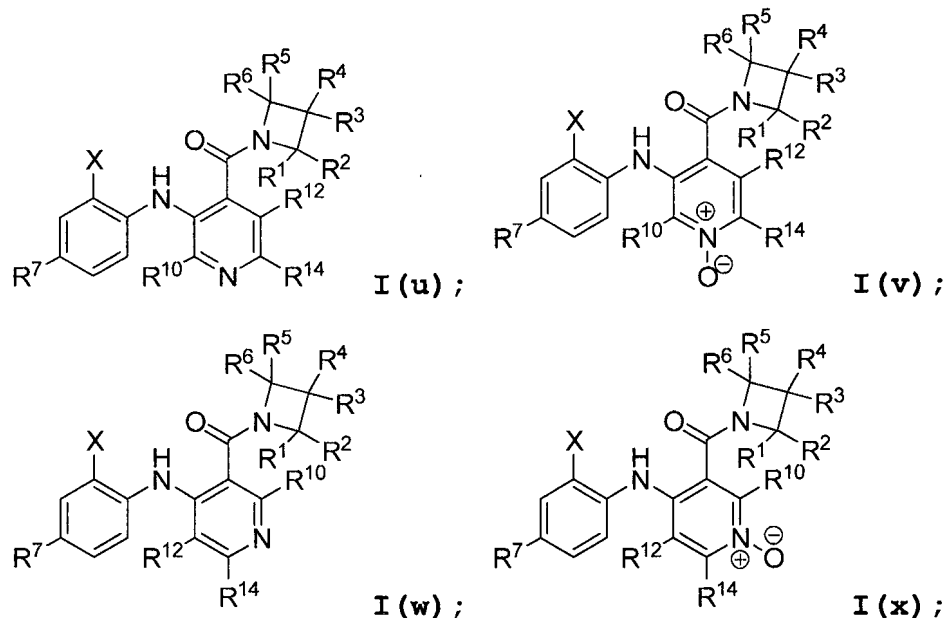


**I (s)**

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, y R<sup>6</sup> son hidrógeno; X y R<sup>7</sup> son halo; R<sup>10</sup> y R<sup>12</sup> son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo; R<sup>14</sup> es hidrógeno, halo, alquilo, o amino; R<sup>3</sup> es hidroxilo; y R<sup>4</sup> es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con -NR<sup>8</sup>R<sup>8'</sup> y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

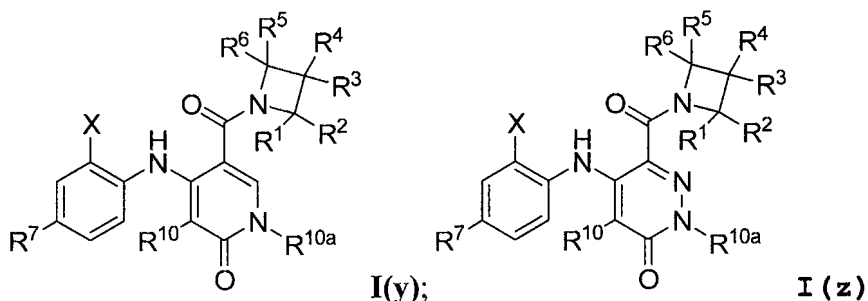
5 34. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado por la Fórmula I(u), I(v), I(w) o I(x):



donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^{10}$ ,  $R^{12}$ ,  
 10 y  $R^{14}$  son independientemente hidrógeno, halo, o alquilo;  $R^3$  es  
 hidroxilo; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo,  
 donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde  
 el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un  
 solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y  
 15 optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable  
 de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

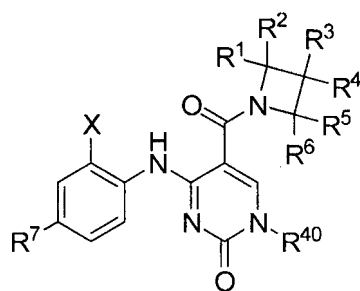
- 5 35. El compuseto de la reivindicación 23, caracterizado porque es seleccionado del grupo C y de acuerdo con la Fórmula I(y) o I(z):



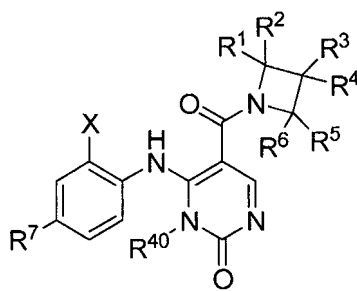
donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^{10}$  es  
 10 hidrógeno, halo, o alquilo;  $R^{10a}$  es alquilo;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$   
 es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el  
 alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el  
 heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo  
 estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y  
 15 optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable  
 de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

