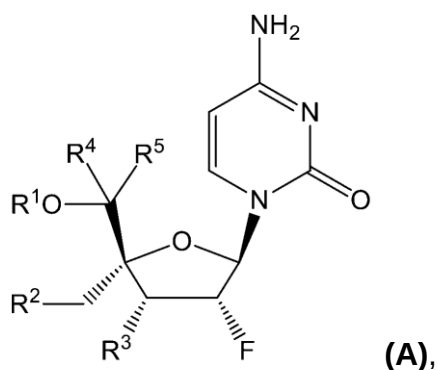


REIVINDICACIONES

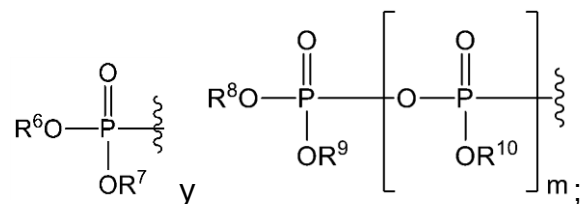
1. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad eficaz de una combinación del compuesto (A) y uno o más del compuesto (B), o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores, en donde:

el compuesto (A) tiene la estructura:



en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en H, un acilo opcionalmente sustituido, un aminoácido unido a O opcionalmente sustituido,

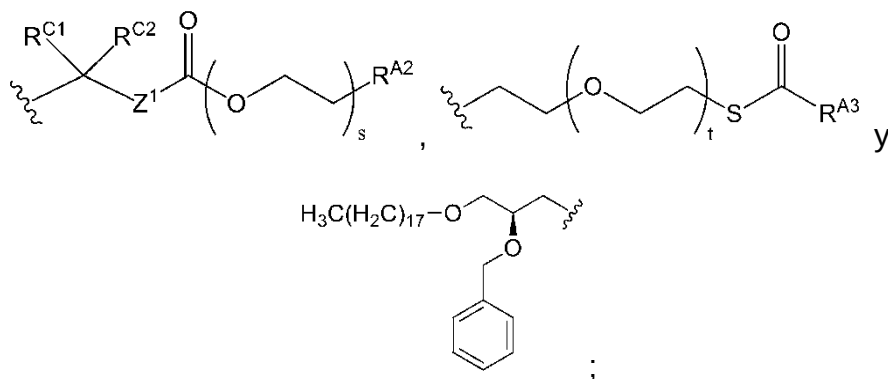


R^2 es cloro o azido;

R^3 se selecciona del grupo que consiste en OH, $-OC(=O)R^{A1}$ y un aminoácido unido a O opcionalmente sustituido;

R^4 y R^5 son independientemente H o D;

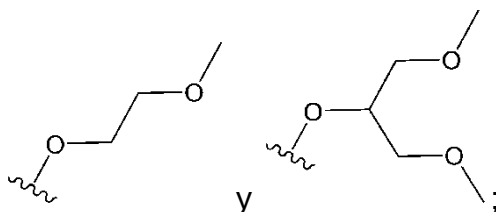
R^6 y R^7 están independientemente ausentes o son H,



R^8 , R^9 y cada R^{10} están independientemente ausentes o son H;

R^{A1} es un alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido;

R^{A2} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, un alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un $-O-$ alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido, un $-O-$ arilo opcionalmente sustituido, un $-O-$ heteroarilo opcionalmente sustituido, un $-O-$ heterociclilo monocíclico opcionalmente sustituido,



R^{A3} se selecciona del grupo que consiste en H, un alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido y un arilo opcionalmente sustituido;

R^{C1} y R^{C2} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en H, un alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido y un arilo opcionalmente sustituido;

m es 1 o 2;

s es 0, 1, 2 o 3;

t es 0 o 1; y

Z^1 es O o S;

uno o más del compuesto (B) se selecciona del grupo que consiste en un anticuerpo anti-RSV, un inhibidor de proteínas de fusión, un inhibidor de proteínas N, un inhibidor de la polimerasa del RSV, un inhibidor de IMPDH, un interferón y otro compuesto que inhibe el virus RSV, o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

2. La composición farmacéutica de la reivindicación 1, en donde uno o más del compuesto (B) es un anticuerpo anti-RSV.

3. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el anticuerpo anti-RSV se selecciona del grupo que consiste en:

RSV-IGIV (RespiGam®)

palivizumab (Synagis®, un anticuerpo monoclonal quimérico humanizado IgG) y

motavizumab (MEDI-524, anticuerpo monoclonal humanizado).

4. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es un inhibidor de proteínas de fusión.

5. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 4, en donde el inhibidor de proteínas de fusión se selecciona del grupo que consiste en

1-ciclopropil-3-[[1-(4-hidroxibutil)bencimidazol-2-il]metil]imidazo[4,5-c]piridin-2-ona (BMS-433771),

ácido 4,4''-bis-{4,6-bis-[3-(bis-carbamoilmetil-sulfamoil)-fenilamino]-(1,3,5) triazin-2-ilamino}-bifenil-2,2''-disulfónico (RFI-641),

sal disódica de ácido 4-4'-bis[4,6-di[3-aminofenil-N,N-bis (2-carbamoiletil)-sulfonilimino]-1,3,5-triazina-2-ilamino]-bifenil-2,2'-disulfónico (CL387626),

2-[[2-[[1-(2-aminoetil)-4-piperidinil]amino]-4-metil-1H-bencimidazol-1-il]-6-metil-3-piridinol (JNJ-2408068),

2-[[6-[[[2-(3-hidroxipropil)-5-metilfenil]amino]metil]-2-[[3-(morfolin-4-il)propil]amino]bencimidazol-1-il]metil]-6-metilpiridin-3-ol(TMC-353121),

5,5'-bis[1-(((5-amino-1H-tetrazolil)imino) metil)] 2,2',4''-metilidinetrisfenol (VP-14637, MDT-637),

N-(2 hidroxietil)-4-metoxi-N-metil-3-(6-metil-[1,2,4]triazolo[3,4-a]ftalacin-3-il) bencenosulfonamida (P13),

2-((2-((1-(2-aminoetil) piperidin-4-il)amino)-4-metil-1H-benzo[d]imidazol-1-il) metil)-6-metilpiridin-3-ol (R170591),

1,4-bis(3-metilpiridin-4-il)-1,4-diazepan (C15),

(R)-9b-(4-clorofenil)-1-(4-fluorobenzoil)-2, 3-dihidro-1H-imidazo[1',2':1,2]pirrolo[3,4-c]piridin-5(9bH)-ona (BTA9981),

[2,2-bis (docosiloxi-oximetil) propil-5-acetatoamido-3,5-didesoxi-4,7,8,9-tetra-O-(sodio-oxisulfonil)-D-glicero-D-galacto-2-nonulopiranosid]onato (MBX-300),

BTA-C286,

N-(2-((S)-2-(5-((S)-3-aminopirrolidin-1-il)-6-metilpirazolo[1,5-a]pirimidin-2-il) piperidin-1-carbonil)-4-clorofenil) metanosulfonamida (GS-5806),

un nanoanticuerpo anti-RSV y

un inhibidor de fusión de péptidos,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

6. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 5, en donde el inhibidor de fusión de péptidos se selecciona del grupo que consiste en:

un péptido que tiene la secuencia DEFDASISQVNEKINQSLAFIRKSDELL (T-67) y

un péptido que tiene la secuencia FDASISQVNEKINQSLAFIRKSDELLHNVNAGKST (T-118).

7. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es un inhibidor de proteínas N.

8. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 7, en donde el inhibidor de proteínas N se selecciona del grupo que consiste en (S)-1-(2-fluorofenil)-3-(2-oxo-5-fenil-2,3-dihidro-1H-benzo[e] [1,4]diazepin-3-il)urea (RSV-604), STP-92 (ARNip distribuido a través de los sistemas de suministro basados en nanopartículas, Sirnaomics) e iKT-041 (Inhibikasa), o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

9. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es un inhibidor de la polimerasa del RSV.

10. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 9, en donde el inhibidor de la polimerasa del RSV se selecciona del grupo que consiste en:

6-{4-[(bifenil-2-ilcarbonil) amino]benzoil}-N-ciclopropil-5,6-dihidro-4H-tieno[3,2-d][1]benzazepin-2-carboxamida (YM 53403),

N-ciclopropil-5-(4-(2-(pirrolidin-1-il)benzamido) benzoil)-5,6,7,10-tetrahidrobenzo[b]ciclopenta[d]azepin-9-carboxamida,

6-(4-(2-(2-oxa-7-azaespiro[3.5]nonan-7-il)nicotinamido) benzoil)-N-ciclopropil-5,6-dihidro-4H-benzo[b]tieno[2.3-d]azepin-2-carboxamida,

4-amino-8-(3-[[2-(3,4-dimetoxifenil) etil] amino]propil)-6,6-dimetil-2-(4-metil-3-nitrofenil)-1H-imidazo[4,5-H]-isoquinolin-7,9(6H,8H)-diona y

6-(4-(2-(2-oxa-7-azaespiro[3.5]nonan-7-il) nicotinamido) benzoil)-N-ciclopropil-5,6-dihidro-4H-benzo[b]tieno[2.3-d]azepin-2-carboxamida (AZ27),

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

11. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es un inhibidor de IMPDH.

12. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 11, en donde el inhibidor de IMPDH se selecciona del grupo que consiste en:

ribavirina,

5-etinil-1-beta-D-ribofuranosilimidazol-4-carboxamida (EICAR),

4-hidroxi-3-beta-D-ribofuranosilpirazol-5-carboxamida (pirazofurin),

1-((2R,3R,4S,5R)-3,4-dihidroxi-5-(hidroximetil)tetrahidrofuran-2-il)-
1H-1,2,4-triazol-3-carboximidamida (Taribavirin, viramidina),
1,3,4-tiadiazol-2-ilcianamida (LY253963),
tetrahidrofuran-3-il-3-(3-(3-metoxi-4-(oxazol-5-il) fenil)
ureido)benzilcarbamato (VX-497),
ácido (4E)-6-(4-hidroxi-6-metoxi-7-metil-3-oxo-1,3-dihidro-2-
benzofuran-5-il)-4-metilhex-4-enoico (ácido micofenólico) y
2-morfolin-4-iletíl-(E)-6-(4-hidroxi-6-metoxi-7-metil-3-oxo-1H-2-
benzofuran-5-il)-4-metilhex-4-enoato (micofenolato mofetilo),
o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

13. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es un interferón.

14. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 13, en donde el interferón es un interferón pegilado.

15. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 13-14, en donde el interferón es un interferón tipo 1.

16. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 15, en donde el interferón tipo 1 es un alfa-interferón (IFN- α).

17. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 16, en donde el IFN- α se selecciona del grupo que consiste en interferón-alfa-2a (PEGASYS®), interferón-alfa-2b pegilado (PEG-INTRON®) e interferón alfacon-1 (INFERGEN®).

18. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 15, en donde el interferón tipo 1 es un beta-interferón (IFN- β).

19. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 13-14, en donde el interferón es un interferón tipo 2.

20. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 13-14, en donde el interferón es un interferón tipo 3.

21. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 20, en donde el interferón tipo 3 es un lambda-interferón (IFN- λ).

22. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 21, en donde el IFN- λ es lambda interferón pegilado.

23. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde uno o más del compuesto (B) es otro compuesto que inhibe el virus RSV.

24. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 23, en donde el otro compuesto se selecciona del grupo que consiste en

un oligonucleótido de ARN bicatenario,

5-metil-N-[4-(trifluorometil) fenil]-isoxazol-4-carboxamida (leflumomida),

N-(2-cloro-4-metilfenil)-2-((1-(4-metoxifenil)-1H-benzo[d]imidazol-2-il)tio) propanamida (JMN3-003),

Medi-559,

Medi-534,

Medi-557,

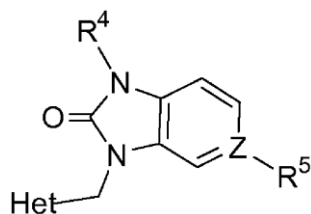
una formulación intratraqueal de CC10 humana recombinante (CG-100),

inmunoglobulina humana de título alto (RI-001, ADMA Biologics Inc.) y

un mAb no neutralizante contra la proteína G (mAb 131-2G),
o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

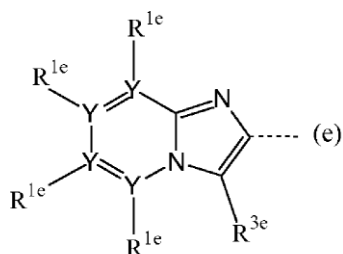
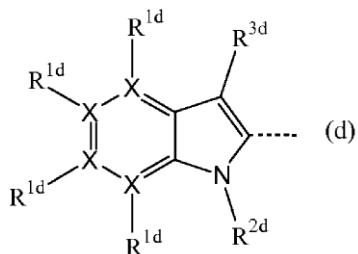
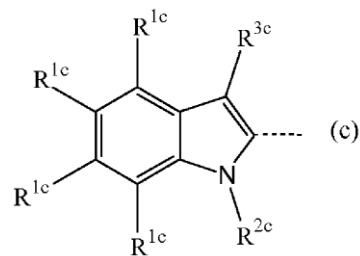
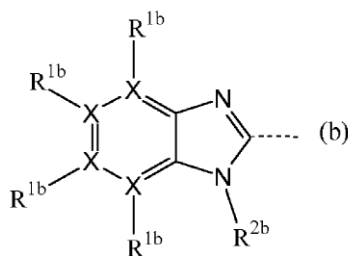
25. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 24, en donde el oligonucleótido de ARN bicatenario es ALN-RSV01 o ALN-RSV02.

26. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B1) que tiene la estructura:



o una forma estereoisomérica de esta, en donde

Het es un heterociclo que tiene la fórmula (b), (c), (d) o (e)



cada X es, independientemente, C o N; siempre que al menos un X sea N;

R^{1b} está presente cuando Het tiene la fórmula (b) y X es C; cada R^{1b} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquilo de C₁-C₆, N(R⁶)₂, CO(R⁷), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃, B(OH)₂ y B(O-alquilo de C₁-C₆)₂; R^{1b} está ausente cuando el X al que está unido es N;

R^{2b} es $-(CR^8R^9)_m-R^{10b}$;

cada R⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃;

cada R⁷ se selecciona independientemente del grupo que consiste en OH, alquilo de C₁-C₆, NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂;

cada R⁸ y R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₁₀ y cicloalquilo de C₃-C₇; o R⁸ y R⁹ se agrupan para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{10b} se selecciona del grupo que consiste en H, R¹¹, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, CONR⁸R⁹, COOR⁸, CON(R⁸)SO₂R⁹, CON(R⁸)SO₂N(R⁸R⁹), NR⁸R⁹, NR⁸COOR⁹, OCOR⁸, O-bencilo, NR⁸SO₂R⁹, SO₂NR⁸R⁹, SO₂R⁸, OCONR⁸R⁹, OCONR⁸R¹², N(R⁸)CON(R⁸R⁹), N(R⁸)COOR¹² y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

m es un entero de 2 a 6;

R^{11} se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF_3 , CH_3 , OCH_3 , OCF_3 y halógeno;

R^{12} se selecciona del grupo que consiste en fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF_3 , CH_3 , OCH_3 , OCF_3 y halógeno; o R^{12} es alquilo de C_1-C_6 o cicloalquilo de C_3-C_7 ; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF_3 , CH_3 , OCH_3 , OCF_3 y halógeno;

R^{1c} está presente cuando Het tiene la fórmula (c);

cada R^{1c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^{7c})$, CH_2NH_2 , CH_2OH , CN, $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$;

R^{3c} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 y $CO(R^{7c})$;

R^{2c} es $-(CR^8R^9)_m-R^{10c}$;

R^{7c} se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C_1-C_6), NH_2 , $NHSO_2N(\text{alquilo de } C_1-C_6)_2$, $NHSO_2NHCH_3$, $NHSO_2(\text{alquilo de } C_1-C_6)$, $NHSO_2(\text{cicloalquilo de } C_3-C_7)$, $N(\text{alquilo de } C_1-C_6)_2$, NR^8R^9 y NR^9R^{10c} ;

R^{10c} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $C(=NOH)NH_2$, $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CONR^8SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R^{1d} está presente cuando Het tiene la fórmula (d) y X es C; cada R^{1d} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, OH, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquiloxi de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^7)$, CH_2NH_2 , CH_2OH , $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$; R^{1d} está ausente cuando el X al que está unido es N;

R^{3d} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquiloxi de C_1-C_6 y $CO(R^7)$;

R^{2d} es $-(CR^8R^9)_m-R^{10d}$;

R^{10d} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CONR^8SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

cada Y es independientemente C o N;

R^{1e} está presente cuando Het tiene la fórmula (e) e Y es C; cada R^{1e} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquiloxi de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^7)$, CH_2NH_2 , CH_2OH , CN, $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$; R^{1e} está ausente cuando el Y al que está unido es N;

R^{3e} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, $-(CR^8R^9)_m-$, R^{10e} , $C\equiv C-CH_2-R^{10e}$, $C\equiv C-R^{10e}$ y $C=C-R^{10e}$;

