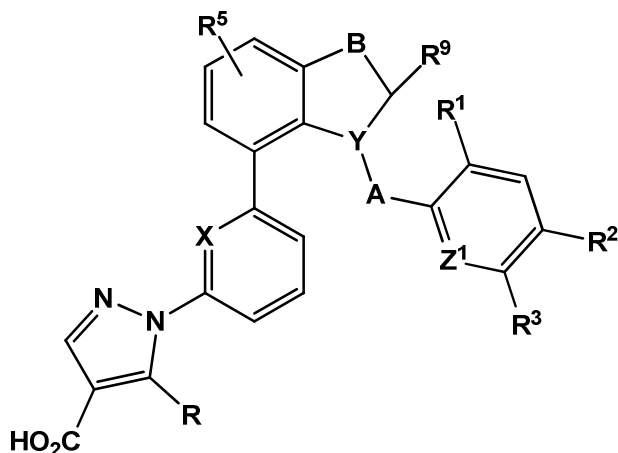


## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto según la fórmula (I)



(I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

X es N o CH;

Y es CH o N;

A es CH<sub>2</sub>, O o N(H) cuando Y es CH, o

A es CH<sub>2</sub>, cuando Y es N,

B es O o CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>;

Z<sup>1</sup> es CR<sup>4</sup> o N;

R es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, monofluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o trifluorometilo

R<sup>2</sup> es piperidinilo que es N-sustituido por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O)-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, S(O)<sub>2</sub>-alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O) cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, C(O)haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O)alcoxiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O) alquenoxiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, heteroarilo o CO(O)<sub>2</sub>bencilo, en donde cada cicloalquilo es opcionalmente sustituido por hidroxilo y cada alquilo o alcoxilo es opcionalmente sustituido por hidroxilo, alcoxiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y en donde cada heteroarilo tiene 5 o 6 átomos en el anillo, 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S y están opcionalmente sustituidos por 1 o 2 sustituyentes de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

R<sup>3</sup> es hidrógeno, halógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, tomados en combinación, forman un anillo azacíclico saturado fusionado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido por bencilo o heteroarilmetilo de 5 o 6

miembros, tal heteroarilo tiene 1 o 2 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S;

R<sup>4</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>5</sub> es hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

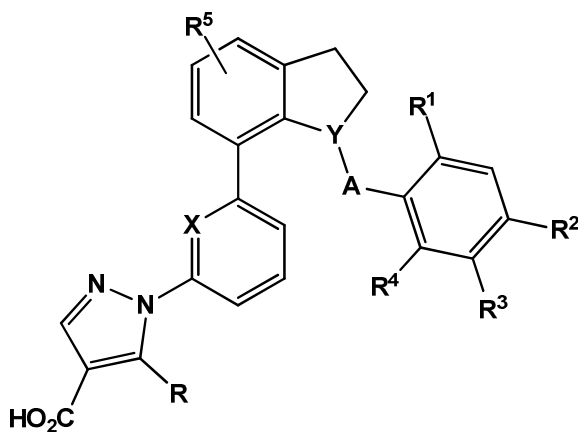
R<sup>7</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

R<sup>7</sup> y R<sup>9</sup>, tomados en combinación con los átomos en el anillo a los que están unidos, forman un enlace doble carbono-carbono;

R<sup>8</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

R<sup>9</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

2. Un compuesto según la fórmula (Ia)



(Ia)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

X es N o CH;

Y es CH o N;

A es CH<sub>2</sub>, O o N(H) cuando Y es CH, o

A es CH<sub>2</sub>, cuando Y es N;

R es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o trifluorometilo;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sup>2</sup> es piperidinilo que es N-sustituido por alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C(O)cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, C(O) haloalquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o C(O)alcoxiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

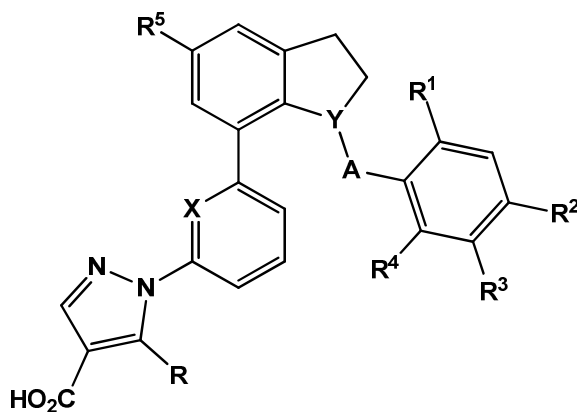
R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup>, tomados en combinación, forman un anillo azacíclico saturado fusionado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido por bencilo o heteroarilmetilo de 5 o 6

miembros, tal heteroarilo tiene 1 o 2 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S;