36. El compuesto de la reivindicación 23, caracterizado porque es seleccionado del Grupo D y de acuerdo con la Fórmula I(aa) o I(bb):



I (aa) or



I (bb)

5 donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ , y  $R^6$  son hidrógeno; X y  $R^7$  son halo;  $R^3$  es hidroxilo; y  $R^4$  es heterocicloalquilo, alquilo, o heteroarilo, donde el alquilo se sustituye optativamente con  $-NR^8R^{8'}$  y donde el heteroarilo se sustituye optativamente con alquilo; o un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él y  
10 optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de él;

en donde, todos los grupos heterocicloalquilo, alquilo, y heteroarilo de la presente reivindicación contienen de la cantidad de átomos de carbono definida en la cláusula 1.

15

37. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del grupo formado por:

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}-  
carbonil)azetidin-3-ol;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)azetidin-3-ona;

6-(azetidin-1-ilcarbonil)-2,3-difluoro-*N*-(2-fluoro-4-yodofenil)anilina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-(hidroximetil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-(trifluorometil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-prop-2-en-1-ilazetidin-3-ol;

3-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}

10 carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]propano-1,2-diol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-etilazetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-metilazetidin-3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-etenilazetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ona; oxima;

[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}

20 carbonil)azetidin-3-il]metanol;

1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]etano-1,2-diol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-amina;

- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-*N*-hidroxiazetidina-3-carboxamida;
- 1,1-dimetiletil [1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
amino] fenil} carbonil) azetidin-3-il] carbamato;
- 5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)  
-3-(pirrolidin-1-ilmetil) azetidin-3-ol;
- 3-[(dietilamino) metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)  
10 -3-[(dimetilamino) metil] azetidin-3-ol;
- N*-butil-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidina-3-carboxamida;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-*N*-prop-2-en-1-ilazetidina-3-carboxamida;
- 15 *N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidin-3-yl]-2-metilpropanamida;
- N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidin-3-il] formamida;
- N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
20 carbonil) azetidin-3-il]-3,4-dihidroxibutanamida;
- metil [1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidin-3-il] carbamato;
- N*-butil-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidin-3-amina;

1-({4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-3-tienil} carbonil) azetidin-3-amina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)-3-[(2*S*)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)-3-[(2*R*)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

(*R*)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)-3-pirrolidin-2-il azetidin-3-ol;

(*S*)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

10 carbonil)-3-pirrolidin-2-il azetidin-3-ol;

3-(aminometil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-[(1*S*)-1-aminoetil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

15 3-[(1*R*)-1-aminoetil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

(*R*)-(3-(1-aminopropil)-3-hidroxi azetidin-1-il) (3,4-difluoro-2-(2-fluoro-4-yodofenil amino) fenil) metanona;

(*S*)-(3-(1-aminopropil)-3-hidroxi azetidin-1-il) (3,4-difluoro-2-

. 20 (2-fluoro-4-yodofenil amino) fenil) metanona;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)-*N*-etil azetidina-3-carboxamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)-*N*-(2-hidroxi etil) azetidina-3-carboxamida;

- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)-N-(2-piperidin-1-ilettil)azetidina-3-carboxamida;  
 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)-N-fenlazetidina-3-carboxamida;
- 5 N-[2-(dietilamino)etil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
 yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidina-3-carboxamida;  
 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)-3-(morfolin-4-ilmetil)azetidin-3-ol;
- 1-{{1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 10 carbonil)-3-idroksiazetidin-3-il}metil}piperidin-4-ol;  
 3-{{bis(2-idroksietil)amino}metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
 fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;  
 N-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)azetidin-3-il]-2-(4-metilpiperazin-1-il)acetamida;
- 15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)-3-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]azetidin-3-ol;  
 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 carbonil)-3-[(4-metil-1,4-diazepan-1-il)metil]azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
 20 carbonil)-3-{{metil(1-metilpirrolidin-3-il)amino}metil}  
 azetidin-3-ol;  
 3-(1,4'-bipiperidin-1'-ilmetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-  
 4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-*N,N*-bis(2-hidroxietil) glicinamida;  
 3-({4-[2-(dietilamino) etil] piperazin-1-il} metil)-1-({3,4-  
 difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)  
 5 azetidín-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(2-hidroxietil) (metil) amino} metil} azetidín-3-ol;  
*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-2-piperidín-1-il acetamida;

10 *N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-*N*3-(2-hidroxietil)-*N*3-metil-beta-  
 alaninamida;

