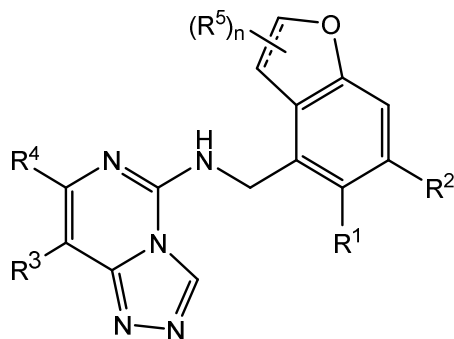


# REIVINDICACIONES:

1. Un compuesto de la Fórmula (I):



(I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

5        === es un enlace sencillo o un enlace doble;

$R^1$  y  $R^2$  son independientemente H o hologeno;

$R^3$  se selecciona independientemente de: halógeno, fenilo, y un heteroarilo de 5 a 6 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados entre N,  $NR^a$ , O, y  $S(O)_p$ ; en el que dichos fenilo y heteroarilo son sustituidos por 0-3  $R^{3A}$ ;

10        cada  $R^{3A}$  se selecciona independientemente de: halógeno, CN,  $-(O)_m$ -(alquilo  $C_1$  -  $C_6$  sustituido por 0-1  $R^{3B}$ ), haloalquilo  $C_1$  - $C_6$ , haloalcoxilo  $C_1$  - $C_6$ ,  $R^{3C}$ ,  $-OR^{3C}$ ,  $-C(=O)R^{3D}$ ,  $NR^{3E}R^{3F}$ ,  $-C(=O)NR^{3E}R^{3F}$ ,  $-NHC(=O)R^{3D}$ ,  $-S(=O)_2R^{3D}$ ,  $-S(=O)_2NR^{3E}R^{3F}$ ,  $-NHS(=O)_2$ (alquilo  $C_1$  - $C_4$ ), y  $-CR^{3C}R^{3E}R^{3G}$ ;

15         $R^{3B}$  se selecciona independientemente de: OH,  $NR^eR^f$ , alcoxilo  $C_1$ - $C_4$ ,  $-C(=O)NR^eR^f$ ,

$-S(=O)_2$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $-NHC(=O)$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ), y un heterocicloalquilo de 5 a 6 miembros que comprende átomos de carbono y 1-2 heteroátomos seleccionados entre N,  $NR^a$ , O, y  $S(O)_p$ ; en el que dicho heterocicloalquilo es sustituido por 0-2  $R^c$ ;

20        cada  $R^{3C}$  se selecciona independientemente de: cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ , fenilo, y un heterociclo de 4 a 7 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados de N,  $NR^a$ , O, y  $S(O)_p$ ; en donde cada fracción es sustituida por 0-2  $R^c$ ;

cada  $R^{3D}$  se selecciona independientemente de: alquilo  $C_1$ - $C_4$  y  $R^{3C}$ ;

$R^{3E}$  y  $R^{3G}$  son, en cada caso, independientemente seleccionados de: H y alquilo  $C_1$  - $C_4$ ;

cada  $R^{3F}$  se selecciona independientemente de: H y alquilo  $C_1-C_4$  sustituido por 0-1  $R^d$ ;

$R^4$  se selecciona independientemente de: H, halógeno y alquilo  $C_1-C_4$ ;

$R^5$  se selecciona independientemente de OH y alquilo ( $C_1-C_4$ );

5 cada  $R^a$  se selecciona independientemente de: H,  $\rightarrow$ alquilo O,  $C_1-C_4$  sustituido por 0-1  $R^b$ ,  $-C(=O)H$ ,  $-C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_4)$ ,  $-CO_2(\text{alquilo } C_1-C_4)$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , y bencilo;

$R^b$  se selecciona independientemente de: halogano, OH y alcoxilo ( $C_1-C_4$ );

10 cada  $R^c$  se selecciona independientemente de:  $=O$ , halógeno, OH, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , y haloalcoxilo  $C_1-C_4$ ;

$R^d$  se selecciona independientemente de: OH y  $NR^eR^f$ ;

$R^e$  y  $R^f$  son, en cada caso, independientemente seleccionados de: H y alquilo  $C_1 - C_4$ ;

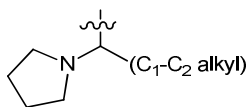
cada p es independientemente seleccionada de 0, 1 y 2; y

15 m y n son, en cada ocurrencia, independientemente seleccionados de 0 y 1.

2. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en donde:

20 cada  $R^{3A}$  se selecciona independientemente de: halógeno, CN,  $-(O)_m$ -(alquilo  $C_1-C_4$  sustituido por 0-1  $R^{3B}$ ), haloalquilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ ,  $R^{3C}$ ,  $-C(=O)R^{3D}$ ,  $NR^{3E}R^{3F}$ ,

$-C(=O)NR^{3E}R^{3F}$ ,  $-S(=O)_2R^{3D}$ ,  $-S(=O)_2NHR^{3F}$ ,  $-NHS(=O)_2(\text{alquilo } C_1-C_4)$ ,



cicloalquilo  $-O-C_3-C_6$ , y ;

25  $R^a$  se selecciona independientemente de: H,  $\rightarrow$ O, alquilo  $C_1-C_4$  sustituido por 0-1  $R^b$ ,  $-C(=O)H$ ,  $-C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_4)$ ,  $-CO_2(\text{alquilo } C_1-C_4)$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , y bencilo;

$R^4$  es H;

m es independientemente seleccionada de 0 y 1; y

n es 0.

3. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las reivindicaciones 1 o 2 , en donde:

$R^1$  es independientemente H o F;

$R^2$  es H; y

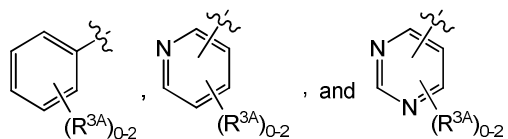
5  $R^3$  se selecciona independientemente de: fenilo, y un heteroarilo de 6 miembros que comprende átomos de carbono y 1-2 heteroátomos seleccionados entre N y  $NR^a$ ; en donde dichos fenilo y heteroarilo son sustituidos por 0 -3  $R^{3A}$ ;

4. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las  
10 reivindicaciones 1 a 3 , en donde:

$R^3$  se selecciona independientemente de: fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo y pirazinilo; en donde cada fracción es sustituido por 0-3  $R^{3A}$ .

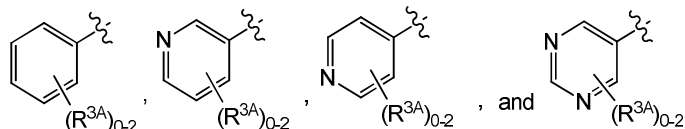
5. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las  
15 reivindicaciones 1 a 4 , en donde:

$R^3$  se selecciona independientemente de:



6. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las reivindicaciones 1 a 4 , en donde:

$R^3$  se selecciona independientemente de:



20

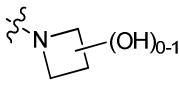
cada  $R^{3A}$  se selecciona independientemente de: halógeno, CN,  $-(O)_m$ -(alquilo  $C_1$ -

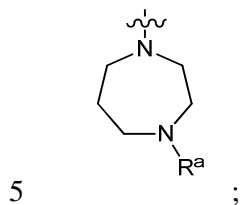
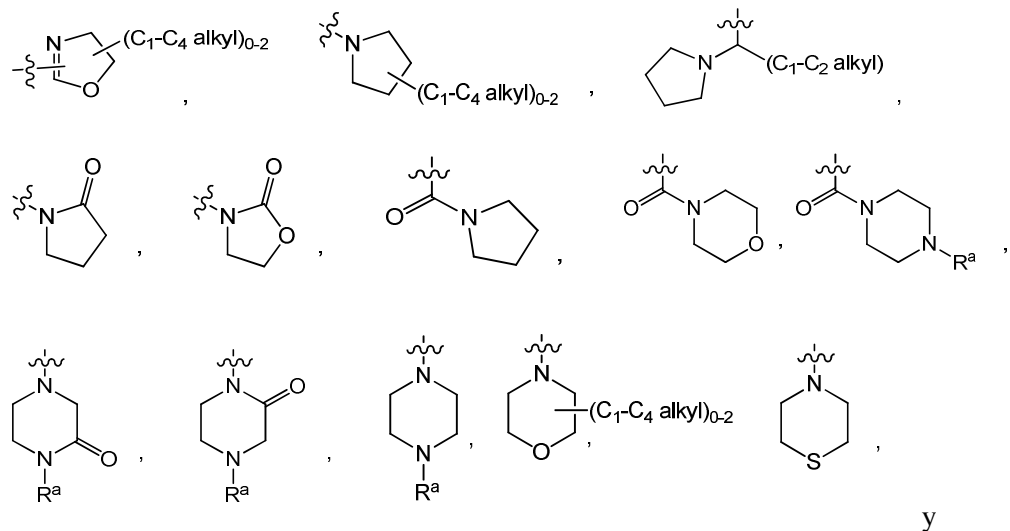
$C_4$  sustituido por 0-1  $R^{3B}$ ), haloalquilo  $C_1$ - $C_4$ , haloalcoxilo  $C_1$ - $C_4$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,