R<sup>4</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y

R<sub>5</sub> es hidrógeno, halógeno, alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquiloC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

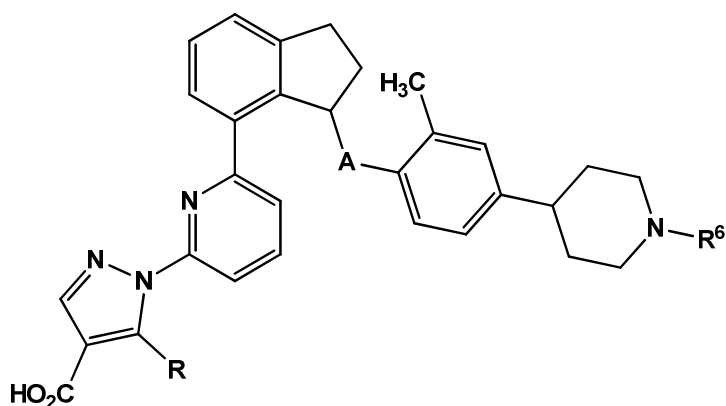
3. El compuesto de la reivindicación 1 o reivindicación 2, que se representa por la fórmula (Ib):



(Ib)

4. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde Y es CH y A es O.
5. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde Y es CH y A es N(H).
6. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde Y es N y A es CH<sub>2</sub>.
7. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde R<sup>2</sup> es piperidin-4-ilo N-sustituido en donde el N-sustituyente es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.
8. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en donde R<sup>1</sup> es hidrógeno ó metilo;  
R<sup>3</sup> es hidrógeno, metilo o etilo, en donde al menos uno de R<sup>1</sup> o R<sup>3</sup> es hidrógeno; y  
R<sup>4</sup> es hidrógeno.
9. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en donde R<sup>1</sup> es metilo; y R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son hidrógeno.
10. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en donde R<sup>1</sup> y R<sup>4</sup> son hidrógeno y R<sup>3</sup> es etilo.

11. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en donde R es trifluorometilo, metilo o etilo;
12. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 en donde R es trifluorometilo.
13. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 en donde R es metilo o etilo.
14. El compuesto de la reivindicación 1 o reivindicación 2, en donde el compuesto es un compuesto de la fórmula (II):



(II)

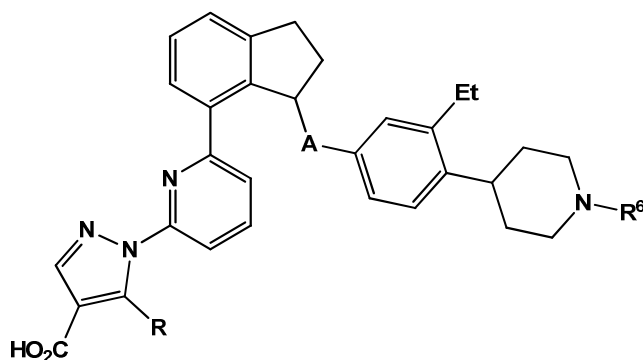
En donde

A es O, CH<sub>2</sub> o NH;

R es metilo, etilo o trifluorometilo;

R<sup>6</sup> es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

15. El compuesto de la reivindicación 1 o reivindicación 2, en donde el compuesto es un compuesto de la fórmula (III):



(III)

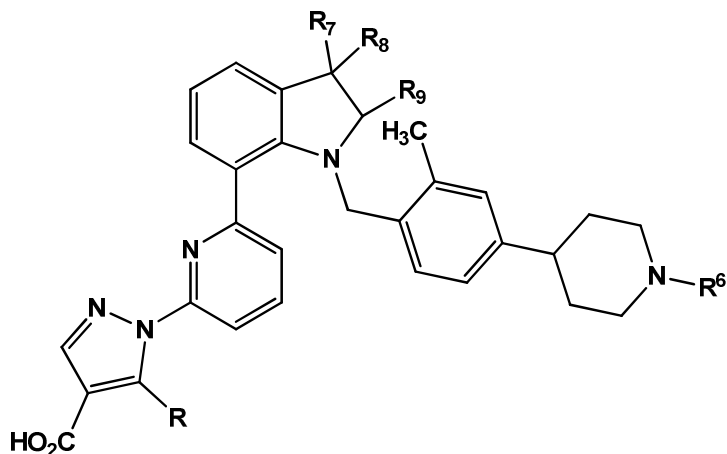
En donde

A es O o NH;