*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-*N*3,*N*3-bis(2-hidroxietil)-beta-  
 15 alaninamida;

*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-*N*2,*N*2-dietil glicinamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-*N*-metil azetidín-3-amina;

20 1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il]-*N,N*-dimetil pirrolidín-3-amina;  
 2-{{1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil) azetidín-3-il} amino} etanol;

*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)azetidin-3-il]propano-1,3-diamina;

3-[(dimetilamino)metil]-1-({4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-3-  
tienil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-*N*-metil-*N*-(2-piridin-2-ilet)azetidin-3-amina;

*N*-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)azetidin-3-il]-*N*<sup>2</sup>-metilglicinamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

10 carbonil)-*N*-etilazetidin-3-amina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)-*N*-(2-metilpropil)azetidin-3-amina;

*N*-(ciclopropilmetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-amina;

15 *N*-(ciclohexilmetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-amina;

*N*-(ciclopentilmetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-amina;

3-(azetidin-1-ilmetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-

20 yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)-*N*-[(2,3-dihidroxipropil) oxi]azetidina-3-carboxamida;

2-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)azetidin-2-il]metil}amino)etanol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(etilamino)metil]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{2-[(1-metiletil) amino]etil}azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-(2-hidroxi-1,1-dimetiletil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{1,1-dimetil-2-[(1-metiletil) amino]etil}azetidin-  
3-ol;

10 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{[(1-metiletil) amino]metil}azetidin-3-amina;

3-[(ciclopropilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

15 carbonil)-3-{[(2,2,2-trifluoroetil) amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-(1*H*-imidazol-1-ilmetil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{[(1,1-dimetiletil) amino]metil}azetidin-3-ol;

20 3-[(ciclopentilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi-*N*-prop-2-en-1-ilazetidina-3-carboxamida;

$N$ -{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidín-2-il] metil} etano-1,2-diamina;

$N$ -[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil) azetidín-3-il] glicinamida;

5 6-({3-[(dimetilamino) metil] azetidín-1-il} carbonil)-2,3-  
difluoro- $N$ -(2-fluoro-4-yodofenil) anilina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{[(1-metiletil) amino] metil} azetidín-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

10 carbonil)- $N$ -(3,4-dihidroxibutil) azetidina-3-carboxamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)- $N$ -(2,3-dihidroxipropil) azetidina-3-carboxamida;

1-({2,4-difluoro-6-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil) azetidín-3-amina;

15 1-({4,5-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil) azetidín-3-amina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)-3-hidroxiazetidina-3-carboxamida;

6-{[3-(aminometil)-3-(metiloxi) azetidín-1-il] carbonil}-2,3-

20 difluoro- $N$ -(2-fluoro-4-yodofenil) anilina;

$N$ -{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

carbonil)-3-hidroxiazetidín-3-il] metil} acetamida;

2,3-difluoro- $N$ -(2-fluoro-4-yodofenil)-6-[(3-{[(1-

metiletil) amino] metil} azetidín-1-il) carbonil] anilina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-N-(2,3-dihidroxipropil)-3-hidroxi azetidina-3-  
 carboxamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 5 carbonil)-3-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{[(2,2-dimetilpropil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-[(propilamino) metil] azetidin-3-ol;

10 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{[(2-metilpropil) amino] metil} azetidin-3-ol;

3-{[(ciclopropilmetil) amino] metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
 fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}

15 carbonil)-3-{[(fenilmetil) amino] metil} azetidin-3-ol;

3-{[(ciclohexilmetil) amino] metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
 fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-[(butilamino) metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
 yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-({[(1-etilpirrolidin-2-il) metil] amino} metil)  
 azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{[(2-hidroxi etil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-(dimetilamino)etil] amino}metil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-(hidroxi-1,1-dimetiletil) amino]metil} azetidin-  
5 3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-(4-metilfenil)etil] amino}metil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(prop-2-en-1-ilamino)metil] azetidin-3-ol;

10 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-(1-metilpirrolidin-2-il)etil] amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(2,3-dihidro-1*H*-inden-2-ilamino)metil] azetidin-3-

15 ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-(tetrahidrofuran-2-ilmetil) amino]metil} azetidin-  
3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
20 carbonil)-3-({[2-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)etil] amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclopentil] amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(1,1-dimetilprop-2-in-1-il) amino}metil}azetidin-  
 3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 5 carbonil)-3-{{(3-pirrolidin-1-ilpropil) amino}metil}azetidin-3-  
 ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(1,2-dimetilpropil) amino}metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 10 carbonil)-3-{{[2-(1*H*-imidazol-4-il) etil] amino}metil}azetidin-  
 3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[1-metil-2-(metiloxi) etil] amino}metil}azetidin-  
 3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[3-(etiloxi)propil] amino}metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(1-etilpropil) amino}metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 20 carbonil)-3-{{(3,3-dimetilbutil) amino} metil}azetidin-3-ol;  
 etil 4-{{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]  
 fenil}carbonil)-3-hidroxiazetidin-3-il]metil}amino)piperidina-  
 1-carboxilato;

- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(3-metflbutil) amino}metil}azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[2-(etiloxi)etil] amino}metil}azetidin-3-ol;
- 5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[3-(dimetilamino)propil] amino}metil}azetidin-3-  
 ol;
- 3-[(ciclobutilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
 yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 10 3-{{[3-(dietilamino)propil] amino}metil}-1-({3,4-difluoro-2-  
 [(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[3-(1*H*-imidazol-1-il)propil] amino} metil}  
 azetidin-3-ol;
- 15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[2-(metiltio)etil] amino}metil}azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{[1-(fenilmetil)piperidin-4-il] amino}metil}  
 azetidin-3-ol;
- 20 3-{{[2,2-bis(metiloxi)etil] amino}metil}-1-({3,4-difluoro-2-  
 [(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-{{(1,1,3,3-tetrametilbutil) amino}metil}azetidin-  
 3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{(1,1-dimetilpropil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(2,3-dihidro-1*H*-inden-1-ilamino) metil] azetidin-3-  
5 ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(2-[(fenilmetil) oxi] ciclopentil) amino] metil]  
azetidin-3-ol;

3-{{(3-amino-2-hidroxipropil) amino] metil}-1-({3,4-difluoro-2-  
10 [(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[2-hidroxi-1-(fenilmetil) etil] amino} metil)  
azetidin-3-ol;

3-[(ciclooctilamino) metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
15 yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-{{(1-ciclohexiletil) amino] metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-[(cicloheptilamino) metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{(2-piridin-3-iletil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[3-(metiltio) propil] amino} metil) azetidin-3-ol;

*N*-ciclohexil-*N*<sup>2</sup>-{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]metil}-2-metilalaninamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
5 carbonil)-3-{[(tetrahydro-2*H*-piran-4-ilmetil) amino]metil}  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
carbonil)-3-{[(3-hidroxiopropil) amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
10 carbonil)-3-{[(2-piridin-4-iletil) amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
carbonil)-3-({[1-(fenilmetil)pirrolidin-3-il] amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
15 carbonil)-3-({[2-(2-tienil)etil] amino}metil)azetidin-3-ol;

3-[(2-[bis(1-metiletil) amino]etil) amino]metil]-1-({3,4-  
difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
20 carbonil)-3-({[2-(feniloxi)etil] amino}metil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
carbonil)-3-[(fenilamino)metil]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}  
carbonil)-3-{[(2-hidroxiopropil) amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(2-[(1-metiletil)ossi]etil)amino]metil}azetidin-  
3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
5 carbonil)-3-[(1-etilpiperidin-3-il)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(2-(metilossi)etil)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-(1-nitropropil)azetidin-3-ol;

10 3-(1-aminoetil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(1-metilpiperidin-4-il)metil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(4-(dimetilamino)butil)amino]metil}azetidin-3-  
ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(2-furan-2-iletil)amino]metil}azetidin-3-ol;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[1-[(1,1-dimetiletil)amino]etil]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(2-etilbutil)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-([1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} pirrolidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-([ (2S)-2-[(metiloxi) metil] pirrolidin-1-il] metil)

5 azetidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-([ (2-hidroxi fenil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-([ (4-hidroxi fenil) amino] metil} azetidin-3-ol;

10 1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-([ (3-hidroxi fenil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-[(feniloxi) metil] azetidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
15 carbonil)-3-([ (1r,3r,5R,7R)-triciclo[3.3.1.1<sup>3,7</sup>] dec-2-  
il amino] metil} azetidin-3-ol;

3-([ [1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} amino) propano-1,2-diol;

N-([1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)

20 carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil}-L-alanina;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-[(feniltio) metil] azetidin-3-ol;

N-([1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil)  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil}-D-alanina;

metil *N*-{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-idroxiacetidin-3-il]metil}alaninato;

3-[(1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-idroxiacetidin-3-il]metil)amino]ossipropano-1,2-  
5 diol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-[(5-metil-1,3,4-ossadiazol-2-il)metil]amino)metil)acetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-[(1-metilbutil)amino]metil)acetidin-3-ol;  
10