R^{10e} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , alquiloxi de C_1-C_6 , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CON(R^8)SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en terc-butilo, Het^1 , arilo, Het^2 , $CH(CH_3)(CF_3)$ y cicloalquilo de C_3-C_7 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halo y alquilo de C_1-C_4 ;

arilo representa fenilo o naftalenilo; el arilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo alquiloxi de C_1-C_4 , alquilo de C_1-C_4 , OH, CN, CF_2H , CF_3 , CF_3O , $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CON(R^8)SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 , $CONR^8R^9$, $CONR^8R^{12}$, $N(R^8)CON(R^8R^9)$, $N(R^8)COOR^{12}$; o alquiloxi de C_1-C_4 alquiloxi de C_1-C_4 ;

Het^1 representa un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de N, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno independientemente seleccionado del grupo que consiste en halo, alquiloxi de C_1-C_4 , SO_2R^8 , alquilcarbonilo de C_1-C_4 , $CO(arilo)$, $COHet^2$, alquiloxicarbonilo de C_1-C_4 , piridinilo, CF_3 , $SO_2N(alquilo de C_1-C_4)_2$,

SO₂NH(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄), (C=S)NH(alquilo de C₁-C₄), alquilo de C₁-C₄ y alquilo de C₁-C₄ sustituido con un hidroxilo; o

Het¹ representa un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de O, sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, CF₃, NH(C=O)(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄) y alquilo de C₁-C₄; o Het representa un heterociclo bicíclico no aromático de 7 a 11 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, SO₂R⁸, alquilcarbonilo de C₁-C₄, CO(arilo), COHet², alquilo de C₁-C₄, piridinilo, CF₃, SO₂N(alquilo de C₁-C₄)₂, SO₂NH(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄), (C=S)NH(alquilo de C₁-C₄), alquilo de C₁-C₄ y alquilo de C₁-C₄ sustituido con un hidroxilo;

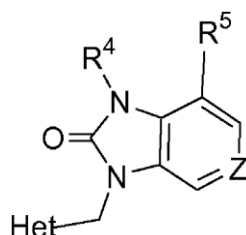
Het² representa un heterociclo monocíclico aromático de 5 a 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico aromático de 8 a 12 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃,

CONR⁸R⁹, COOR⁸, CON(R⁸)SO₂R⁹, CON(R⁸)SO₂N(R⁸R⁹), NR⁸R⁹, NR⁸COOR⁹, OCOR⁸, NR⁸SO₂R⁹, SO₂NR⁸R⁹, SO₂R⁸, OCONR⁸R⁹, OCONRV², N(R⁸)CON(R⁸R⁹), N(R⁸)COOR¹²;

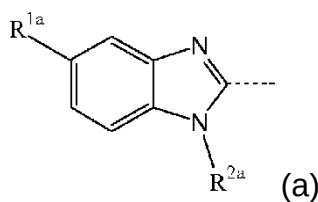
Z es C o N; R⁵ está presente cuando Z es C, por lo cual R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, CF₃ y halógeno; R⁵ está ausente cuando Z es N;

o una sal de adición farmacéuticamente aceptable o un solvato de esta.

27. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B2) que tiene la estructura:



un tautómero o una forma estereoisomérica de este, en donde Het es un heterociclo que tiene la fórmula (a)



R^{1a} es Br o Cl;

R^{2a} es $-(CR^{8a}R^{9a})_n-R^{10a}$;

cada R^{8a} y R^{9a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C_1 - C_{10} y cicloalquilo de C_3 - C_7 ; o R^{8a} y R^{9a} se agrupan para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros; en donde el anillo alifático de 4 a 6 miembros contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{10a} se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C_1 - C_6 , R^{11} , OH, CF_3 , CHF_2 , F, Cl, SO_2CH_3 , SO_2 -cicloalquilo de C_3 - C_7 , $NR^{8a}SO_2R^{8a}$, $SO_2NR^{8a}R^{9a}$, $NR^{8a}SO_2$ -cicloalquilo de C_3 - C_7 , CN, $NR^{8a}R^{9a}$, COOH, $COOR^{8a}$, $CONR^{8a}R^{9a}$, OCO-alquilo de C_1 - C_6 , $CONR^{8a}SO_2R^{9a}$, $CONR^{8a}SO_2NR^{8a}R^{9a}$, un anillo alifático de 4 a 6 miembros y un anillo aromático de 5 a 6 miembros; en donde el anillo alifático o aromático contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{11} se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C_1 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_7 , fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF_3 , CH_3 , OCH_3 , OCF_3 y halógeno;

n es un entero que tiene un valor de 1 a 6;

R^5 se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C_1 - C_6 , alquilo de C_1 - C_6 , CN, CF_3 y halo;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, terc-butilo, cicloalquilo de C_3 - C_7 , $CH(CH_3)(CF_3)$, alquenilo de C_2 - C_{10} , CH_2CF_3 , SO_2CH_3 ,

-CH₂-p-fluorofenilo, arilo, Het¹, Het² y cicloalquilo de C₃-C₇ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halo y alquilo de C₁-C₄;

arilo representa fenilo o naftalenilo; el arilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONR^{8a}R^{9a}, COOR^{8a}, CON(R^{8a})SO₂R^{9a}, CON(R^{8a})SO₂N(R^{8a}R^{9a}), NR^{8a}R^{9a}, NR^{8a}COOR^{9a}, OCOR^{8a}, NR^{8a}SO₂R^{9a}, SO₂NR^{8a}R^{9a}, SO₂R^{8a}, OCONR^{8a}R^{9a}, OCONR^{8a}R^{11a}, N(R^{8a})CON(R^{8a}R^{9a}), N(R^{8a})COOR^{11a} y alquilo de C₁-C₄;

Het¹ representa un heterociclo monocíclico no aromático de 4 a 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico no aromático de 7 a 11 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het¹ está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, SO₂R^{8a}, alquilcarbonilo de C₁-C₄, alquilo carbonilo de C₁-C₄, CO(arilo), COHet², piridinilo, CF₃, SO₂N(alquilo de C₁-C₄)₂, SO₂NH(alquilo de C₁-C₄), NH(C=O)(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄), (C=S)NH(alquilo de C₁-C₄), alquilo de C₁-C₄ y alquilo de C₁-C₄ sustituido con un hidroxilo;

Het² representa un heterociclo monocíclico aromático de 5 a 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo

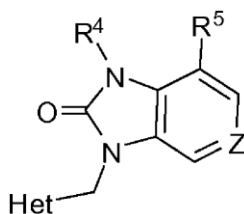
bicíclico aromático de 8 a 12 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONR^{8a}R^{9a}, COOR^{8a}, CON(R^{8a})SO₂R^{9a}, CON(R^{8a})SO₂N(R^{8a}R^{9a}), NR^{8a}R^{9a}, NR^{8a}COOR^{9a}, OCOR^{8a}, NR^{8a}SO₂R^{9a}, SO₂NR^{8a}R^{9a}, SO₂R^{8a}, OCONR^{8a}R^{9a}, OCONR^{8a}R^{11a}, N(R^{8a})CON(R^{8a}R^{9a}), N(R^{8a})COOR^{11a} y alquilo de C₁-C₄;

R^{11a} se selecciona del grupo que consiste en fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno; o R^{11a} puede ser alquilo de C₁-C₆ o cicloalquilo de C₃-C₇; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno;

Z es CH o N;

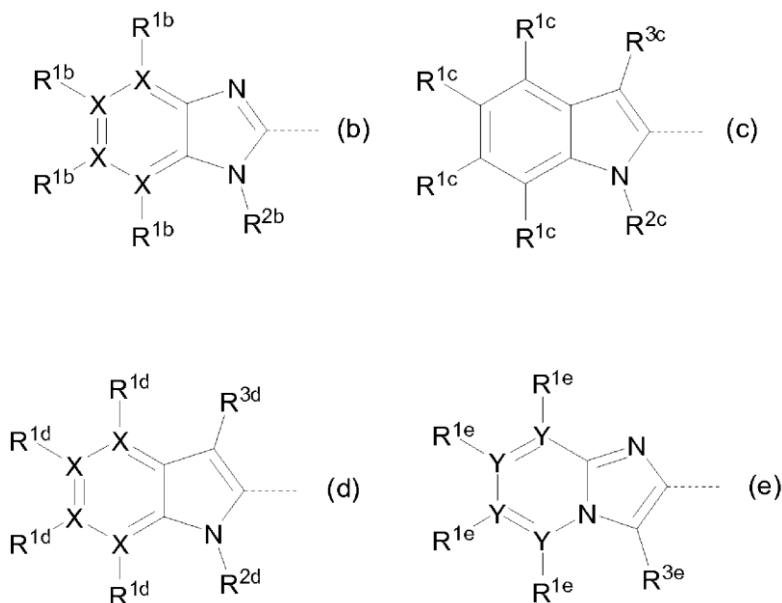
o una sal de adición farmacéuticamente aceptable o un solvato de esta.

28. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B3) que tiene la estructura:



un tautómero o una forma estereoisomérica de este, en donde

Het es un heterociclo que tiene la fórmula (b), (c), (d) o (e)



cada X es independientemente C o N; siempre que al menos un X sea N;

R^{1b} está presente cuando Het tiene la fórmula (b) y X es C; cada R^{1b} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquilo de C₁-C₆, N(R⁶)₂, CO(R⁷), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃, B(OH)₂ y B(O-alquilo de C₁-C₆)₂; R^{1b} está ausente cuando el X al que está unido es N;

R^{2b} es -(CR⁸R⁹)_m-R^{10b};

cada R⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃; cada R⁷ se selecciona

independientemente del grupo que consiste en OH, alquilo de C₁-C₆, NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂;

cada R⁸ y R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆ y cicloalquilo de C₃-C₇; o R⁸ y R⁹ se agrupan para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{10b} se selecciona del grupo que consiste en H, R¹¹, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, CONR⁸R⁹, COOR⁸, CON(R⁸)SO₂R⁹, CON(R⁸)SO₂N(R⁸R⁹), NR⁸R⁹, NR⁸COOR⁹, OCOR⁸, O-bencilo, NR⁸SO₂R⁹, SO₂NR⁸R⁹, SO₂R⁸, OCONR⁸R⁹, OCONR⁸R¹², N(R⁸)CON(R⁸R⁹), N(R⁸)COOR¹² y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R¹¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno;

R¹² se selecciona del grupo que consiste en fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno;

o R¹² es alquilo de C₁-C₆ o cicloalquilo de C₃-C₇; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno;

m es un entero de 2 a 6;

R^{1c} está presente cuando Het tiene la fórmula (c);

cada R^{1c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^{7c})$, CH_2NH_2 , CH_2OH , CN, $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$;

R^{3c} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 y $CO(R^{7c})$;

R^{2c} es $-(CR^8R^9)_m-R^{10c}$;

R^{7c} se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C_1-C_6), NH_2 , $NHSO_2N(\text{alquilo de } C_1-C_6)_2$, $NHSO_2NHCH_3$, $NHSO_2(\text{alquilo de } C_1-C_6)$, $NHSO_2(\text{cicloalquilo de } C_3-C_7)$, $N(\text{alquilo de } C_1-C_6)_2$, NR^8R^9 y NR^9R^{10c} ;

R^{10c} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $C(=NOH)NH_2$, $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CONR^8SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R^{1d} está presente cuando Het tiene la fórmula (d) y X es C; cada R^{1d} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, OH, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^7)$, CH_2NH_2 , CH_2OH , CN, $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$; R^{1d} está ausente cuando el X al que está unido es N;

R^{3d} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 y $CO(R^7)$;

R^{2d} es $-(CR^8R^9)_m-R^{10d}$;

R^{10d} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CONR^8SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

cada Y es independientemente C o N;

R^{1e} está presente cuando Het tiene la fórmula (e) e Y es C; cada R^{1e} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_7 , alquilo de C_1-C_6 , $N(R^6)_2$, $CO(R^7)$, CH_2NH_2 , CH_2OH , CN, $C(=NOH)NH_2$, $C(=NOCH_3)NH_2$, $C(=NH)NH_2$, CF_3 , OCF_3 , $B(OH)_2$ y $B(O\text{-alquilo de } C_1-C_6)_2$; R^{1e} está ausente cuando el Y al que está unido es N;

R^{3e} se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, $-(CR^8R^9)_m-R^{10e}$, $C\equiv C-CH_2-R^{10e}$, $C\equiv C-R^{10e}$ y $C=C-R^{10e}$;

R^{10e} se selecciona del grupo que consiste en H, R^{11} , alquilo de C_1-C_6 , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $CONR^8R^9$, $COOR^8$, $CON(R^8)SO_2R^9$, $CON(R^8)SO_2N(R^8R^9)$, NR^8R^9 , NR^8COOR^9 , $OCOR^8$, $NR^8SO_2R^9$, $SO_2NR^8R^9$, SO_2R^8 y un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R^5 se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C_1-C_6 , alquilo de C_1-C_6 , CN, CF_3 y halógeno;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, cicloalquilo de C_3-C_7 , terc-butilo, alqueno de C_2-C_{10} , CH_2CF_3 , $CH(CH_3)(CF_3)$, SO_2CH_3 , $-CH_2-p-$

fluorofenilo, arilo, Het¹, Het² y cicloalquilo de C₃-C₇ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halo y alquilo C₁-C₄;

arilo representa fenilo o naftalenilo; el arilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONR⁸R⁹, COOR⁸, CON(R⁸)SO₂R⁹, CON(R⁸)SO₂N(R⁸R⁹), NR⁸R⁹, NR⁸COOR⁹, OCOR⁸, NR⁸SO₂R⁹, SO₂NR⁸R⁹, SO₂R⁸, OCONR⁸R⁹, OCONR⁸R¹², N(R⁸)CON(R⁸R⁹), N(R⁸)COOR¹²;

Het¹ representa un heterociclo monocíclico no aromático de 4 a 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico no aromático de 7 a 11 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het¹ está opcionalmente, sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, SO₂R, alquilcarbonilo de C₁-C₄, CO(arilo), COHet², alquilo carbonilo de C₁-C₄, piridinilo, CF₃, SO₂N(alquilo de C₁-C₄)₂, SO₂NH(alquilo de C₁-C₄), NH(C=O)(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄), (C=S)NH(alquilo de C₁-C₄) y alquilo de C₁-C₄;

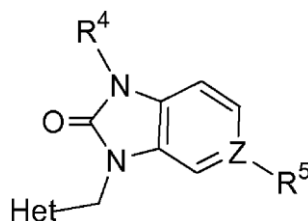
Het² representa un heterociclo monocíclico aromático de 5 a 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico aromático de 8 a 12 miembros que contiene uno o más

heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONRV, COOR⁸, CON(R⁸)SO₂R⁹, CON(R⁸)SO₂N(R⁸R⁹), NR⁸R⁹, NR⁸COOR⁹, OCOR⁸, NR⁸SO₂R⁹, SO₂NR⁸R⁹, SO₂R⁸, OCONR⁸R⁹, OCONR⁸R¹², N(R⁸)CON(R⁸R⁹) y N(R⁸)COOR¹²;

Z es CH o N;

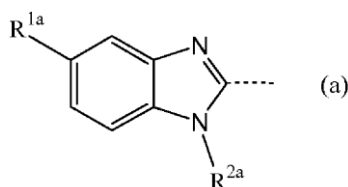
o una sal de adición farmacéuticamente aceptable o un solvato de esta.

29. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B4) que tiene la estructura:



o una forma estereoisomérica de esta, en donde

Het es un heterociclo que tiene la fórmula (a)



R^{1a} es Br o Cl;

R^{2a} es $-(CR^{8a}R^{9a})_n-R^{10a}$;

cada R^{8a} y R^{9a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C_1 - C_{10} y cicloalquilo de C_3 - C_7 ; o R^{8a} y R^{9a} se agrupan para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros; en donde el anillo alifático de 4 a 6 miembros contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{10a} se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C_1 - C_6 , R^{11} , OH, CF_3 , CHF_2 , F, Cl, SO_2CH_3 , SO_2 -cicloalquilo de C_3 - C_7 , $NR^{8a}SO_2R^{8a}$, $SO_2NR^{8a}R^{9a}$, $NR^{8a}SO_2$ -cicloalquilo de C_3 - C_7 , CN, $NR^{8a}R^{9a}$, COOH, $COOR^{8a}$, $CONR^{8a}R^{9a}$, OCO-alquilo de C_1 - C_6 , $CONR^{8a}SO_2R^{9a}$, $CONR^{8a}SO_2NR^{8a}R^{9a}$, un anillo alifático de 4 a 6 miembros y un anillo aromático de 5 a 6 miembros; en donde el anillo alifático o aromático contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en N, S y O;

R^{11} se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C_1 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_7 , fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF_3 , CH_3 , OCH_3 , OCF_3 y halógeno;

n es un entero que tiene un valor de 1 a 6;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en terc-butilo, $CH(CH_3)(CF_3)$, arilo, Het^1 , Het^2 y cicloalquilo de C_3 - C_7 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halo y alquilo C_1 - C_4 ; arilo representa

fenilo o naftalenilo; el arilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquiloxi de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONR^{8a}R^{9a}, COOR^{8a}, CON(R^{8a})SO₂R^{9a}, CON(R^{8a})SO₂N(R^{8a}R^{9a}), NR^{8a}R^{9a}, NR^{8a}COOR^{9a}, OCOR^{8a}, NR^{8a}SO₂R^{9a}, SO₂NR^{8a}R^{9a}, SO₂R^{8a}, OCONR^{8a}R^{9a}, OCONR^{8a}R^{11b}, N(R^{8a})CON(R^{8a}R^{9a}), N(R^{8a})COOR^{11b} y alquilo de C₁-C₄;

Het¹ representa un heterociclo monocíclico no aromático de 4 a 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico no aromático de 7 a 11 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; el Het¹ está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquiloxi de C₁-C₄, SO₂R^{8a} alquilcarbonilo de C₁-C₄, alquiloxicarbonilo de C₁-C₄, CO(arilo), COHet², piridinilo, CF₃, SO₂N(alquilo de C₁-C₄)₂, SO₂NH(alquilo de C₁-C₄), NH(C=O)(alquilo de C₁-C₄), (C=O)NH(alquilo de C₁-C₄), (C=S)NH(alquilo de C₁-C₄), alquilo de C₁-C₄ y alquilo de C₁-C₄ sustituido con un hidroxilo;

Het² representa un heterociclo monocíclico aromático de 5 a 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en O, S y N; o un heterociclo bicíclico aromático de 8 a 12 miembros que contiene uno o más heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente del grupo que

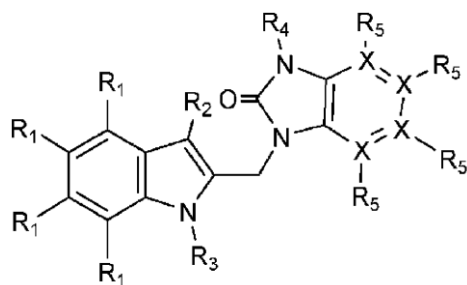
consiste en O, S y N; el Het² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, alquilo de C₁-C₄, OH, CN, CF₂H, CF₃, CONR^{8a}R^{9a}, COOR^{8a}, CON(R^{8a})SO₂R^{9a}, CON(R^{8a})SO₂N(R^{8a}R^{9a}), NR^{8a}R^{9a}, NR^{8a}COOR^{9a}, OCOR^{8a}, NR^{8a}SO₂R^{9a}, SO₂NR^{8a}R^{9a}, SO₂R^{8a}, OCONR^{8a}R^{9a}, OCONR^{8a}R^{11b}, N(R^{8a})CON(R^{8a}R^{9a}), N(R^{8a})COOR^{11b} y alquilo de C₁-C₄;

R^{11b} se selecciona del grupo que consiste en fenilo, piridinilo y pirazolilo; cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno; o R^{11b} es alquilo de C₁-C₆ o cicloalquilo de C₃-C₇; cada uno sustituido con uno o más sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ y halógeno;

Z es C o N; R⁵ está presente cuando Z es C, por lo cual R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, CF₃ y halógeno; R⁵ está ausente cuando Z es N;

o una sal de adición farmacéuticamente aceptable o un solvato de esta.

30. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B5) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

cada X es, independientemente, C o N;

R₁ se selecciona del grupo de H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, N(R₆)₂, CO(R₇), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃ y B(OH)₂; B(O-alquilo de C₁-C₆)₂;

R₂ se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquilo de C₁-C₆ y CO(R₇);

R₃ es -(CR₈R₉)_n-R₁₀;

R₄ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, alqueno de C₂-C₁₀, SO₂-R₈, CH₂CF₃, SO₂CH₃ o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R₅ está presente donde X es C, y se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, CO(R₇), CF₃ y halógeno; R₅ está ausente donde X es N;

R₆ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃;

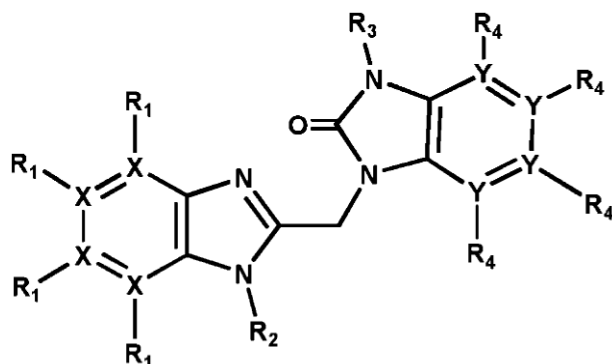
R₇ se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C₁-C₆), NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂, NR₈R₉ y NR₉R₁₀;

n es un entero de 2 a 6;

cada R₈ y R₉ se selecciona independientemente de H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, o R₈ y R₉ agrupados para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo N, S, O;

R₁₀ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, C(=NOH)NH₂, CONR₈R₉, COOR₈, CONR₈SO₂R₉, CON(R₈)SO₂N(R₈R₉), NR₈R₉, NR₈COOR₉, OCOR₈, NR₈SO₂R₉, SO₂NR₈R₉, SO₂NR₈ o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno.

31. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B6) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

cada X es, independientemente, C o N; al menos un X = N;

cada Y es independientemente C o N;

R₁ está presente cuando X = C, y R₁ se selecciona del grupo de H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, N(R₅)₂, CO(R₆), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃ y B(OH)₂; B(O-alquilo de C₁-C₆)₂; R₁ está ausente cuando X = N;

R₂ es -(CR₇R₈)_n-R₉;

R₃ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, alquenilo de C₂-C₁₀, SO₂-R₇; CH₂CF₃, o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R₄ está presente cuando Y es C, y se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, CO(R₇), COO(R₇), CF₃ y halógeno,

R₅ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃;

R₆ se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C₁-C₆), NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂;

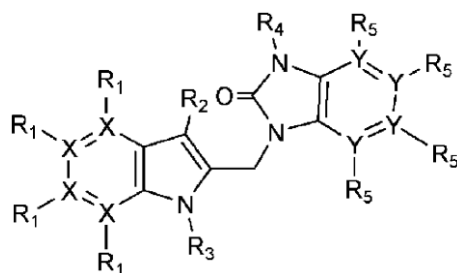
cada R₇ y R₈ se selecciona independientemente de H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, o R₇ y R₈ agrupados para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado del grupo N, S, O;

R₉ se selecciona del grupo que consiste en H, R₁₀, alquilo de C₁-C₆, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, CONR₇R₈, COOR₇, CON(R₇)SO₂R₈, CON(R₇)SO₂N(R₇R₈), NR₇R₈, NR₇COOR₈, OCOR₇, O-bencilo, NR₇SO₂R₈, SO₂ R₇R₈, SO₂R₇, OCONR₇R₈, OCONR₇R₁₀, N(R₇)CON(R₇R₈), N(R₇)COOC; ftalimido, 2-metil-benzotiofen(1,1)dióxido, o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

n es un entero de 2 a 6;

R₁₀ se selecciona del grupo que consiste en alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, fenilo, piridina o pirazol, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃ o halógeno.

32. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B7) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

cada X es independientemente C o N, y al menos un X es N;

R₁ está presente cuando X = C, y R₁ se selecciona del grupo de H, OH, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, NH₂, CO(R₇), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃ y B(OH)₂; B(O-alquilo de C₁-C₆)₂;

R₂ se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alquilo de C₁-C₆ y CO(R₇);

R₃ es -(CR₈R₉)_n-R₁₀;

R₄ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₁₀, CH₂CF₃, cicloalquilo de C₃-C₇, alqueno de C₂-C₁₀, SO₂-R₈ o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R₅ está presente cuando Y es C, y se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, CO(R₇), CF₃ y halógeno;

R₅ está ausente cuando X es N;

R₆ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃;

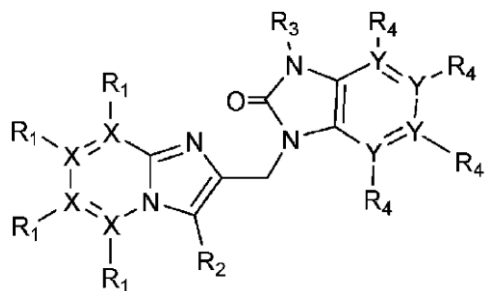
R₇ se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C₁-C₆), NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂;

n es un entero de 2 a 6;

cada R₈ y R₉ se selecciona independientemente de H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, o R₈ y R₉ agrupados para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado del grupo N, S, O;

R₁₀ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, CONR₈R₉, COOR₈, CONR₈SO₂R₉, CON(R₈)SO₂N(R₈R₉), NR₈R₉, NR₈COOR₉, OCOR₈, NR₈SO₂R₉, SO₂NR₈R₉, SO₂R₈ o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno.

33. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B8) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

cada X es independientemente C o N;

cada Y es independientemente C o N;

R₁ está presente cuando X = C, y R₁ se selecciona del grupo de H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₇, alcoxi de C₁-C₆, N(R₅)₂, CO(R₆), CH₂NH₂, CH₂OH, CN, C(=NOH)NH₂, C(=NOCH₃)NH₂, C(=NH)NH₂, CF₃, OCF₃ y B(OH)₂; B(O-alquilo de C₁-C₆)₂; R₁ está ausente cuando X = N

R₂ se selecciona del grupo que consiste en H, halógeno, -(CR₇R₈)_n-R₉, C≡C-CH₂-R₉ y C≡C-R₉, C=C-R₉;

R₃ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₇, alqueno de C₂-C₁₀, SO₂-R₇ o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

R₄ está presente donde Y es C, y se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, CO(R₇), CF₃ y halógeno,

R₅ se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C₁-C₆, COOCH₃ y CONHSO₂CH₃;

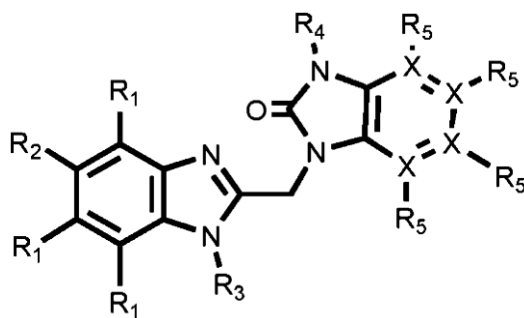
R₆ se selecciona del grupo que consiste en OH, O(alquilo de C₁-C₆), NH₂, NHSO₂N(alquilo de C₁-C₆)₂, NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(alquilo de C₁-C₆), NHSO₂(cicloalquilo de C₃-C₇) y N(alquilo de C₁-C₆)₂;

cada R_7 y R_8 se selecciona independientemente de H, alquilo de C_1 - C_{10} , cicloalquilo de C_3 - C_7 , o R_7 y R_8 se agrupan para formar un anillo alifático de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente al menos un heteroátomo seleccionado del grupo N, S, O;

R_9 se selecciona del grupo que consiste en H, alquilo de C_1 - C_6 , alcoxi de C_1 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_7 , OH, CN, F, CF_2H , CF_3 , $CONR_7R_8$, $COOR_7$, $CON(R_7)SO_2R_8$, $CON(R_7)SO_2N(R_7R_8)$, NR_7R_8 , NR_7COOR_8 , $OCOR_7$, $NR_7SO_2R_8$, $SO_2NR_7R_8$, SO_2R_7 o un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene un átomo de oxígeno;

n es un entero de 2 a 6.

34. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B9) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

cada X es, independientemente, C o N;

R_1 es H;

R_2 se selecciona del grupo que consiste en Br y Cl;

R_3 es $-(CR_6R_7)_n-R_8$;

R_4 se selecciona del grupo que consiste en H, cicloalquilo de C_3-C_7 , alqueno de C_2-C_{10} , $-(CR_6R_7)_n-R_8$, $-CH_2$ -p-fluorofenilo, CH_2CF_3 y $-SO_2CH_3$;

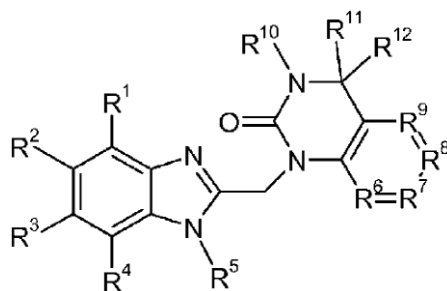
R_5 está presente cuando X es C, por lo cual cada R_5 se selecciona independientemente del grupo que consiste en H, alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , halógeno y CN; R_5 está ausente cuando X es N;

cada R_6 y R_7 se selecciona independientemente de H, alquilo de C_1-C_{10} y cicloalquilo de C_3-C_7 ; o R_6 y R_7 se agrupan para formar un anillo alifático o aromático de 5 a 6 miembros que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados de N, S y O;

R_8 se selecciona del grupo que consiste en H, OH, CF_3 , CHF_2 , F, Cl, SO_2CH_3 , SO_2 -cicloalquilo de C_3-C_7 , $NR_6SO_2R_6$, $SO_2R_6R_7$, R_6SO_2 -cicloalquilo de C_3-C_7 , CN, NR_6R_7 , COOH, COOR₆, CONR₆R₇, OCO-alquilo de C_1-C_6 , CONR₆SOR₇, CONH-R₆-SO₂R₇, CONH-R₆-SO₂NR₆R₇CONR₆SO₂NR₆R₇, ftalimido o un anillo alifático o aromático de 5 a 6 miembros que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados del grupo N, S, O;

n es un entero que tiene un valor de 1 a 6.

35. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B10) que tiene la estructura:



en donde

cada R^1 , R^3 y R^4 representa independientemente H, alquilo de C_{1-6} o halógeno;

R^2 representa H, CN, CH_2NH_2 , $CH_2NH(CH_2)_3NH_2$, $C(=NH)NH_2$ o $C(=NOH)NH_2$;

R^5 representa alquilo de C_{1-6} ; el alquilo de C_{1-6} está opcionalmente sustituido con uno o más de OR^{13} , CF_3 , CN o $NR^{14}R^{15}$, en donde R^{13} representa H o alquilo de C_{1-6} , y R^{14} y R^{15} representan independientemente H, alquilo de C_{1-6} o cicloalquilo de C_{3-7} ; o el grupo $-NR^{14}R^{15}$ junto representa un anillo azacíclico de 5 a 7 miembros que incorpora opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y NR^{19} , en donde R^{19} representa H o alquilo de C_{1-6} ;

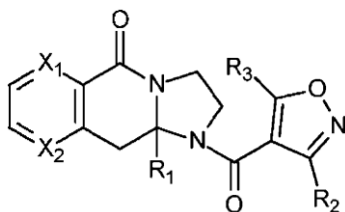
cada R^6 , R^7 , R^8 y R^9 representa independientemente CH, C-F, C-Cl, C- CF_3 o N;

R^{10} representa arilo, heteroarilo, cicloalquilo de C_{3-7} o alquilo de C_{1-6} ; el alquilo de C_{1-6} o cicloalquilo de C_{3-7} está opcionalmente sustituido con uno o más de arilo, cicloalquilo de C_{3-7} , OR^{16} , SR^{16} , halógeno o $NR^{17}R^{18}$, en

donde R^{16} representa H o alquilo de C_{1-6} , y cada R^{17} y R^{18} representa independientemente H, alquilo de C_{1-6} o cicloalquilo de C_{3-7} ; o el grupo - $NR^{17}R^{18}$ representa un anillo azacíclico de 5 a 7 miembros que incorpora opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O, S y NR^{20} , en donde R^{20} representa H o alquilo de C_{1-6} ; y

y cada R^{11} y R^{12} representa independientemente H o alquilo de C_{1-6} .

36. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B11) que tiene la estructura:



o racematos, isómeros y/o sales de estos,

en donde:

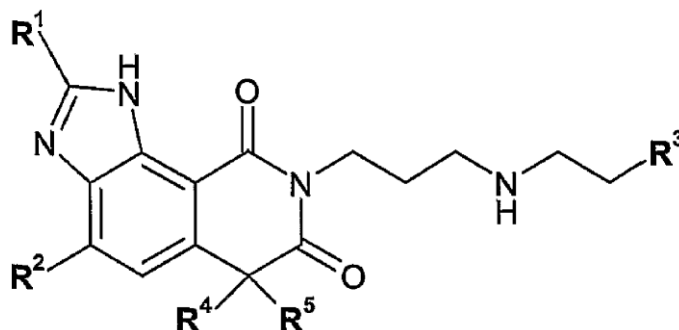
X_1 y X_2 se seleccionan independientemente de CH y N, en donde al menos uno de X_1 y X_2 es N;

R_1 está opcionalmente sustituido, y se selecciona de un anillo carbocíclico, heterocíclico y aromático;

R_2 se selecciona de alquilo de C_{1-6} , halo-alquilo de C_{1-3} y alcoxi de C_{1-3} ; y

R_3 es H o un sustituyente opcional.

37. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B12) que tiene la estructura:



o un enantiómero o una sal de estos,

en donde:

R^1 es $-(CH=CH)_{0-1}$ -arilo de (C_6 o C_{10}) o $-(CH=CH)_{0-1}$ -heteroarilo de 5, 6, 9 o 10 miembros; el arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de: alquilo de (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con amino, halo, haloalquilo de (C_{1-6}), hidroxi, alcoxi de (C_{1-6}), alquiltio de (C_{1-6}), nitro, azido, ciano, amino, alquilamino de (C_{1-6}), di(alquilo de (C_{1-6}) amino, arilo y heteroarilo;

R^2 es H, alquilo de (C_{1-6}), hidroxi, halo, haloalquilo de (C_{1-6}), amino, alquilamino de (C_{1-6}), di(alquilo de (C_{1-6}) amino o alquilo de (C_{2-6});

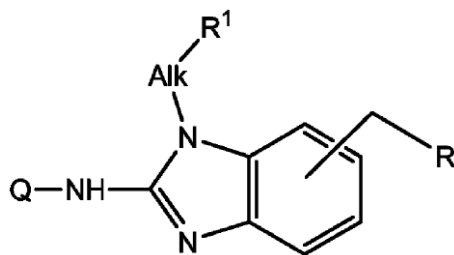
R^3 es arilo de (C_6 , C_{10} o C_{14}) o heteroarilo de 5, 6, 9 o 10 miembros, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de: alquilo de (C_{1-6}), halo, haloalquilo de (C_{1-6}), hidroxi, alcoxi de (C_{1-6}), alquiltio de (C_{1-6}), nitro,

amino, alquilamino de (C₁₋₆), di(alquilo de ((C₁₋₆)amino y COO(alquilo de C₁₋₆); y

y cada R⁴ y R⁵ es independientemente H o alquilo de (C₁₋₆); o R⁴ y R⁵ se unen, junto con el átomo de carbono al cual están unidos, para formar un grupo cicloalquilo de (C₃₋₇);

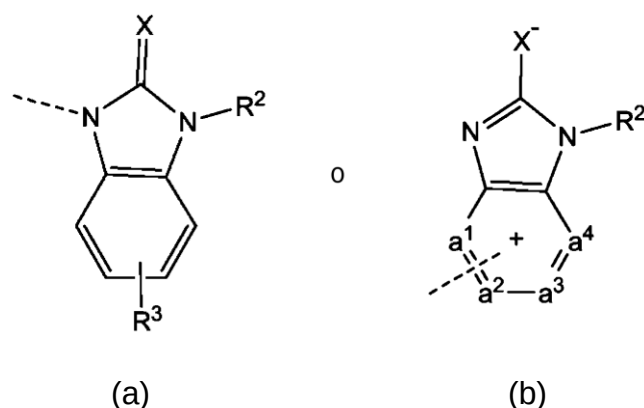
con la condición de que R¹ no sea 2-metoxifenilo, cuando R² H, R³ es 3,4-dimetoxifenilo, R⁴ es CH₃ y R⁵ es CH₃.

38. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B13) que tiene la estructura:



o una sal o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,
en donde:

R es un radical de fórmula



Q es hidrógeno o alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido con un heterociclo, o Q es alquilo de C₁₋₆ sustituido con un radical -OR⁴ y un heterociclo; en donde el heterociclo se selecciona del grupo que consiste en oxazolidina, tiazolidina, 1-oxo-tiazolidina, 1,1-dioxotiazolidina, morfolinilo, tiomorfolinilo, 1-oxo-tiomorfolinilo, 1,1-dioxotiomorfolinilo, hexahidrooxazepina, hexahidrotiazepina, 1-oxo-hexahidrotiazepina, 1,1-dioxo-hexahidrotiazepina, pirrolidina, piperidina, homopiperidina, piperazina; en donde cada heterociclo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo de C₁₋₆, hidroxi-alquilo de C₁₋₆, aminocarbonil-alquilo de C₁₋₆, hidroxi, carboxilo, alquilo oxycarbonilo de C₁₋₆, aminocarbonilo, mono o di(alquilo de C₁₋₆)aminocarbonilo, alquilcarbonilamino de C₁₋₆, aminosulfonilo y mono o di(alquilo de C₁₋₆)aminosulfonilo;

Alk es alcanodiilo de C₁₋₆;

X es O o S;

-a¹=a²-a³=a⁴- es un radical bivalente de fórmula -N=CH-CH=CH-, -CH=N-CH=CH-, -CH=CH-N=CH- o -CH=CH-CH=N-; en donde uno de los

átomos de nitrógeno porta el radical de unión del enlace químico (b) con el resto de la molécula;

R^1 es Ar o un heterociclo seleccionado de piridilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, furanilo, tetrahidrofuranilo, tienilo, pirrolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, benzotienilo, bencimidazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, piridopiridil, naftiridinil, 1H-imidazo[4,5-b]piridinilo, 3H-imidazo[4,5-b]-piridinilo, imidazo[1,2-a]piridinilo y 2,3-dihidro-1,4-dioxino[2,3-b]piridilo; en donde cada heterociclo puede estar opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste en halo, hidroxilo, amino, ciano, carboxilo, alquilo de C_{1-6} , alquilo de C_{1-6} , hidroxilo-alquilo de C_{1-6} , (alquilo de C_{1-6})alquilo de C_{1-6} , alquilo de C_{1-6} , alquilo de C_{1-6} alquilo de C_{1-6} , hidroxilo-alquilo de C_{1-6} , mono o di(alquilo de C_{1-6})amino, mono o di(alquilo de C_{1-6})amino alquilo de C_{1-6} , polihalo alquilo de C_{1-6} , alquilcarbonilamino de C_{1-6} , alquilo carbonilo de C_{1-6} , aminocarbonilo, mono y di alquilaminocarbonilo de C_{1-6} ;

R^2 es hidrógeno, alquilo de C_{1-6} , hidroxilo-alquilo de C_{1-6} , alquilo de C_{1-6} -alquilo de C_{1-6} , Ar-alquilo de C_{1-6} -alquilo de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-7} , ciano-alquilo de C_{1-6} , Ar-alquilo de C_{1-6} , Het-alquilo de C_{1-6} ;

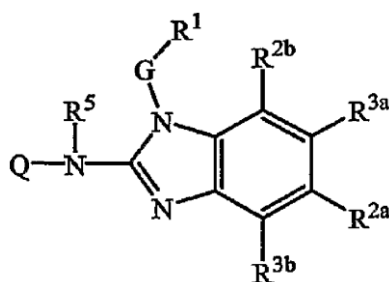
R^3 es hidrógeno, alquilo de C_{1-6} , ciano, aminocarbonilo, polihalo-alquilo de C_{1-6} , alquilo de C_{2-6} o alquilo de C_{2-6} ;

R^4 es hidrógeno o alquilo de C_{1-6} ;

cada Ar es independientemente fenilo o fenilo sustituido con 1 a 5, tal como 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados de halo, hidroxilo, amino, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino, alquilcarbonilamino de C₁₋₆, alquilsulfonilamino de C₁₋₆, ciano, alquilo de C₁₋₆, alquenilo de C₂₋₆, alquinilo de C₂₋₆, fenilo, hidroxialquilo de C₁₋₆, polihalo-alquilo de C₁₋₆, amino- alquilo de C₁₋₆, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, polihalo-alquilo de C₁₋₆, fenoxi, aminocarbonilo, mono o di(alquilo de C₁₋₆)aminocarbonilo, hidroxycarbonilo, alcoxicarbonilo de C₁₋₆, alquilcarbonilo de C₁₋₆, amino sulfonilo, mono y di(alquilo de C₁₋₆)- aminosulfonilo;

Het es un heterociclo seleccionado del grupo que consiste en piridilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, iuranilo, tetrahidrofurano, tienilo, pirrolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, benzotienilo, bencimidazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, piridopiridilo, naftiridinilo, 1H-imidazo[4,5-b]piridinilo, 3H-imidazo[4,5-b]-piridinilo, imidazo[1,2-a]piridinilo y 2,3-dihidro-1,4-dioxino[2,3-b]piridilo; en donde cada Het puede estar opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, cada uno seleccionado independientemente de halo, hidroxilo, amino, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino, ciano, alquilo de C₁₋₆, hidroxialquilo de C₁₋₆, polihalo-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆.

39. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B14) que tiene la estructura:



o un profármaco, N-óxido, sal de adición, amina cuaternaria, complejo metálico, o una forma estereoquímicamente isomérica de esta,

en donde:

G es un enlace directo o alcanodiilo de C₁₋₁₀ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo de sustituyentes que consisten en hidroxilo, alquilo de C₁₋₆, Ar¹ alquilo de C₁₋₆, alquiltio de C₁₋₆, Ar¹ alquiltio de C₁₋₆, HO(-CH₂-CH₂-O)_n-, alquilo de C₁₋₆ (-CH₂-CH₂-O)_a- o Ar¹-alquilo de C₁₋₆ (-CH₂-CH₂-O)_n-;

cada n es independientemente 1, 2, 3 o 4;

R¹ es Ar¹ o un heterociclo monocíclico o bicíclico seleccionado de piperidinilo, piperazinilo, piridilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, furanilo, tetrahydro-furanilo, tienilo, pinolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, benzotienilo, bencimidazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, piridopiridilo, naftiridinilo, 1H-imidazo[4,5-b]piridinilo, 3H-imidazo[4,5-b]piridinilo, imidazo[1,2-a]piridinilo, 2,3-dihidro-1,4-dioxino[2,3-b]piridilo o un radical de fórmula



en donde cada heterociclo monocíclico o bicíclico puede estar opcionalmente sustituido con 1 o, donde sea posible, más, tales como 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo de sustituyentes que consiste en halo, hidroxilo, amino, ciano, carboxilo, alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆ Ci-ealquilo, Ar¹, Ar¹-alquilo de C₁₋₆, Ar¹-alquilo de C₁₋₆, hidroxilo-alquilo de C₁₋₆, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino-alquilo de C₁₋₆, polihalo-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆-carbonilamino, alquilo de C₁₋₆-SO₂-NR^{5c}-, Ar¹-SO₂-NR^{5c}-, alquilo de C₁₋₆, -C(=O)-NR^{5c}R^{5d}, HO(-CH₂-CH₂-O)_n-, halo(-CH₂-CH₂-O)_n-, alquilo de C₁₋₆-(-CH₂-CH₂-O)_n-, Ar¹-alquilo de C₁₋₆ (-CH₂-CH₂-O)_n- y mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino(-CH₂-CH₂-O)_n-;

cada m es independientemente 1 o 2;

cada p es independientemente 1 o 2;

cada t es independientemente 0, 1 o 2;

Q es hidrógeno, amino o mono o di(alquilo de C₁₋₄) amino;

uno de R^{2a} y R^{3a} se selecciona de halo, alquilo de C₁₋₆ opcionalmente mono o polisustituido, alqueno de C₂₋₆ opcionalmente mono o polisustituido, nitro, hidroxilo, Ar², N(R^{4a}R⁴), N(R^{4a}R^{4b})sulfonilo, N(R^{4a}R⁴)carbonilo, alquilo de C₁₋₆, Ar²oxi, Ar²-alquilo de C₁₋₆, carboxilo, alquilo de C₁₋₆ o -C(=Z)Ar²; y el otro de R^{2a} y R^{3a} es hidrógeno; en donde =Z es =O, =CH-C(=O)-NR^{5a}R^{5b}, =CH₂, =CH-alquilo de C₁₋₆, =N-OH o =N-O-alquilo de C₁₋₆; y los sustituyentes opcionales de alquilo de C₁₋₆ y alqueno de C₂₋₆ pueden ser iguales o pueden ser diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente del grupo de sustituyentes que consiste en hidroxilo, ciano, halo, nitro, N(R^{4a}R^{4b}), N(R^{4a}R^{4b})sulfonilo, Het, Ar², alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆-S(=O)_t, Ar²oxi, Ar²-S(=O)_t, Ar²-alquilo de C₁₋₆, Ar²-alquilo de C₁₋₆-S(=O)_t, Het-oxi, Het-S(=O)_t, Het-alquilo de C₁₋₆, Het-alquilo de C₁₋₆-S(=O)_t, carboxilo, alquilo de C₁₋₆ y -C(=Z)Ar²;

en el caso de que R^{2a} no sea hidrógeno, entonces R^{2b} es hidrógeno, alquilo de C₁₋₆ o halógeno, y R^{3b} es hidrógeno;

en el caso de que R^{3a} no sea hidrógeno, entonces R^{3b} es hidrógeno, alquilo de C₁₋₆ o halógeno, y R^{2b} es hidrógeno;

R^{4a} y R^{4b} pueden ser iguales o pueden ser diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente del grupo de sustituyentes que

consiste en hidrógeno, alquilo de C₁₋₆, Ar²-alquilo de C₁₋₆, (Ar²)(hidroxi)alquilo de C₁₋₆, Het-alquilo de C₁₋₆, hidroxi alquilo de C₁₋₆, mono y di(alquilo de C₁₋₆)alquilo de C₁₋₆, (hidroxi-alquilo de C₁₋₆)oxi-alquilo de C₁₋₆, Ar¹ alquilo de C₁₋₆, (alquilo de C₁₋₆)alquilo de C₁₋₆, dihidroxi alquilo de C₁₋₆, (alquilo de C₁₋₆)(hidroxi)alquilo de C₁₋₆, (Ar¹ alquilo de C₁₋₆)(hidroxi)alquilo de C₁₋₆, Ar¹oxi-alquilo de C₁₋₆, (Ar¹oxi)(hidroxi)-alquilo de C₁₋₆, amino alquilo de C₁₋₆, mono y di(alquilo de C₁₋₆)amino-alquilo de C₁₋₆, carboxi-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, aminocarbonil alquilo de C₁₋₆, mono y di(alquilo de C₁₋₆)aminocarbonil-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, (alquilo de C₁₋₄)₂P(=O)-alquilo de C₁₋₆, (alquilo de C₁₋₄)₂P(=O)-O-alquilo de C₁₋₆, aminosulfonil-alquilo de C₁₋₆, mono y di(alquilo de C₁₋₆)aminosulfonil-alquilo de C₁₋₆, alquilo de C₁₋₆, Ar²carbonilo, Het-carbonilo, Ar²alquilcarbonilo de C₁₋₆, Het-alquilcarbonilo de C₁₋₆, alquilsulfonilo de C₁₋₆, aminosulfonilo, mono y di(alquilo de C₁₋₆)aminosulfonilo, Ar²sulfonilo, Ar²-alquilsulfonilo de C₁₋₆, Ar², Het, Het-sulfonilo, Het-alquilsulfonilo de C₁₋₆;

R^{5a} y R^{5b} pueden ser iguales o pueden ser diferentes entre sí, y cada uno es independientemente hidrógeno o alquilo de C₁₋₆; o

R^{5a} y R^{5b} agrupados pueden formar un radical bivalente de fórmula - (CH₂)_s- en donde s es 4 o 5;

R^{5c} y R^{5d} pueden ser iguales o pueden ser diferentes entre sí, y cada uno es independientemente hidrógeno o alquilo de C₁₋₆; o

R^{5c} y R^{5d} agrupados pueden formar un radical bivalente de fórmula - (CH₂)_s- en donde s es 4 o 5;

R^{6a} es hidrógeno, alquilo de C_{1-6} , Ar^1 , Ar^1 -alquilo de C_{1-6} , alquilcarbonilo de C_{1-6} , Ar^1 carbonilo, Ar^1 alquilcarbonilo de C_{1-6} , alquilsulfonilo de C_{1-6} , Ar^1 sulfonilo, Ar^1 alquilsulfonilo de C_{1-6} , alquilo de C_{1-6} -alquilo de C_{1-6} , amino-alquilo de C_{1-6} , mono o di(alquilo de C_{1-6})amino-alquilo de C_{1-6} , hidroxialquilo de C_{1-6} , (carboxil)-alquilo de C_{1-6} , (alquiloalquilcarbonilo de C_{1-6})-alquilo de C_{1-6} , aminocarbonil-alquilo de C_{1-6} , mono y di(alquilo de C_{1-6})aminocarbonil-alquilo de C_{1-6} , aminosulfonil-alquilo de C_{1-6} , mono y di(alquilo de C_{1-6})aminosulfonil-alquilo de C_{1-6} , Het, Het-alquilo de C_{1-6} , Het-carbonilo, Het-sulfonilo, Het-alquilcarbonilo de C_{1-6} ;

R^{6b} es hidrógeno, alquilo de C_{1-6} , Ar^1 o Ar^1 -alquilo de C_{1-6} ;

R^{6c} es alquilo de C_{1-6} , Ar^1 o Ar^1 -alquilo de C_{1-6} ;

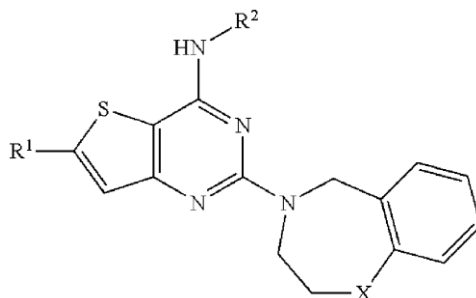
Ar^1 es fenilo o fenilo sustituido con 1 o más, tal como 2, 3 o 4 sustituyentes, seleccionados de halo, hidroxialquilo de C_{1-6} , hidroxialquilo de C_{1-6} , polihaloalquilo de C_{1-6} y alquilo de C_{1-6} ;