R es metilo, etilo o trifluorometilo;

R<sup>6</sup> es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

16. El compuesto de la reivindicación 14 o 15, en donde A es NH; R es metilo o etilo; y R<sup>6</sup> es C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.
17. El compuesto de la reivindicación 1 o reivindicación 2, en donde el compuesto es un compuesto de la fórmula (IV):



(IV)

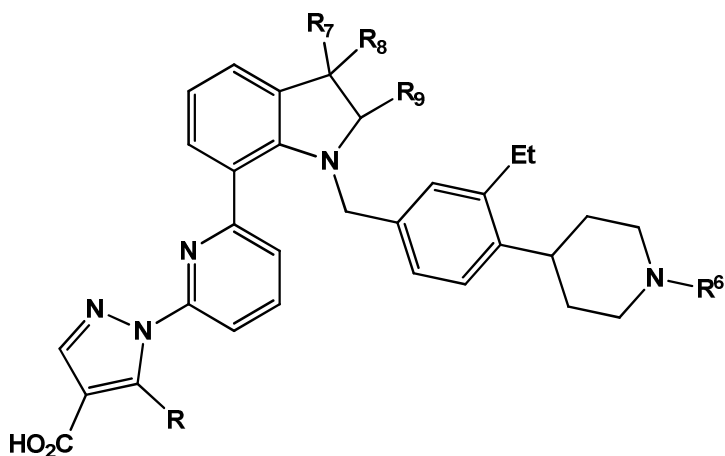
En donde

R es metilo, etilo o trifluorometilo;

R<sup>6</sup> es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

Cada uno R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno y metilo.

18. El compuesto de la reivindicación 17, en donde R es metilo o etilo; y R<sup>6</sup> es 2,2,2-trifluoroetilo.
19. El compuesto de la reivindicación 1 o reivindicación 2, en donde el compuesto es un compuesto de la fórmula (V):



(V)

En donde

R es metilo, etilo o trifluorometilo;

R<sup>6</sup> es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)ciclopropilo o C(O)alquiloC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

cada uno R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno y metilo.

20. El compuesto de la reivindicación 19, en donde R es metilo o etilo; y R<sup>6</sup> es C 2,2,2-trifluoroetilo.
21. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 o una sal del mismo y un excipiente farmacéuticamente aceptable.
22. Una composición farmacéutica oftálmica útil en el tratamiento de glaucoma y el control de la presión intraocular que comprende: una cantidad eficaz de un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
23. Un método de tratamiento de glaucoma y control de la presión intraocular que comprende: la aplicación de una cantidad terapéuticamente eficaz de una composición farmacéutica que comprende un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo a un ojo afectado de un paciente.
24. El método de la reivindicación 23, en donde dicha aplicación comprende aplicación utilizando una técnica seleccionada del grupo que consta que consta de: la administración tópica ocular, inyección periocular, inyección sub-conjuntival, inyección sub-tenon, inyección intracameral, inyección intravítrea, inyección intracanalicular, implantando un dispositivo de entrega en la conjuntiva, implantando

un dispositivo de entrega adyacente a la esclera, implantando un dispositivo de entrega dentro del ojo, administración oral, administración intravenosa, administración subcutánea, administración intramuscular, administración parenteral, administración dérmica, y administración nasal.

25. El método de una cualquiera de las reivindicaciones 23 o 24, en donde el método además comprende la administración al ojo afectado del paciente un agente de tratamiento de glaucoma seleccionado del grupo que consiste en beta-bloqueadoras, análogos de prostaglandinas, estimuladores de sGC, precursores de NO, inhibidores de la anhidrasa carbónica, agonistas  $\alpha_2$ , mióticos y neuroprotectores.
26. El método de una cualquiera de las reivindicaciones 23 a 25, en el que el método comprende además la administración al ojo afectado del paciente un inhibidor de PDE-V.
27. El método de la reivindicación 26 en donde el método inhibidor de PDE-V se selecciona de sildenafil, tadalafil y vardenafil.