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-[(1-metilpropil)amino]metil)acetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-[(2-metilbutil)amino]metil)acetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-[(pentilamino)metil]acetidin-3-ol;  
15

3-[(1*S*)-1-aminoetil]-1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]imidazo[1,2-*a*]piridin-6-il}carbonil)acetidin-3-ol;

1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]imidazo[1,2-*a*]piridin-6-il}carbonil)-3-[(1*S*)-1-(metilamino)etil]acetidin-3-ol;  
20

3-[(ciclohexilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)acetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[1-(etilamino)etil]azetidin-3-ol;

3-[(azepan-3-ilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[2-(dimetilamino)-1-metiletil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

N-ciclopropil-1-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
amino]fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}amino)

10 ciclopentanocarboxamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[2-(2,3-dihidro-1H-indol-3-il)etil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

N<sup>2</sup>-{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
15 carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}-N-etil-2-  
metilalaninamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(2-metilhidrazino)metil]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
20 carbonil)-3-[(hidroxiamino)metil]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(metiloxi)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(etiloxi)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[1-(etilamino)propil]azetidin-3-ol;

3-[(azetidin-3-ilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(1,3-tiazol-2-ilamino)metil]azetidin-3-ol;

3-(1*H*-benzimidazol-2-il)-1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]imidazo[1,2-*a*]piridin-6-il}carbonil)azetidin-3-ol;

10 3-(1*H*-benzimidazol-2-yl)-1-({7-[(4-bromo-2-fluorofenil)amino]-8-fluoroimidazo[1,2-*a*]piridin-6-il}carbonil)azetidin-3-ol;

1,1-dimetiletil 3-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}amino)propil]carbamato;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[pirrolidin-2-ilmetil]amino}metil)azetidin-3-ol;

1,1-dimetiletil 4-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}amino)metil]piperidina-1-carboxilato;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(2-idroxi-fenil)metil]amino}metil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(3-hidroxifenil)metil]amino}metil)azetidin-3-  
ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
5 carbonil)-3-({[(4-hidroxifenil)metil]amino}metil)azetidin-3-  
ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(4-hidroxibutil)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
10 carbonil)-3-({[(2-hidroxietil)oxi]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(1S,2S)-2-hidroxiciclohexil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
15 carbonil)-3-({[(1,1-dimetil-2-pirrolidin-1-iletal)amino]metil}  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(1-metil-1H-imidazol-4-il)metil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

20 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-({[(1-metil-1H-imidazol-5-il)metil]amino}metil)  
azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[(2S)-2-(metiloxi) ciclopentil] amino} metil)  
azetidin-3-ol;

3-{{[1,1'-bi(ciclohexil)-2-ilamino] metil}-1-({3,4-difluoro-2-  
5 [(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[3-(metiloxi) fenil] amino} metil) azetidin-3-ol;

Ácido 1-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
amino] fenil} carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} amino)  
10 ciclopentanecarboxílico;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[(4-fluorofenil) amino] metil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(1,3,5-triazin-2-ilamino) metil] azetidin-3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-({[(trans-4-hidroxiciclohexil) amino] metil} azetidin-  
3-ol;

3-[(ciclopent-3-en-1-ilamino) metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

20 N-[4-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} amino) fenil] acetamida;

N-[3-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} amino) fenil] acetamida;

- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-(1-metilpirrolidin-2-il)azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(1*H*-1,2,4-triazol-3-ilamino)metil]azetidin-3-ol;
- 5 3-[1-(dietilamino)propil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil)azetidin-3-ol;
- 3-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]metil} amino)-5-(hidroximetil)  
ciclopentano-1,2-diol;
- 10 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{[(3-fluorofenil) amino]metil}azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}
- 15 carbonil)-3-(1-metilpiperidin-2-il)azetidin-3-ol;
- 1-{{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
}carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]metil}guanidina;
- 1-{{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]metil}-3-nitroguanidina;
- 20 *N*-{1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]etil}acetamida;
- (2*R*)-*N*-{1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]  
fenil}carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]etil}-3,3,3-trifluoro-  
2-(metiloxi)-2-fenilpropanamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{(piperidin-4-ilmetil) amino]metil}azetidin-3-ol;  
3-{{(3-aminopropil) amino]metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-  
4-yodofenil) amino] fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{[2-(4-metilpiperazin-1-il) fenil]metil} amino)  
metil}azetidin-3-ol;

3-{{(1,1-dimetiletil) amino]metil}-1-({4-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino]-3-tienil}carbonil)azetidin-3-ol;

10 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil) amino] fenil}carbonil)-3-{{(2-hidroxiciclohexil)  
amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{(2,2,3,3,3-pentafluoropropil) amino]metil}