Ar^2 es fenilo, fenilo unido con cicloalquilo de C_{5-7} , o fenilo sustituido con 1 o más, tal como 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, seleccionados de halo, ciano, alquilo de C_{1-6} , Het-alquilo de C_{1-6} , Ar^1 -alquilo de C_{1-6} , cianoalquilo de C_{1-6} , alqueno de C_{2-6} , cianoalqueno de C_{2-6} , R^{6b} -O-alqueno de C_{3-6} , alquino de C_{2-6} , cianoalquino de C_{2-6} , R^{6b} -O-alquino de C_{3-6} , Ar^1 , Het, R^{6b} -O-, R^{6b} -S-, R^{6c} -SO-, R^{6c} -SO₂-, R^{6b} -O-alquilo de C_{1-6} -SO₂-, -N(R^{6a} R^{6b}), polihaloalquilo de C_{1-6} , polihaloalquilo de C_{1-6} , polihaloalquilo de C_{1-6} , R^{6c} -C(=O)-, R^{6b} -O-C(=O)-, -N(R^{6a} R^{6b})-C(=O)-, R^{6b} -O-alquilo de C_{1-10} , R^{6b} -S-alquilo de C_{1-6} , R^{6c} -S(=O)₂-alquilo de C_{1-6} , -N(R^{6a} R^{6b})-alquilo de C_{1-6} , R^{6c} -

C(=O)-alquilo de C₁₋₆, R^{6b}-O-C(=O)-alquilo de C₁₋₆, N(R^{6a}R⁶)-C(=O)-alquilo de C₁₋₆, R^{6c}-C(=O)-NR⁶-, R^{6c}-C(=O) -O-, R^{6c}-C(=O) -NR^{6b}-alquilo de C₁₋₆, R^{6c}-C(=O) -O-alquilo de C₁₋₆, N(R^{6a}R^{6b})-S(=O)₂-, H₂N-C(=NH)-;

Het es un heterociclo seleccionado de tetrahydrofuranilo, tetrahidrotienilo, pinolidinilo, pinolidinonilo, furanilo, tienilo, pinolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, piperidinilo, homopiperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, piridilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, tetrahydroquinolinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzodioxanilo, benzodioxolilo, indolinilo, indolilo; cada uno de los heterociclos puede estar opcionalmente sustituido con oxo, amino, Ar¹, alquilo de C₁₋₄, amino-alquilo de C₁₋₄, Ar¹-alquilo de C₁₋₄, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amo-alquilo de C₁₋₆, mono o di(alquilo de C₁₋₆)amino, (hidroxi-alquilo de C₁₋₆)amino, y opcionalmente sustituido, además, con uno o dos radicales alquilo de C₁₋₄.

40. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B15) que tiene la estructura:



o una sal o estereoisómero farmacéuticamente aceptables de este.

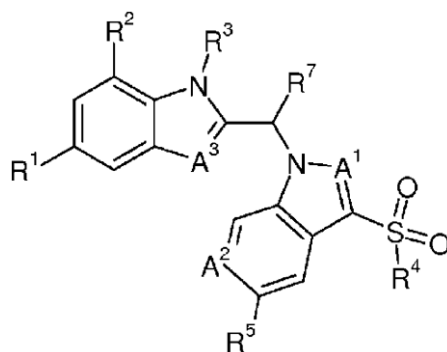
en donde:

R^1 es hidrógeno o un alquilo de C_{1-6} ;

R^2 es (1) amino $(CH_2)_{2-6}$; (2) amino $(CH_2)_{1-6}$ difluorometil $(CH_2)_{1-6}$; (3) amino $(CH_2)_{1-6}$ fluorometil $(CH_2)_{1-6}$; (4) amino $(CH_2)_{0-6}$ oxetanil $(CH_2)_{1-6}$; (5) amino $(CH_2)_{1-6}$ oxetanil $(CH_2)_{0-6}$; o (6) pirrolidin-3-il, no sustituido o sustituido en la posición 4 por halógeno; y

X es $-O-$, $-S-$, $-S(=O)-$, $-S(O_2)-$, $-CH_2-$, $-CF_2-$ o $-NH-$.

41. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B16) que tiene la estructura:



o una sal farmacéuticamente aceptable de esta,

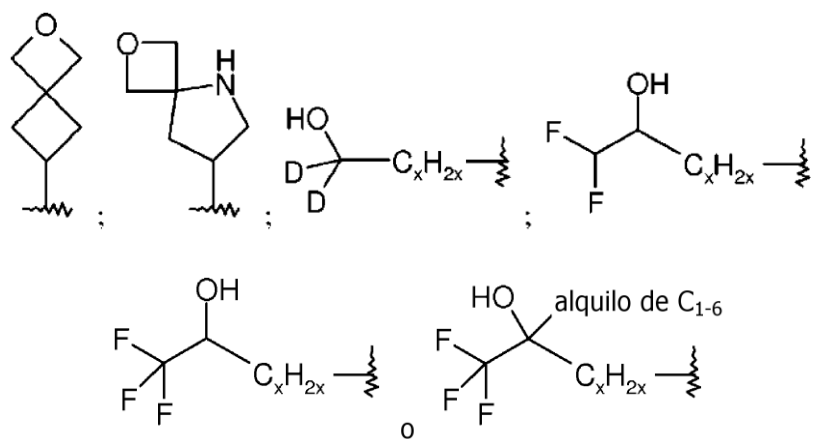
en donde:

R^1 es hidrógeno o halógeno;

R^2 es hidrógeno o halógeno;

R^3 es azetidino; alcoxipiridinilo de C_{1-6} ; alquilsulfonilo de $C_{1-6}-C_xH_{2x}$; carboxicicloalquilo; difluorocicloalquilo; 1,1-dioxo-tetrahidrotienilo;

halopiridinilo; hidroxi- C_yH_{2y} -; hidroxi- C_xH_{2x} -cicloalquilo; hidroxi- C_yH_{2y} -O- C_yH_{2y} -; hidroxicicloalquil- C_zH_{2z} -, sustituido o no sustituido por alquilo de C_{1-3} , hidroxi o hidroxi- C_xH_{2x} -; 4-hidroxipiperidin-1-il- C_yH_{2y} -; 3-hidroxi-pirrolidin-1-il- C_yH_{2y} -; morfolinil- C_yH_{2y} -; oxetanilo; oxetanil- C_xH_{2x} -, sustituido o no sustituido por alquilo de C_{1-3} ; piperidinilo; oxo-piperidinilo; oxo-pirrolidinilo; pirrolidinilo, no sustituido o sustituido por alquilcarbonilo de C_{1-6} , alquilsulfonilo de C_{1-6} , hidroxi- C_yH_{2y} -, hidroxi- C_xH_{2x} -carbonilo, amino- C_xH_{2x} -carbonilo o trifluorometil- C_xH_{2x} -; tetrahidrofuran-3-il- C_zH_{2z} -; tetrahidropiraniilo; trifluorometil- C_xH_{2x} -;



R^4 es alquilo o cicloalquilo de C_{1-6} ;

R^5 es hidrógeno o halógeno;

R^7 es hidrógeno o alquilo de C_{1-6} ;

A^1 es -N- o -CH;

A^2 es -N-, -NO o -CH;

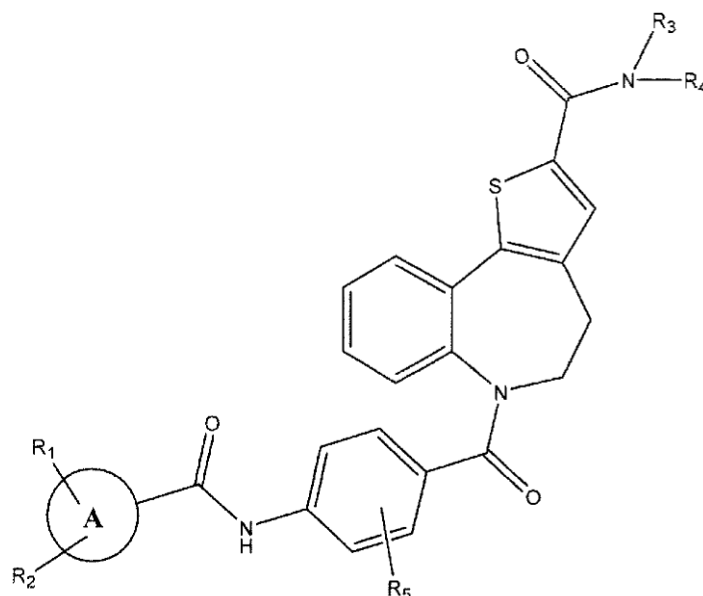
A^3 es -N- o -CH;

x es 1-6;

y es 2-6;

z es 0-6.

42. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B17) que tiene la estructura:



o una sal farmacéuticamente aceptable de esta,

en donde:

A es arilo o heteroarilo;

R₁ es alquilo, alcoxi, haloalquilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, cicloalquilo; el heterociclilo está opcionalmente sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, hidroxilo, haloalquilo, alcoxi, alquilo, alcoxi-alquilo, hidroxilo-alquilo, CN, alquil-NH-; el arilo o heteroarilo están opcionalmente sustituidos por

uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo, alcoxi, alquil-NH-, con la condición de que cuando A es arilo, R₁ es arilo no sustituido;

R₂ es hidrógeno, alquilo, alcoxi, amino, alquil-NH-, CN, alquilo-SO₂- o halo;

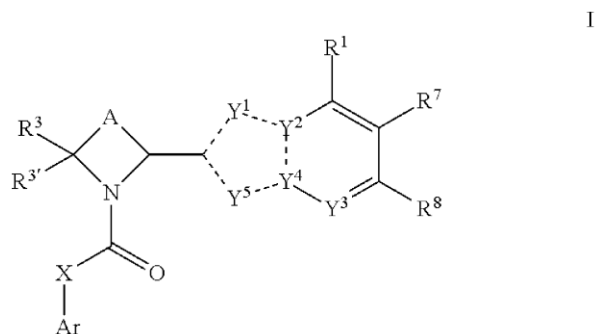
R₃ es hidrógeno, alquilo, heterociclilo, heteroarilo, heteroaril-alquilo o cicloalquilo; el alquilo está opcionalmente sustituido por un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en NH₂-C(O)-, halo, hidroxilo, NH₂-SO₂-, alcoxi-alquilo, heterociclilo; arilo, heteroarilo, CN, alquilo-NH -;

R₄ es hidrógeno o alquilo; o haloalquilo;

R₃ y R₄ agrupados con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman opcionalmente un anillo de 3 a 7 miembros;

R₅ es hidrógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo o halo.

43. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B18) que tiene la estructura:



o una sal farmacéuticamente aceptable de esta,

en donde:

a) Y^1 es N, NH o CH, Y^2 es C, Y^3 es N o $CR^{8'}$, Y^4 es N o C e Y^5 es N, $NR^{2'}$ o CR^2 , en donde al menos dos de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 e Y^5 son independientemente N, NH o $NR^{2'}$; o

b) Y^1 es N, NH o CH, Y^2 es N o C, Y^3 es N o $CR^{8'}$, Y^4 es N o C, e Y^5 es N o $NR^{2'}$, en donde al menos dos de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 e Y^5 son independientemente N, NH o $NR^{2'}$; o

c) Y^1 es N, NH o CH, Y^2 es N o C, Y^3 es $CR^{8'}$, Y^4 es N o C, e Y^5 es N, $NR^{2'}$ o CR^2 , en donde al menos dos de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 e Y^5 son independientemente N, NH o $NR^{2'}$;

los enlaces discontinuos ---- se seleccionan de enlaces simples y enlaces dobles para proporcionar un sistema de anillo aromático;

A es $-(CR^4R^4)_n-$, en donde cualquiera de CR^4R^4 de $-(CR^4R^4)_n-$ puede reemplazarse opcionalmente con $-O-$, $-S-$, $-S(O)_p-$, NH o NR^a ;

n es 3, 4, 5 o 6;

cada p es 1 o 2;

Ar es un grupo heterociclilo de C_2 - C_{20} o un grupo arilo de C_6 - C_{20} , en donde el grupo heterociclilo de C_2 - C_{20} o el grupo arilo de C_6 - C_{20} está opcionalmente sustituido con 1 a 5 R^6 ;

X es $-C(R^{13})(R^{14})-$, $-N(CH_2R^{14})-$ o $-NH-$, o X está ausente;

R^1 es H, $-OR^{11}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{11}$, $-NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN, NO_2 , $-R^{11}$, $-S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno,

alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

R² es H, CN, NO₂, halógeno o alquilo de (C₁-C₈);

R^{2'} es H o alquilo de (C₁-C₈);

R³ es H, -OR¹¹, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹¹, -NR¹¹C(O)NR¹¹R¹², N₃, CN, NO₂, -SR¹¹, -S(O)_pR^a, -NR¹¹S(O)_pR^a, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)_p(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹², -NR¹¹S(O)_p(OR¹¹), -NR¹¹SO_pNR¹¹R¹², -NR¹¹C(=NR¹¹)NR¹¹R¹², halógeno, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

R^{3'} es H, -OR¹¹, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

cada R⁴ es independientemente H, -OR¹¹, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹¹, -NR¹¹C(O)NR¹¹R¹², N₃, CN, NO₂, -SR¹¹, -S(O)_pR^a, -NR¹¹S(O)_pR^a, -C(=O)R¹¹, -C(=O)OR¹¹, -C(=O)NR¹¹R¹², -C(=O)SR¹¹, -S(O)_p(OR¹¹), -SO₂NR¹¹R¹², -NR¹¹S(O)_p(OR¹¹), -NR¹¹SO_pNR¹¹R¹², -NR¹¹C(=NR¹¹)NR¹¹R¹², halógeno, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-

C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈); y

cada R^{4'} es independientemente H, -OR¹¹, alquilo de (C₁-C₈), alqueno de (C₂-C₈), alquino de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

o dos R⁴ en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un enlace doble entre los dos carbonos a los que están unidos, o pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_p-, -NH- o -NR^a-;

o dos R⁴ en átomos de carbono no adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_p-, -NH- o -NR^a-;

o dos R⁴ y dos R^{4'} en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un anillo arilo de C₆ opcionalmente sustituido;

o un R⁴ y un R^{4'} en el mismo átomo de carbono, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_p-, -NH- o -NR^a-;

cada R⁵ es independientemente H, -OR¹¹, -NR¹¹R¹², -NR¹¹C(O)R¹¹, -NR¹¹C(O)OR¹¹, -NR¹¹C(O)NR¹¹R¹², N₃, CN, NO₂, -SR¹¹, -S(O)_pR^a, -

$\text{NR}^{11}\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})_p(\text{OR}^{11})$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{S}(\text{O})_p(\text{OR}^{11})$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_p\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(=\text{NR}^{11})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, halógeno, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

cada R^{5'} es independientemente H, $-\text{OR}^{11}$, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

cada R⁶ es independientemente H, oxo, $-\text{OR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, N₃, CN, NO₂, $-\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, $-\text{NR}^{11}\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{SR}^{11}$, $-\text{S}(\text{O})_p(\text{OR}^{11})$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{S}(\text{O})_p(\text{OR}^{11})$, $-\text{NR}^{11}\text{SO}_p\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, $-\text{NR}^{11}\text{C}(=\text{NR}^{11})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, halógeno, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

o dos R⁶ en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{S}(\text{O})_p-$, $-\text{NH}-$ o $-\text{NR}^a-$;

o cualquier R^6 adyacente al grupo carbonilo obligado del Ar, cuando se agrupa con R^3 , puede formar un enlace o un grupo $-(CR^5R^{5'})_m-$ en donde m es 1 o 2;

o cualquier R^6 adyacente al grupo carbonilo obligado del Ar, cuando se agrupa con R^2 o $R^{2'}$ puede formar un enlace;

R^7 es H, $-OR^{11}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{11}$, $-NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN , NO_2 , $-SR^{11}$, $-S(O)_pR^a$, $-NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno, alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} -alquilo de (C_1-C_8) , cicloalquilo de (C_3-C_7) o cicloalquilo de (C_3-C_7) -alquilo de (C_1-C_8) ;

R^8 es H, $-OR^{11}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{11}$, $-NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN , NO_2 , $-SR^{11}$, $-S(O)_pR^a$, $-NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno, alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} -alquilo de (C_1-C_8) , cicloalquilo de (C_3-C_7) o cicloalquilo de (C_3-C_7) -alquilo de (C_1-C_8) ;

R^8 es H, $-OR^{11}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(O)R^{11}$, $-NR^{11}C(O)OR^{11}$, $-NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN , NO_2 , $-SR^{11}$, $-S(O)_pR^a$, $-NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno,

alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈);

cada R^a es independientemente alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈), en donde cualquier alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈) o alquinilo de (C₂-C₈) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más OH, NH₂, CO₂H, heterociclilo de C₂-C₂₀, y en donde cualquier aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más -OH, -NH₂, CO₂H, heterociclilo de C₂-C₂₀ o alquilo de (C₁-C₈);