$-C(=O)NH$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $-C(=O)N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )<sub>2</sub>,  $-C(=O)N$ (alquilo  $C_1$ -

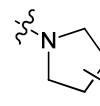
$C_4$ )( $CH_2$ )<sub>2</sub> $N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )<sub>2</sub>,  $-CH_2NHC(=O)$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $-S(=O)_2R^{3D}$ , -

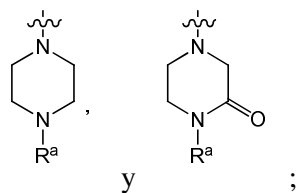
25  $S(=O)_2NH$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$  sustituido con 0-1 OH),  $-NHS(=O)_2$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $NH_2$ , -

NH(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -N(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)<sub>2</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, ,



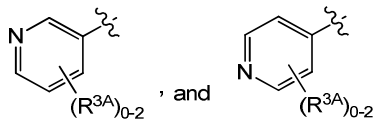
R<sup>3B</sup> se selecciona independientemente de: OH, NH<sub>2</sub>, NH(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), N(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)<sub>2</sub>,

alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, -C(=O)N(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), ,



10 R<sup>3D</sup> se selecciona independientemente de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y 1H-piperidin-4-ilo; y  
cada R<sup>a</sup> se selecciona independientemente de: H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, -C(=O)H,  
-C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y -CO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

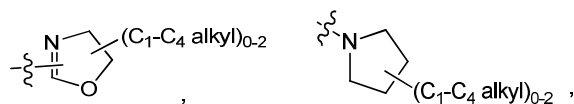
7. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las reivindicaciones 1 a 6 , en donde:



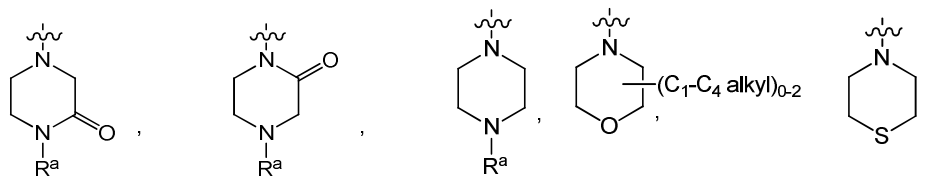
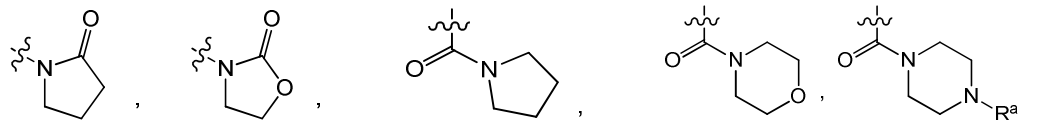
$R^3$  se selecciona independientemente de:

- 5 cada  $R^{3A}$  se selecciona independientemente de: halógeno, CN,  $-(O)_m$ -(alquilo  $C_1$ - $C_4$  sustituido por 0-1  $R^{3B}$ ), haloalquilo  $C_1$ - $C_4$ , haloalcoxilo  $C_1$ - $C_4$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-C(=O)NH$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $-C(=O)N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )<sub>2</sub>,  $-C(=O)N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )( $CH_2$ )<sub>2</sub> $N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )<sub>2</sub>,  $-CH_2NHC(=O)$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $-S(=O)_2$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $NH_2$ ,

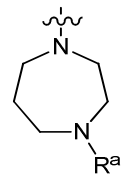
$NH$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ ),  $N$ (alquilo  $C_1$ - $C_4$ )<sub>2</sub>, cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ ,