15 azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{{(3,3,3-trifluoropropil) amino]metil}azetidin-3-  
ol;

N-[3-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
20 carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]metil} amino) fenil]  
metanosulfonamida;

N-{{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il]metil}metanosulfonamida;

3-([1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]metil} amino)-1*H*-pirazol-5-ol;  
 (1*R*,2*S*)-4-([1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]  
 fenil} carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]metil} amino)

5 ciclopentano-1,2-diol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-([1-(hidroximetil) ciclohexil] amino)metil)  
 azetidin-3-ol;

3-([3-clorofenil) amino]metil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-  
 10 4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-([4-clorofenil) amino]metil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-  
 4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

3-[(5-amino-3-metil-1*H*-pirazol-1-il)metil]-1-({3,4-difluoro-2-  
 [(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-([5-metil-1*H*-pirazol-3-il) amino]metil) azetidin-3-  
 ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-(1-etilpirrolidin-2-il) azetidin-3-ol;

20 (2*R*)-*N*-{(1*S*)-1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
 amino] fenil} carbonil)-3-hidroxiacetidin-3-il]etil}-3,3,3-  
 trifluoro-2-(metiloxi)-2-fenilpropanamida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
 carbonil)-3-([4-(metiloxi) fenil] amino)metil) azetidin-3-ol;

3-(1-amino-2-metilpropil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

3-{[(4-aminofenil)amino]metil}-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-{[(2-idroxi-2-metilciclopentil)amino]metil}azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-{1-[(4-idroxiciclohexil)amino]etil}azetidin-3-ol;

10 metil (2xi)-2-desossi-2-({[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}amino)-beta-D-arabino-hexopiranosida;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-piridin-2-ilazetidin-3-ol;

15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-({[1-(idroxi-metil)ciclopentil]amino}metil)azetidin-3-ol;

1-ciano-3-{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonyl)-3-idroxi-azetidin-3-il]metil}guanidina;

20 6-({3-[(etilamino)metil]-3-fluoroazetidin-1-il}carbonil)-2,3-difluoro-N-(2-fluoro-4-yodofenil)anilina;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)-3-(1-nitroetil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-{[(3-fluoro-4-hidroxifenil) amino] metil} azetidin-3-  
ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
5 carbonil)-3-{[(2-fluoro-4-hidroxifenil) amino] metil} azetidin-3-  
ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[1-(metilamino) etil] azetidin-3-ol;

3-(1-aminoetil)-1-({8-cloro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]  
10 imidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] imidazo[1,2-a]  
piridin-6-il} carbonil)-3-[(2*S*)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] imidazo[1,2-a]  
piridin-6-il} carbonil)-3-{(1*S*)-1-[(2-hidroxi-2-  
15 metilciclopentil) amino] etil} azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-(1*H*-imidazol-2-il) azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-(1*H*-pirrol-2-il) azetidin-3-ol;

20 *N*-{[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] metil} bencencarboximidamida;  
3-({[(*E*)-1-amino-2-nitroetenil] amino} metil)-1-({3,4-difluoro-  
2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil} carbonil) azetidin-3-ol;

- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-(1-metil-1-nitroetil)azetidin-3-ol;
- 3-(1-amino-1-metiletil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 5 3-[(1*H*-bencimidazol-2-ilamino)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-  
fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(1*H*-imidazol-2-ilamino)metil]azetidin-3-ol;
- metil {1-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]  
10 fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]etil}carbamato;
- 3-(1*H*-bencimidazol-2-il)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[1-(dimetilamino)etil]azetidin-3-ol;
- 15 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(pirimidin-2-ilamino)metil]azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
carbonil)-3-[(piridin-2-ilamino)metil]azetidin-3-ol;
- 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil}  
20 carbonil)-3-(1-metil-1*H*-imidazol-2-il)azetidin-3-ol;
- 3-(1-aminobutil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-  
yodofenil)amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;
- 1-({2-fluoro-3-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]piridin-4-  
il}carbonil)-3-[(2*S*)-pirrolidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({8-fluoro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-4-metilcinolin-6-il}carbonil)-3-[(2*S*)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

3-[amino(fenil)metil]-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

5 1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)-3-(5-metil-1*H*-imidazol-2-il)azetidin-3-ol;

1,1-dimetiletil (2*S*)-2-[1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)-3-idroxi-azetidin-3-il]piperidina-1-carboxilato;

10 1-({2-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-3,4-difluorofenil}carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;

3-(1-amino-3-idroxi-propil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}

15 carbonil)-3-(1*H*-imidazol-2-ilmetil)azetidin-3-ol;