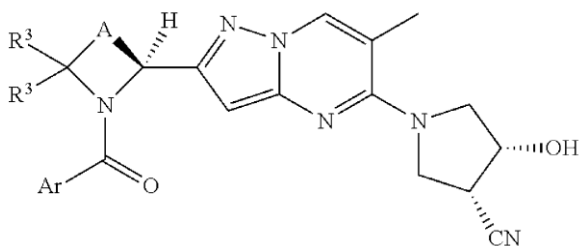
cada R¹¹ o R¹² es independientemente H, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo(C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇), cicloalquilo de (C₃-C₇)- alquilo de (C₁-C₈), -C(=O)R^a o -S(O)_pR^a; o cuando R¹¹ y R¹² están unidos a un nitrógeno, pueden opcionalmente agruparse con el nitrógeno al cual ambos están unidos para formar un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros, en donde cualquier átomo de carbono del anillo heterocíclico puede reemplazarse opcionalmente con -O-, -S-, -S(O)_p-, -NH-, -NR^a- o -C(O)-;

R¹³ es H o alquilo de (C₁-C₈);

R^{14} es H, alquilo de (C₁-C₈), $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$ o $NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$; y

en donde opcionalmente cada alquilo de (C₁-C₈), alqueno de (C₂-C₈), alquino de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀-alquilo de (C₁-C₈), cicloalquilo de (C₃-C₇) o cicloalquilo de (C₃-C₇)-alquilo de (C₁-C₈) de cada R^1 , R^2 , R^2 , R^3 , R^3 , R^4 , R^4 , R^5 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^8 o R^{12} puede estar independientemente sustituido con uno o más oxo, halógeno, hidroxilo, $-NH_2$, CN, N_3 , $-N(R^a)_2$, $-NHR^a$, $-SH$, $-SR^a$, $-S(O)_pR^a$, $-OR^a$, alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), $-C(O)R^a$, $-C(O)H$, $-C(=O)OR^a$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)N(R^a)_2$, $-C(=O)NHR^a$, $-C(=O)NH_2$, $-NHS(O)_pR^a$, $-NR^aS(O)_pR^a$, $-NHC(O)R^a$, $-NR^aC(O)R^a$, $-NHC(O)OR^a$, $-NR^aC(O)OR^a$, $-NR^aC(O)NHR^a$, $-NR^aC(O)N(R^a)_2$, $-NR^aC(O)NH_2$, $-NHC(O)NHR^a$, $-NHC(O)N(R^a)_2$, $-NHC(O)NH_2$, $=NH$, $=NOH$, $=NOR^a$, $-NR^aS(O)_pNHR^a$, $-NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $-NR^aS(O)_pNH_2$, $-NHS(O)_pNHR^a$, $-NHS(O)_pN(R^a)_2$, $-NHS(O)_pNH_2$, $-OC(=O)R^a$, $-OP(O)(OH)_2$ o R^a .

44. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B19) que tiene la estructura:



o una sal o éster de esta,

en donde:

A es $-(C(R^4)_2)_n-$, en donde cualquiera de $C(R^4)_2$ de $-(C(R^4)_2)_n-$ puede reemplazarse opcionalmente con $-O-$, $-S-$, $-S(O)_p-$, NH o NR^a ;

n es 3, 4, 5 o 6;

cada p es 1 o 2;

Ar es un grupo heterociclilo de C_2-C_{20} o un grupo arilo de C_6-C_{20} , en donde el grupo heterociclilo de C_2-C_{20} o el grupo arilo de C_6-C_{20} está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 R^6 ;

cada R^3 , R^4 o R^6 es independientemente H, oxo, OR^{11} , $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN, NO_2 , SR^{11} , $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno, alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) o carbociclilalquilo de (C_4-C_8) ;

o dos R^4 en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar opcionalmente un enlace doble entre los dos carbonos a los que están unidos o pueden formar un anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) , en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) puede reemplazarse opcionalmente por $-O-$, $-S-$, $-S(O)_p-$, $-NH-$ o $-NR^a-$;

o cuatro R^4 en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar opcionalmente un anillo arilo de C_6 opcionalmente sustituido;

o dos R^4 en el mismo átomo de carbono, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) , en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) puede reemplazarse opcionalmente por $-O-$, $-S-$, $-S(O)_P-$, $-NH-$ o $-NR^a-$;

o dos R^6 en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar opcionalmente un anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) , en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) puede reemplazarse opcionalmente por $-O-$, $-S-$, $-S(O)_P-$, $-NH-$ o $-NR^a-$;

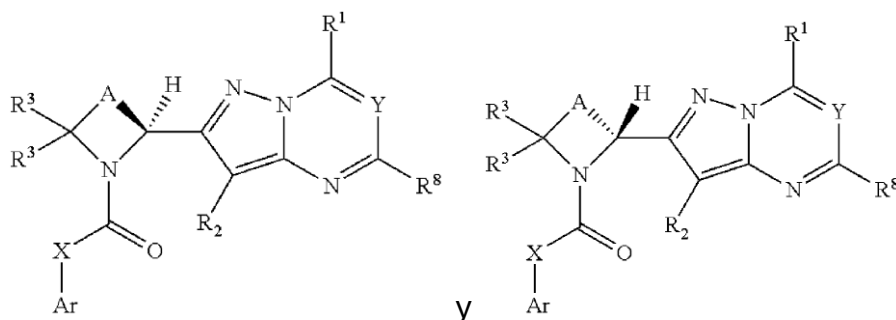
cada R^a es independientemente alquilo de (C_1-C_8) , haloalquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) o carbociclilalquilo de (C_4-C_8) , en donde cualquier alquilo de (C_1-C_8) , haloalquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más OH , NH_2 , CO_2H , heterociclilo de C_2-C_{20} , y en donde cualquier aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) o carbociclilalquilo de (C_4-C_8) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más OH , NH_2 , CO_2H , heterociclilo de C_2-C_{20} o alquilo de (C_1-C_8) ;

cada R^{11} o R^{12} es independientemente H , alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) , carbociclilalquilo de (C_4-C_8) , $-C(=O)R^a$, $-S(O)_pR^a$ o aril-alquilo de (C_1-C_8) ; o R^{11} y R^{12} agrupados con un nitrógeno al cual

ambos están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros, en donde cualquier átomo de carbono del anillo heterocíclico puede reemplazarse opcionalmente con $-O-$, $-S-$, $-S(O)_p-$, $-NH-$, $-NR^a-$; o $-C(O)-$; y

en donde opcionalmente cada alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) o carbociclilalquilo de (C_4-C_8) de cada R^6 , R^{11} o R^{12} está independientemente sustituido con uno o más oxo, halógeno, hidroxilo, NH_2 , CN , N_3 , $N(R^a)_2$, NHR^a , SH , SR^a , $S(O)_pR^a$, OR^a , alquilo de (C_1-C_8) , haloalquilo de (C_1-C_8) , $-C(O)R^a$, $-C(O)H$, $-C(=O)OR^a$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)N(R^a)_2$, $-C(=O)NHR^a$, $-C(=O)NH_2$, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, $NHC(O)R^a$, $NR^aC(O)R^a$, $NHC(O)OR^a$, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, $NHC(O)NH_2$, $=NH$, $=NOH$, $=NOR^a$, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, $-OC(=O)R^a$, $-OP(O)(OH)_2$ o R^a .

45. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B20) que tiene la estructura seleccionada de:



una sal o éster farmacéuticamente aceptables,

en donde:

A es $-(C(R^4)_2)_n-$, en donde cualquiera de $C(R^4)_2$ de $-(C(R^4)_2)_n-$ puede reemplazarse opcionalmente con $-O-$, $-S-$, $-S(O)_p-$, NH o NR^a ;

n es 3, 4, 5 o 6;

cada p es 1 o 2;

Ar es un grupo heterociclilo de C_2-C_{20} o un grupo arilo de C_6-C_{20} , en donde el grupo heterociclilo de C_2-C_{20} o el grupo arilo de C_6-C_{20} está opcionalmente sustituido con 1 a 5 R^6 ;

X es $-C(R^{13})(R^{14})-$, $-N(CH_2R^{14})-$ o X está ausente;

Y es N o CR^7 ;

cada R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 o R^8 es independientemente H, oxo, OR^{11} , $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3 , CN, NO_2 , SR^{11} , $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halógeno, alquilo de (C_1-C_8) , alquenilo de (C_2-C_8) , alquinilo de (C_2-C_8) , aril-alquilo de (C_1-C_8) , arilo de C_6-C_{20} , heterociclilo de C_2-C_{20} , cicloalquilo de (C_3-C_7) o carbociclilalquilo de (C_4-C_8) ;

dos R^4 en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un enlace doble entre los dos carbonos a los que están unidos o pueden formar un anillo cicloalquilo de (C_3-C_7) , en donde un átomo de

carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_P-, -NH- o -NR^a-;

cuatro R⁴ en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un anillo arilo de C₆ opcionalmente sustituido;

dos R⁴ en el mismo átomo de carbono, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_P-, -NH- o -NR^a-;

dos R⁶ en átomos de carbono adyacentes, cuando se agrupan, pueden formar un anillo cicloalquilo de (C₃-C₇), en donde un átomo de carbono del anillo cicloalquilo de (C₃-C₇) puede reemplazarse opcionalmente por -O-, -S-, -S(O)_P-, -NH- o -NR^a-;

cualquier R⁶ adyacente al grupo carbonilo obligado del Ar, cuando se agrupa con R³, puede formar un enlace o un grupo -(C(R⁵)₂)_m-, en donde m es 1 o 2;

cualquier R⁶ adyacente al grupo carbonilo obligado del Ar, cuando se agrupa con R², puede formar un enlace;

cada R^a es independientemente alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇) o carbociclilalquilo de (C₄-C₈), en donde cualquier alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más OH, NH₂, CO₂H, heterociclilo de C₂-C₂₀, y en donde cualquier aril-alquilo

de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇) o carbociclilalquilo de (C₄-C₈) de R^a está sustituido opcionalmente con uno o más OH, NH₂, CO₂H, heterociclilo de C₂-C₂₀ o alquilo de (C₁-C₈);

cada R¹¹ o R¹² es independientemente H, alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇), carbociclilalquilo de (C₄-C₈), —C(=O)R^a, —S(O)_pR^a o aril-alquilo de (C₁-C₈); o R¹¹ y R¹² agrupados con un nitrógeno al cual ambos están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros, en donde cualquier átomo de carbono del anillo heterocíclico puede reemplazarse opcionalmente con —O—, —S—, —S(O)_p—, —NH—, —NR^a— o —C(O)—;

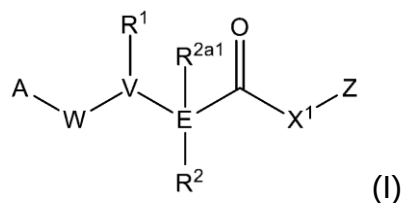
R¹³ es H o alquilo de (C₁-C₈);

R¹⁴ es H, alquilo de (C₁-C₈), NR¹¹R¹², NR¹¹C(O)R¹¹, NR¹¹C(O)OR¹¹, NR¹¹C(O)NR¹¹R¹², NR¹¹S(O)_pR^a, —NR¹¹S(O)_p(OR¹¹) o NR¹¹SO_pNR¹¹R¹²; y

en donde opcionalmente cada alquilo de (C₁-C₈), alquenilo de (C₂-C₈), alquinilo de (C₂-C₈), aril-alquilo de (C₁-C₈), arilo de C₆-C₂₀, heterociclilo de C₂-C₂₀, cicloalquilo de (C₃-C₇) o carbociclilalquilo de (C₄-C₈) de cada R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹¹ o R¹² está independientemente sustituido con uno o más oxo, halógeno, hidroxilo, NH₂, CN, N₃, N(R^a)₂, NHR^a, SH, SR^a, S(O)_pR^a, OR^a, alquilo de (C₁-C₈), haloalquilo de (C₁-C₈), —C(O)R^a, —C(O)H, —C(=O)OR^a, —C(=O)OH, —C(=O)N(R^a)₂, —C(=O)NHR^a, —C(=O)NH₂, NHS(O)_pR^a, NR^aS(O)_pR^a, NHC(O)R^a, NR^aC(O)R^a, NHC(O)OR^a, NR^aC(O)OR^a, NR^aC(O)NHR^a, NR^aC(O)N(R^a)₂, NR^aC(O)NH₂, NHC(O)NHR^a, NHC(O)N(R^a)₂, NHC(O)NH₂, =NH, =NOH,

$=\text{NOR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p\text{NHR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p\text{N}(\text{R}^a)_2$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p\text{NH}_2$, $\text{NHS}(\text{O})_p\text{NHR}^a$,
 $\text{NHS}(\text{O})_p\text{N}(\text{R}^a)_2$, $\text{NHS}(\text{O})_p\text{NH}_2$, $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$, $-\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ o R^a .

46. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B21) que tiene la estructura:



en donde:

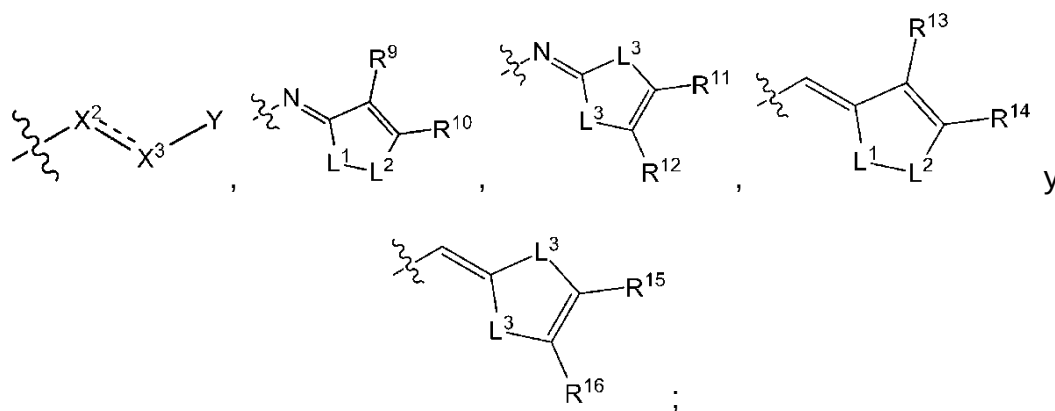
A se selecciona del grupo que consiste en un cicloalquilo opcionalmente sustituido, un cicloalquenilo opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un aril(alquilo de C_{1-2}) opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido y un heterociclilo opcionalmente sustituido;

W es O, S, $\text{C}=\text{O}$, $\text{C}=\text{S}$, NR^{3a3} , $\text{S}=\text{O}$, $\text{S}(=\text{O})_2$ o $-\text{C}(\text{R}^{1a1})(\text{R}^{1a2})-$;

V es N o CH;

E es C o N; siempre que cuando E es N, entonces R^{2a1} está ausente;

Z se selecciona del grupo que consiste en



Y se selecciona del grupo que consiste en un acilalquilo opcionalmente sustituido, un cicloalquilo opcionalmente sustituido, un cicloalqueniilo opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido y un heterociclilo opcionalmente sustituido;

----- entre X^2 y X^3 representa un enlace simple o doble entre X^2 y X^3 ;

en donde, cuando ----- es un enlace doble, entonces X^1 es NR^{3a1} o $CR^{3a2}R^6$, X^2 es N (nitrógeno) o CR^{7a1} , y X^3 es N (nitrógeno) o CR^4 ; y cuando ----- es un enlace simple, entonces X^1 es NR^{3a1} o $CR^{3a2}R^6$, X^2 es O, NR^7 , $C(=O)$ o $C(R^{7a2})(R^{7a3})$, y X^3 es NR^4 , $C(=O)$, CR^4R^8 o $CH_2CH_2C(=O)$; o

cada X^1 , X^2 y X^3 es independientemente C (carbono), N (nitrógeno), O (oxígeno) o $C(=O)$, y forma un anillo monocíclico seleccionado del grupo que consiste en un heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido y un heterociclilo monocíclico opcionalmente sustituido al unir X^1 y X^3 entre sí; y siempre que al menos uno de X^1 , X^2 y X^3 comprenda un átomo de nitrógeno, con la condición de que las valencias de X^1 , X^2 y X^3 se satisfagan con un

sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno y un alquilo de C₁₋₄ opcionalmente sustituido; y X¹, X² y X³ no tengan carga;

L¹ es -C(R¹⁷)₂-, -C(R¹⁸)₂C(R^{18a1})₂-, -C(R^{18a2})=C(R^{18a3})- o -C(R¹⁹)₂N(R^{19a1})-;

L² es -C(R²⁰)₂-, -N(R²¹)-, S u O;

cada L³ es independientemente -C(R²²)₂-, -C(R²³)₂C(R^{23a1})₂- o -C(R^{23a2})=C(R^{23a3})-;

siempre que cuando L¹ sea -C(R¹⁹)₂N(R^{19a1})-, entonces L² sea -C(R²⁰)₂-;