3-(1-aminociclopentil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

3-(2-aminociclohexil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)azetidin-3-ol;

20 3-(2-aminociclopentil)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil}carbonil)-azetidin-3-ol;

1-({4-fluoro-5-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-1-metil-1*H*-bencimidazol-6-il}carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;

1-({5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-4-fluoro-1-metil-1H-bencimidazol-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({8-cloro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]imidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;

1-({2-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-3,4-difluorofenil} carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;

1-({7-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-8-fluoroimidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil} carbonil)-3-(3-metil-1-nitrobutil)azetidin-3-ol;

3-(2-aminopirimidin-4-il)-1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]fenil} carbonil)azetidin-3-ol;

1-({7-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-8-cloroimidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil)-3-piperidin-2-ilazetidin-3-ol;

1-({8-cloro-7-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]imidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({7-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-8-cloroimidazo[1,2-a]piridin-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({4-fluoro-5-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-1-metil-1H-bencimidazol-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-aminoetil]-1-({5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-4-fluoro-1-metil-1H-bencimidazol-6-il} carbonil)azetidin-3-ol;

1-({5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-4-fluoro-1-metil-1H-benvimidazol-6-il} carbonil)-3-[(1S)-1-(metilamino)etil] azetidin-3-ol;

4-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-3-fluoro-5-({3-hidroxi-3-  
5 [(2S)-piperidin-2-il] azetidin-1-il} carbonil) piridin-2(1H)-ona;  
4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-5-({3-hidroxi-3-[(2S)-  
piperidin-2-il] azetidin-1-il} carbonil)-1-metilpiridin-2(1H)-  
ona;

4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-5-({3-hidroxi-3-[(2S)-  
10 piperidin-2-il] azetidin-1-il} carbonil)-1-metilpiridin-2(1H)-  
ona;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(1S,2S)-2-hidroxiciclohexil] azetidin-3-ol;  
4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-5-({3-hidroxi-3-[(1S)-1-  
15 (metilamino) propil] azetidin-1-il} carbonil)-1-metilpiridin-  
2(1H)-ona;

1-({3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] fenil}  
carbonil)-3-[(1S,2R)-2-hidroxiciclohexil] azetidin-3-ol;  
5-({3-[(1S)-1-(dimetilamino)etil]-3-hidroxi azetidin-1-il}  
20 carbonil)-4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-1-metilpiridin-  
2(1H)-ona;

4-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-5-({3-hidroxi-3-[(metilamino)  
metil] azetidin-1-il} carbonil)-1-metilpiridin-2(1H)-ona;

5-([3-(1*H*-bencimidazol-2-il)-3-hidroxiacetidin-1-il]carbonil)-  
4-[(4-bromo-2-fluorofenil)amino]-1-metilpiridin-2(1*H*)-ona;

4-[(4-bromo-2-fluorofenil)amino]-5-([3-hidroxi-3-(1-metil-1*H*-  
bencimidazol-2-il)acetidin-1-il]carbonil)-1-metilpiridin-

5 2(1*H*)-ona;

4-[(4-bromo-2-fluorofenil)amino]-5-([3-hidroxi-3-[(2*S*)-  
pirrolidin-2-il]acetidin-1-il]carbonil)-1-metilpiridin-2(1*H*)-  
ona;

1-([3-fluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil]carbonil)-3-

10 [(2*S*)-piperidin-2-il]acetidin-3-ol;

1-([4-fluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil]carbonil)-3-  
[(2*S*)-piperidin-2-il]acetidin-3-ol;

1-([6-[(4-bromo-2-clorofenil)amino]-7-fluoro-3-metil-1,2-  
bencisoxazol-5-il]carbonil)-3-[(2*S*)-piperidin-2-il]acetidin-3-

15 ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil]  
carbonil)-3-(6-metilpiperidin-2-il)acetidin-3-ol;

1-([3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]fenil]  
carbonil)-3-piperazin-2-ilacetidin-3-ol;

20 5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-6-([3-hidroxi-3-[(2*S*)-  
piperidin-2-il]acetidin-1-il]carbonil)-2-metilpiridazin-3(2*H*)-  
ona;

5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-6-({3-hidroxi-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-1-il}carbonil)-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-4-fluoro-6-({3-hidroxi-3-[(2S)-pirrolidin-2-il]azetidin-1-il}carbonil)-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-4-fluoro-6-({3-hidroxi-3-[(2R)-pirrolidin-2-il]azetidin-1-il}carbonil)-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

10 6-({3-[(1S)-1-aminoetil]-3-hidroxi-azetidin-1-il}carbonil)-5-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

6-({3-[(1S)-1-aminoetil]-3-hidroxi-azetidin-1-il}carbonil)-5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

15 5-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-6-{[3-((1S)-1-[(3R,4S)-3,4-dihidroxiciclopentil] amino)etil]-3-hidroxi-azetidin-1-il}carbonil}-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

5-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-6-[(3-hidroxi-3-[(1S)-1-[(2-hidroxi-2-metilciclopentil) amino]propil]azetidin-1-il}carbonil]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

20 6-({3-[(1S)-1-aminopropil]-3-hidroxi-azetidin-1-il}carbonil)-5-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

6-{[3-(1H-bencimidazol-2-il)-3-hidroxi-azetidin-1-il}carbonil]-5-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

5-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-6-[[3-hidroxi-3-(1-metil-1H-bencimidazol-2-il) azetidin-1-il] carbonil]-2-metilpiridazin-3(2H)-ona;

1-({2-fluoro-3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] piridin-4-

5 il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

1-({3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] piridin-4-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

1-({3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino]-1-oxidopiridin-4-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

10 1-({2-fluoro-3-[(2-fluoro-4-bromofenil) amino] piridin-4-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-aminopropil]-1-({3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] piridin-4-il} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] piridin-4-il} carbonil)-3-[(1S)-1-(metilamino) propil] azetidin-3-ol;

15 (1R,2S)-4-({(1S)-1-[1-({2-fluoro-3-[(2-fluoro-4-yodofenil) amino] piridin-4-il} carbonil)-3-hidroxi azetidin-3-il] propil} amino) ciclopentano-1,2-diol;

1-({7-[(4-bromo-2-clorofenil) amino]-8-fluoro-4-metilcinolin-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

20 1-({7-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino]-8-fluoro-4-metilcinolin-6-il} carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il] azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-aminoetil]-1-({7-[(4-bromo-2-fluorofenil) amino] cinolin-6-il} carbonil) azetidin-3-ol;

1-({7-[(4-bromo-2-fluorogenil)amino]cinolin-6-il}carbonil)-3-  
{(1S)-1-[(2-hidroxy-2-metilciclopentil)amino]etil}azetidin-3-  
ol;

1-({7-[(4-bromo-2-fluorofenil)amino]cinolin-6-il}carbonil)-3-  
5 [(1S)-1-(dimetilamino)etil]azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-aminoetil]-1-({5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-1H-  
1,2,3-benzotriazol-6-il}carbonil)azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-(dimetilamino)etil]-1-({5-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
amino]-1-metil-1H-1,2,3-benzotriazol-6-il}carbonil)azetidin-3-  
10 ol;

1-({5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-1H-1,2,3-benzotriazol-6-  
il}carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-ol;

1-({5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-1-metil-1H-1,2,3-  
benzotriazol-6-il}carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-  
15 ol;

1-({5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-1H-1,2,3-benzotriazol-6-  
il}carbonil)-3-{(1S)-1-[(2-hidroxi-2-metilciclopentil)amino]  
etil}azetidin-3-ol;

3-[(1S)-1-aminoetil]-1-({4-fluoro-5-[(2-fluoro-4-yodofenil)  
20 amino]-1H-1,2,3-benzotriazol-6-il}carbonil)azetidin-3-ol;

1-({4-fluoro-5-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-1H-1,2,3-  
benzotriazol-6-il}carbonil)-3-[(2S)-piperidin-2-il]azetidin-3-  
ol;

5-({3-[(1S)-1-aminoetil]-3-hidroxiacetidin-1-il}carbonil)-6-  
[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]pirimidin-2(1H)-ona;

6-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-5-({3-hidroxi-3-[(2S)-  
piperidin-2-il]acetidin-1-il}carbonil)pirimidin-2(1H)-ona;

5 4-[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]-5-({3-hidroxi-3-[(2S)-  
piperidin-2-il]acetidin-1-il}carbonil)pirimidin-2(1H)-ona; y

5-({3-[(1S)-1-aminoetil]-3-hidroxiacetidin-1-il}carbonil)-4-  
[(2-fluoro-4-yodofenil)amino]pirimidin-2(1H)-ona;

y un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él

10 y optativamente o una sal o solvato farmacéuticamente  
aceptable de él.

38. Una composición farmacéutica caracterizada porque  
comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o

15 un solo estereoisómero o una mezcla de estereoisómeros de él,  
optativamente como una sal o un solvato farmacéuticamente  
aceptable de él y un portador, excipiente o diluyente  
farmacéuticamente aceptable.