R¹ es hidrógeno o un alquilo de C₁₋₄ no sustituido;

cada R^{1a1} y R^{1a2} es independientemente hidrógeno, hidroxilo o un alquilo de C₁₋₄ no sustituido;

cada R² y R^{2a1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, un alquilo de C₁₋₄ opcionalmente sustituido, alcoxilalquilo, aminoalquilo, hidroxialquilo, hidroxilo, un aril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido, un heteroaril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido y un heterociclil(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido; o

o R¹ y R², junto con los átomos a los que están unidos, se unen para formar un anillo heterocíclico de 5 miembros opcionalmente sustituido o un anillo heterocíclico de 6 miembros opcionalmente sustituido, R^{2a1} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, un alquilo de C₁₋₄ opcionalmente sustituido, alcoxilalquilo, aminoalquilo, hidroxialquilo, hidroxilo, un aril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido, un heteroaril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido y un heterociclil(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido;

cada R^{3a1} , R^{3a2} y R^{3a3} son independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, un alquilo de C_{1-8} opcionalmente sustituido, un alquenilo de C_{2-8} opcionalmente sustituido, un alquinilo de C_{2-8} opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido, un heterociclilo opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C_{3-6} -(alquilo de C_{1-6}) opcionalmente sustituido, un aril(alquilo de C_{1-6}) opcionalmente sustituido, un heteroaril(alquilo de C_{1-6}) opcionalmente sustituido, un heterocicilil(alquilo de C_{1-6}) opcionalmente sustituido, halo(alquilo de C_{1-8}), un hidroxialquilo opcionalmente sustituido, un alcoxialquilo opcionalmente sustituido y ciano;

cada R^6 , R^7 y R^{7a1} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido;

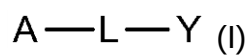
cada R^{7a2} y R^{7a3} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido;

R^8 es hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido;

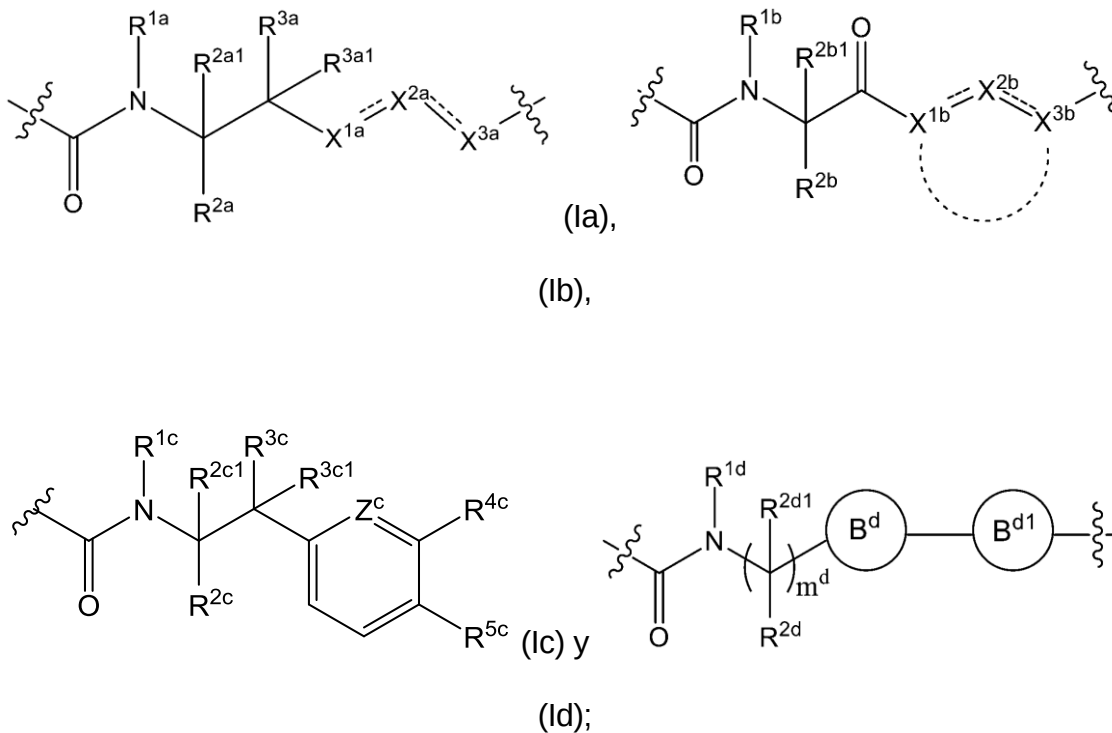
cada R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} y R^{16} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido; o cada R^9 y R^{10} , R^{11} y R^{12} , R^{13} y R^{14} , y R^{15} y R^{16} se agrupa independientemente para formar un cicloalquilo opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido o un heterociclilo opcionalmente sustituido; y

cada R^{17} , cada R^{18} , cada R^{18a1} , R^{18a2} , R^{18a3} , cada R^{19} , R^{19a1} , cada R^{20} , R^{21} , cada R^{22} , cada R^{23} , cada R^{23a1} , R^{23a2} y R^{23a3} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido.

47. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 2, en donde el compuesto (B) es la fórmula (B22) que tiene la estructura:



en donde: L se selecciona del grupo que consiste en:



A se selecciona del grupo que consiste en un cicloalquilo opcionalmente sustituido, un cicloalquenilo opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un aril(alquilo de C₁₋₂) opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido y un heterociclilo opcionalmente sustituido;

Y se selecciona del grupo que consiste en un cicloalquilo opcionalmente sustituido, un cicloalquenilo opcionalmente sustituido, un arilo opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido y un heterociclilo opcionalmente sustituido;

cada R^{1a}, R^{1b}, R^{1c} y R^{1d} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C₁₋₄ no sustituido;

cada R^{2a}, R^{2a1}, R^{2b}, R^{2b1}, R^{2c}, R^{2c1}, R^{2d} y R^{2d1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, un alquilo de C₁₋₄ opcionalmente sustituido, un aril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido, un heterocicli(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido, un alcoxialquilo, aminoalquilo, un hidroxialquilo e hidroxil; o

R^{2a1} es hidrógeno, y R^{1a} y R^{2a} junto con los átomos a los que están unidos forman un heterociclilo de 5 miembros opcionalmente sustituido o un heterociclilo de 6 miembros opcionalmente sustituido, R^{2b1} es hidrógeno, y R^{1b} y R^{2b} junto con los átomos a los que están unidos forman un heterociclilo de 5 miembros opcionalmente sustituido o un heterociclilo de 6 miembros opcionalmente sustituido;

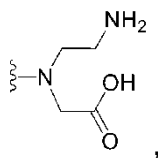
----- entre X^{1a} y X^{2a} representa un enlace simple o doble entre X^{1a} y X^{2a}; ----- entre X^{2a} y X^{3a} representa un enlace simple o doble entre X^{2a} y

X^{3a} ; siempre que ----- entre X^{1a} y X^{2a} y ----- entre X^{2a} y X^{3a} no puedan ser ambos enlaces dobles y al menos uno de ----- sea un enlace doble;

cuando ----- entre X^{1a} y X^{2a} representa un enlace doble y ----- entre X^{2a} y X^{3a} representa un enlace simple, entonces X^{1a} es N o CR^{4a1} , X^{2a} es N o CR^{5a} y X^{3a} es NR^{6a1} , $C(=O)$ o $CR^{6a2}R^{6a3}$; y cuando ----- entre X^{1a} y X^{2a} representa un enlace simple y ----- entre X^{2a} y X^{3a} representa un enlace doble, entonces X^{1a} es NR^{4a} o $CR^{4a2}R^{4a3}$, X^{2a} es N o CR^{5a} y X^{3a} es N o CR^{6a} ; o

cada X^{1a} , X^{2a} y X^{3a} son independientemente C, N, O o $C(=O)$, y forma un anillo o sistema de anillo seleccionado de un arilo opcionalmente sustituido, un heteroarilo opcionalmente sustituido y un heterociclilo opcionalmente sustituido al unir X^{1a} y X^{3a} entre sí; con la condición de que las valencias de X^{1a} , X^{2a} y X^{3a} se satisfacen independientemente con un sustituyente seleccionado de hidrógeno y un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido, y X^{1a} , X^{2a} y X^{3a} no tengan carga;

cada R^{3a} y R^{3a1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, halógeno, amino, un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido, un alquenilo de C_{2-4} opcionalmente sustituido, un alquinilo de C_{2-4} opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido, un alcoxi de C_{1-4} opcionalmente sustituido, -O-carboxi, un heteroarilo opcionalmente sustituido, un heterociclilo opcionalmente sustituido, CHF_2 , CF_3 y



siempre que R^{3a} y R^{3a1} no puedan ser ambos hidrógeno; o R^{3a} y R^{3a1} forman juntos $=N-OR^a$; o R^{3a} y R^{3a1} junto con el átomo al cual están unidos forman un anillo de 3 miembros opcionalmente sustituido, un anillo de 4 miembros opcionalmente sustituido, un anillo de 5 miembros opcionalmente sustituido o un anillo de 6 miembros opcionalmente sustituido;

cada R^{4a} , R^{4a1} , R^{4a2} y R^{4a3} es independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido;

R^{5a} es hidrógeno o un alquilo no sustituido de C_{1-4} ;

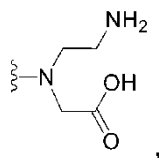
cada R^{6a} y R^{6a1} se selecciona independientemente de hidrógeno, un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido o un alcoxialquilo opcionalmente sustituido;

cada R^{6a2} y R^{6a3} es independientemente hidrógeno o un alquilo no sustituido de C_{1-4} ;

cada X^{1b} , X^{2b} y X^{3b} es independientemente C, N, O o $C(=O)$, y forman un anillo bicíclico seleccionado de un heteroarilo bicíclico opcionalmente sustituido y un heterociclilo bicíclico opcionalmente sustituido al unir X^{1b} y X^{3b} entre sí, en donde ----- entre X^{1b} y X^{2b} representa un enlace simple o doble entre X^{1b} y X^{2b} ; ----- entre X^{2b} y X^{3b} representa un enlace simple o doble entre X^{2b} y X^{3b} ; y siempre que al menos uno de X^{1b} , X^{2b} y X^{3b} comprenda un átomo de nitrógeno

y ambos ----- no puedan ser enlaces dobles; con la condición de que las valencias de X^{1b} , X^{2b} y X^{3b} se satisfacen independientemente con un sustituyente seleccionado de hidrógeno y un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido; y X^{1b} , X^{2b} y X^{3b} no tengan carga;

cada R^{3c} y R^{3c1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, halógeno, amino, un alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido, un alquenilo de C_{2-4} opcionalmente sustituido, un alquinilo de C_{2-4} opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido, un alcoxi de C_{1-4} opcionalmente sustituido, -O-carboxi, un heteroarilo opcionalmente sustituido, un heterociclilo opcionalmente sustituido, CHF_2 , CF_3 y



siempre que R^{3c} y R^{3c1} no puedan ser ambos hidrógeno; o R^{3c} y R^{3c1} forman juntos $=N-OR^c$; o R^{3c} y R^{3c1} junto con el átomo al cual están unidos forman un anillo de 3 miembros opcionalmente sustituido, un anillo de 4 miembros opcionalmente sustituido, un anillo de 5 miembros opcionalmente sustituido o un anillo de 6 miembros opcionalmente sustituido;

cada R^a y R^c son independientemente hidrógeno o un alquilo de C_{1-4} no sustituido;

R^{4c} y R^{5c} se agrupan para formar un arilo no sustituido, un heteroarilo no sustituido o un heterociclilo opcionalmente sustituido;

Z^c es N o CH;

m^d es 0 o 1;

el anillo B^d es un cicloalquilo de C_5 opcionalmente sustituido;

el anillo B^{d1} es un piridinilo opcionalmente sustituido; y

con la condición de que cuando L es la fórmula (IIc), entonces Y está ausente.

48. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-47, en donde la composición farmacéutica comprende un compuesto (B), o una sal farmacéuticamente aceptable de este.

49. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-47, en donde la composición farmacéutica comprende dos del compuesto (B), o una sal farmacéuticamente aceptable de este.

50. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde R^2 es cloro.

51. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde R^2 es azido.

52. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, en donde R^3 es OH.

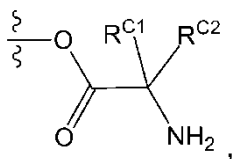
53. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, en donde R^3 es $-OC(=O)R^{A1}$.

54. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 53, en donde R^{A1} es alquilo de C_{1-8} no sustituido.

55. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, en donde R^3 es un aminoácido unido a O opcionalmente sustituido.

56. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 55, en donde el aminoácido unido a O opcionalmente sustituido se selecciona del grupo que consiste en alanina, asparagina, aspartato, cisteína, glutamato, glutamina, glicina, prolina, serina, tirosina, arginina, histidina, isoleucina, leucina, lisina, metionina, fenilalanina, treonina, triptófano, valina, ornitina, hipusina, ácido 2-aminoisobutírico, dehidroalanina, ácido gamma-aminobutírico, citrulina, beta-alanina, alfa-etil-glicina, alfa-propil-glicina y norleucina.

57. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 55, en donde el aminoácido unido a O opcionalmente sustituido tiene la estructura



en donde R^{C1} se selecciona de hidrógeno, un alquilo de C_{1-6} opcionalmente sustituido, un haloalquilo de C_{1-6} opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido, un arilo de C_6 opcionalmente sustituido, un arilo de C_{10} opcionalmente sustituido y un aril(alquilo de C_{1-6}) opcionalmente sustituido; y R^{C2} es hidrógeno o un

alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido; o R^{C1} y R^{C2} se agrupan para formar un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido.

58. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde R^1 es hidrógeno.

59. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde R^1 es un acilo opcionalmente sustituido.

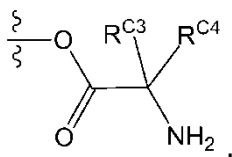
60. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 59, en donde el acilo opcionalmente sustituido es $-C(=O)R^{B1}$, en donde R^{B1} es un alquilo de C_{1-24} opcionalmente sustituido o un cicloalquilo de C_{3-6} opcionalmente sustituido.

61. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 60, en donde R^{B1} es un alquilo de C_{1-8} no sustituido.

62. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde R^1 es un aminoácido unido a O opcionalmente sustituido.

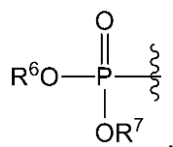
63. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 62, en donde el aminoácido unido a O opcionalmente sustituido se selecciona del grupo que consiste en alanina, asparagina, aspartato, cisteína, glutamato, glutamina, glicina, prolina, serina, tirosina, arginina, histidina, isoleucina, leucina, lisina, metionina, fenilalanina, treonina, triptófano, valina, ornitina, hipusina, ácido 2-aminoisobutírico, dehidroalanina, ácido gamma-aminobutírico, citrulina, beta-alanina, alfa-etil-glicina, alfa-propil-glicina y norleucina.

64. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 62, en donde el aminoácido unido a O opcionalmente sustituido tiene la estructura



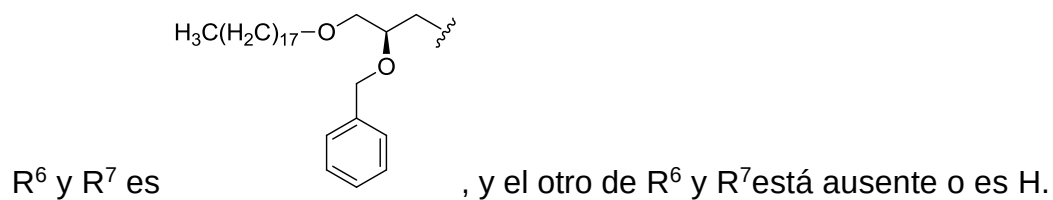
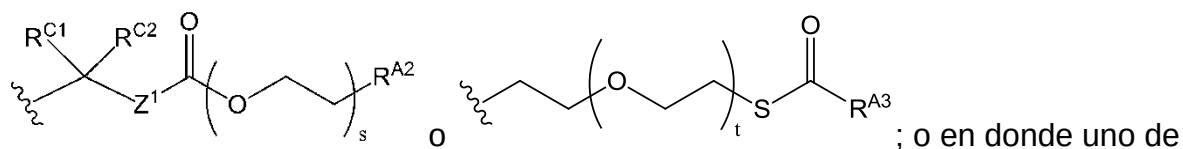
en donde R^{C3} se selecciona de hidrógeno, un alquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido, un haloalquilo de C₁₋₆ opcionalmente sustituido, un cicloalquilo de C₃₋₆ opcionalmente sustituido, un arilo de C₆ opcionalmente sustituido, un arilo de C₁₀ opcionalmente sustituido y un aril(alquilo de C₁₋₆) opcionalmente sustituido; y R^{C4} es hidrógeno o un alquilo de C₁₋₄ opcionalmente sustituido; o R^{C3} y R^{C4} se agrupan para formar un cicloalquilo de C₃₋₆ opcionalmente sustituido.

65. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde R¹ es

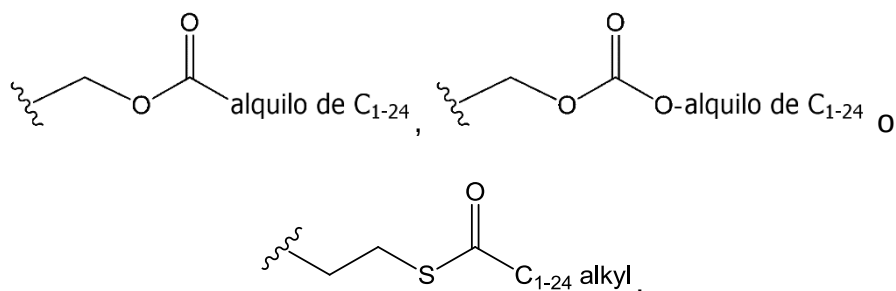


66. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 65, en donde R⁶ y R⁷ están independientemente ausentes o son H.

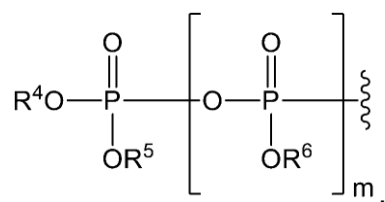
67. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 65, en donde R^6 y R^7 son independientemente



68. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 65, en donde R^6 y R^7 son independientemente



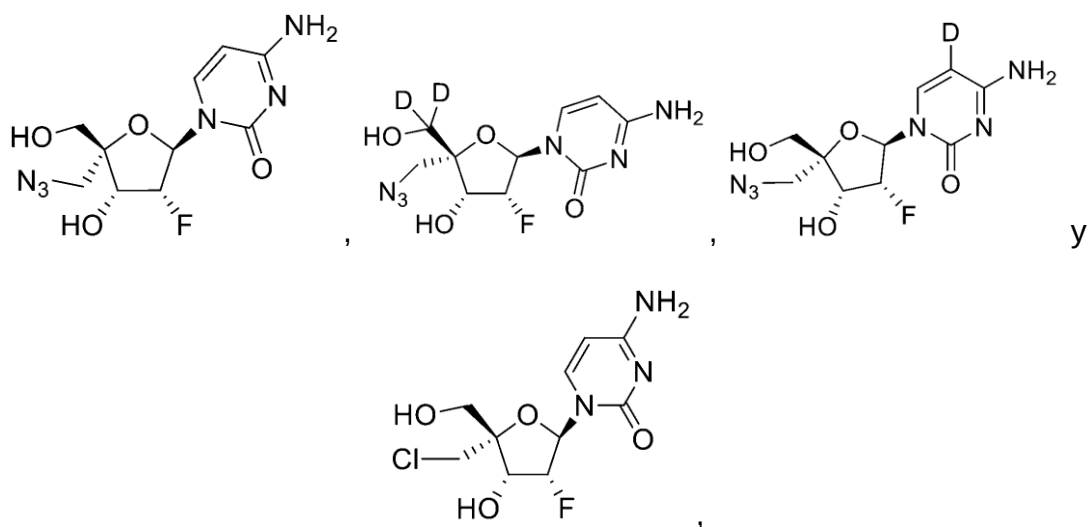
69. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde R^1 es



70. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 69, en donde m es 1.

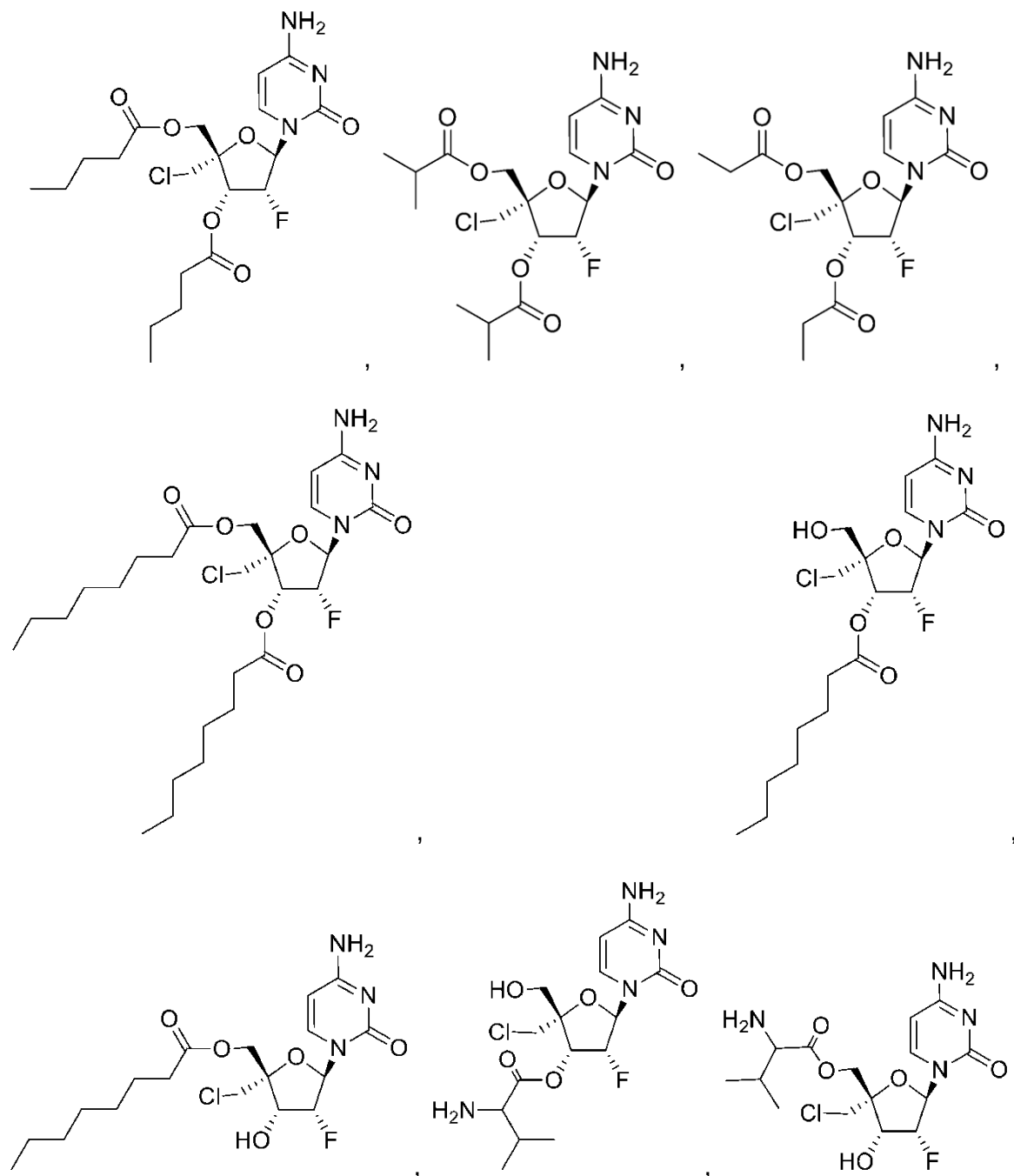
71. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 69, en donde m es 2.

72. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde el compuesto (A) se selecciona del grupo que consiste en:



o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

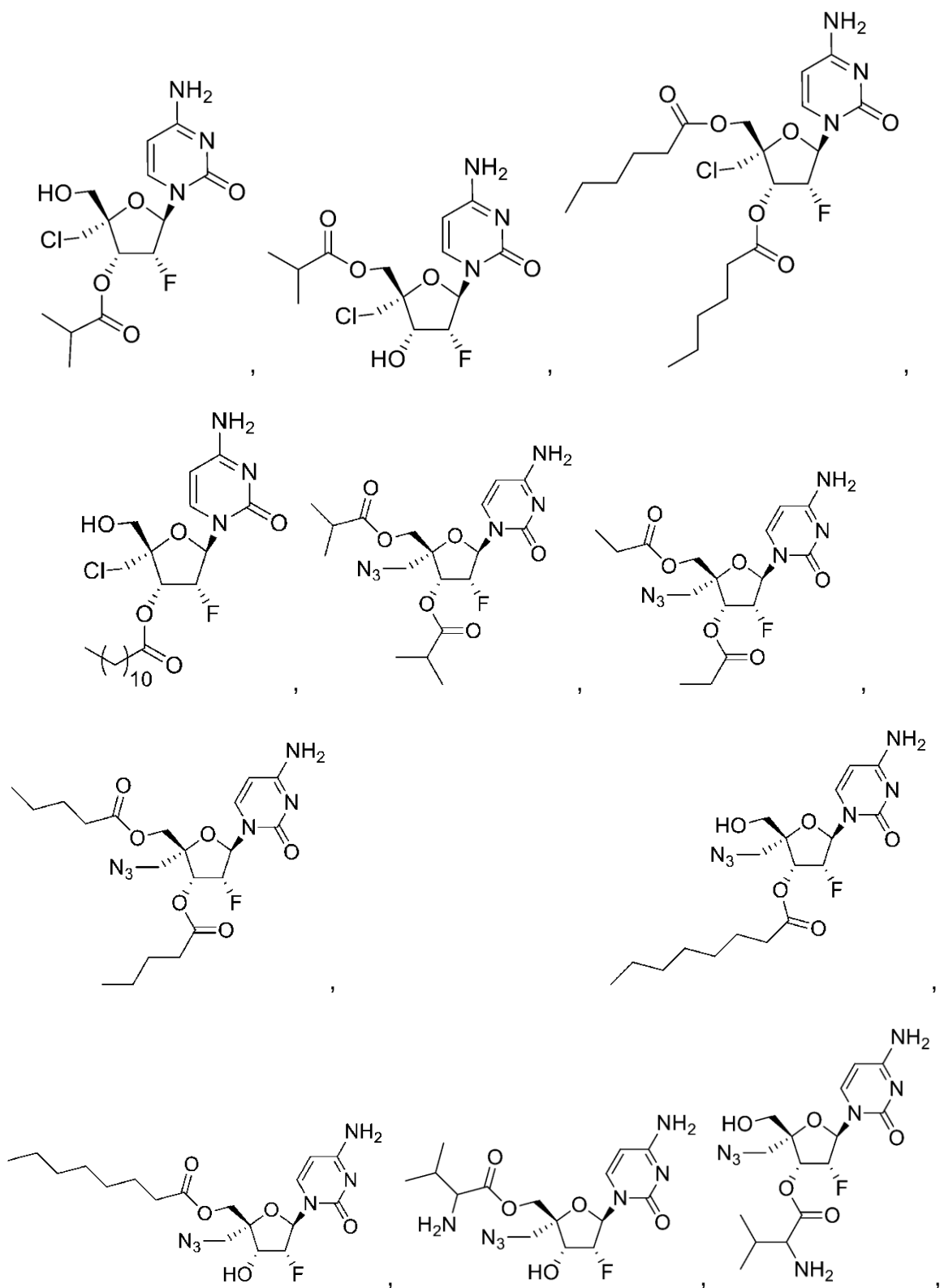
73. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde el compuesto (A) se selecciona del grupo que consiste en:

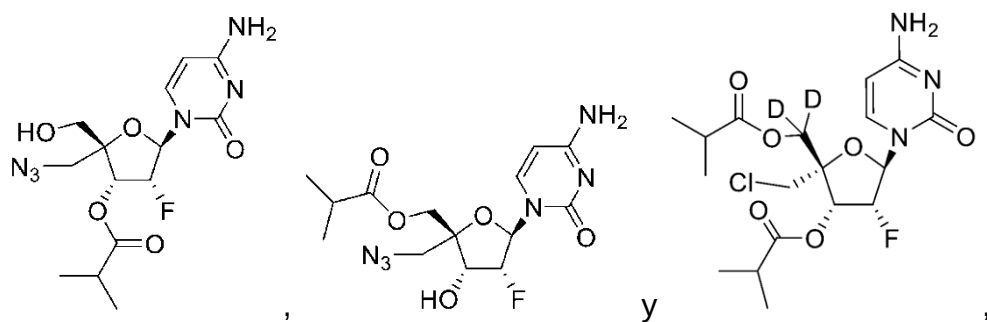


P-12968

Nuevo capítulo reivindicatorio

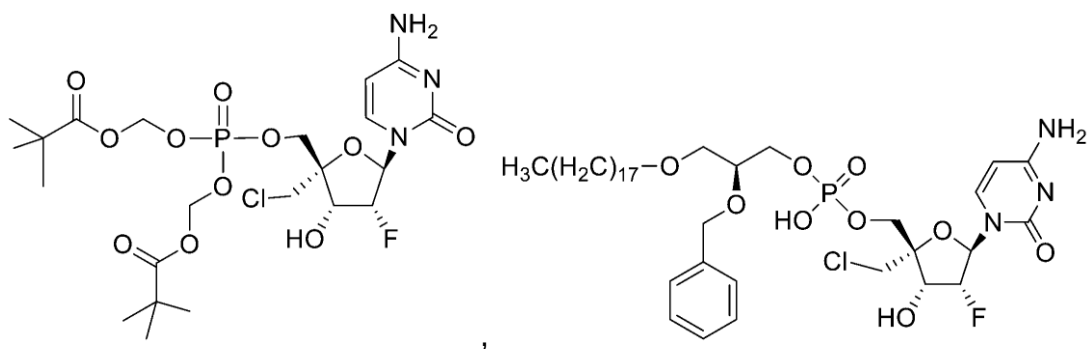
Mayo 9, 2017

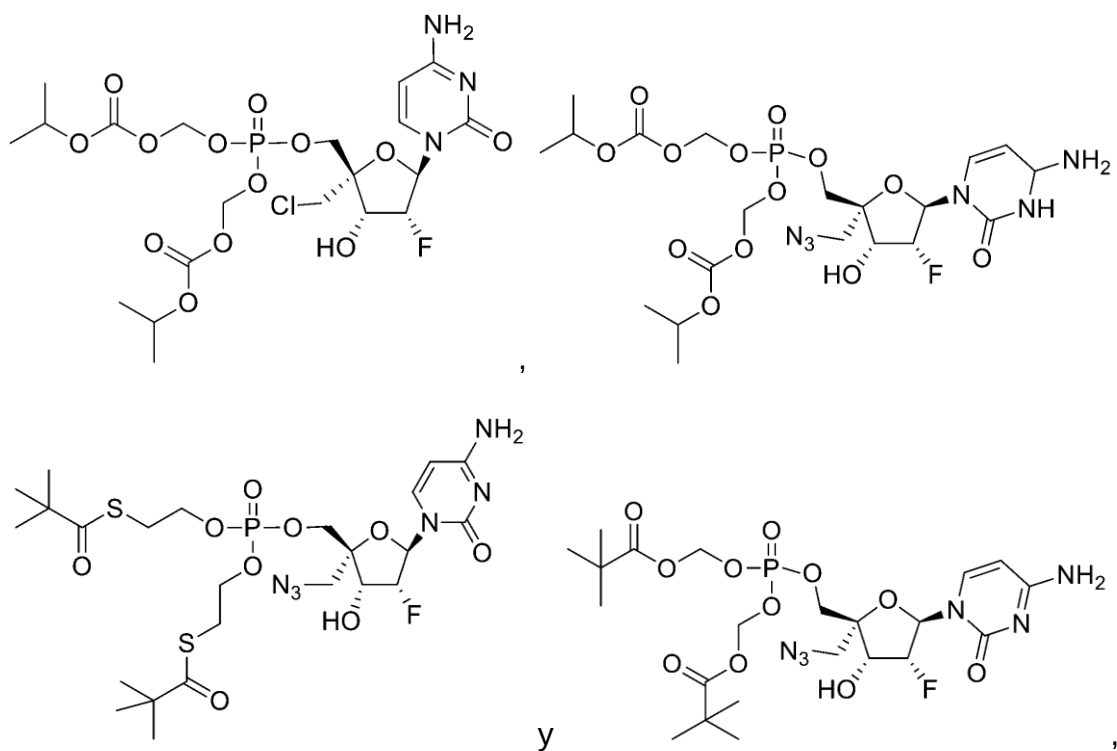




o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

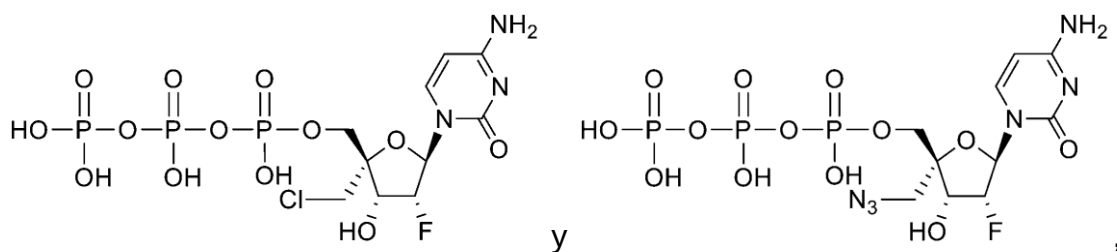
74. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde el compuesto (A) se selecciona del grupo que consiste en:





o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

75. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, en donde el compuesto (A) se selecciona del grupo que consiste en:



o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.