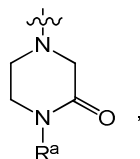
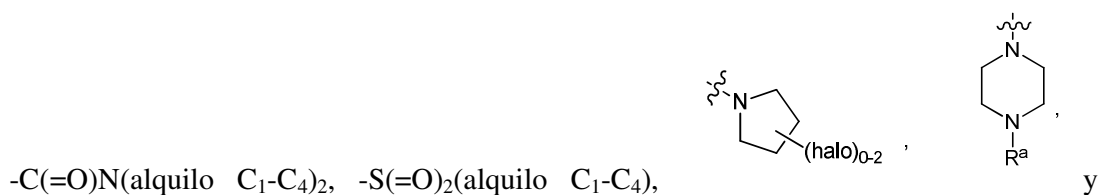
10



y



$R^{3B}$  se selecciona independientemente de: OH, N(alquilo  $C_1-C_4$ )<sub>2</sub>, alcoxilo  $C_1-C_4$ ,

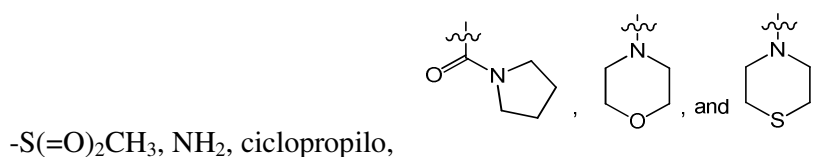


; y

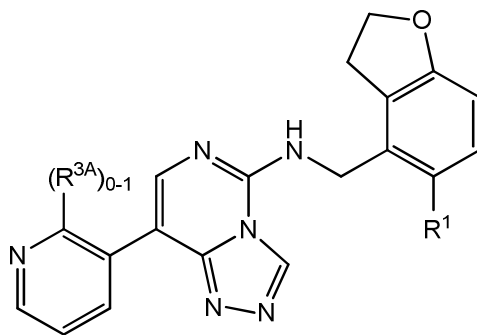
cada  $R^a$  se selecciona independientemente de: H, alquilo  $C_1-C_4$ , -C(=O)H,  
 5 -C(=O)(alquilo  $C_1-C_4$ ), y -CO<sub>2</sub>(alquilo  $C_1-C_4$ ).

8. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las reivindicaciones 1 a 7 , en donde:

cada  $R^{3A}$  se selecciona independientemente de: F, Cl, CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>,  
 10 CF<sub>3</sub>, CN, -OCH<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -OCHF<sub>2</sub>, -C(=O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>NHC(=O)CH<sub>3</sub>,



9. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según  
 15 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 , en donde dicho compuesto es de la Fórmula (IA-1):



(IA-1)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

$R^1$  es independientemente H o F; y

$R^{3A}$  se selecciona independientemente de: F,  $CH_3$ ,  $-CH_2OH$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $CF_3$ , y  $-OCH_3$ .

5 10. Un compuesto según las reivindicaciones 1 ó 2, en donde

$R^1$  es independientemente H o F;

$R^2$  es H;

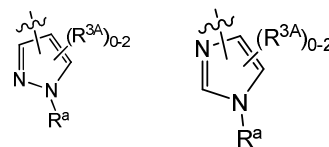
$R^3$  se independientemente un heteroarilo de 5 miembros que comprende átomos de carbono y 1-4 heteroátomos seleccionados entre N,  $NR^a$ , O, y  $S(O)_p$ ; en donde dicho

10 heteroarilo es sustituido por 0-3  $R^{3A}$ ; y

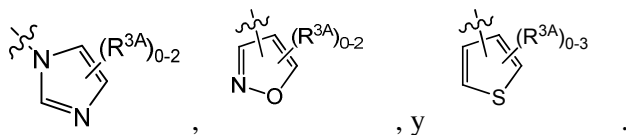
$R^a$  se selecciona independientemente de: H, alquilo  $C_1$ - $C_4$  sustituido por 0-1  $R^b$ ,  $-C(=O)H$ ,  $-C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_4)$ ,  $-CO_2(\text{alquilo } C_1-C_4)$ , cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ , y bencilo.

11. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las  
15 reivindicaciones 1, 2 ó 10, en donde:

$R^3$  se selecciona independientemente de:



, ,

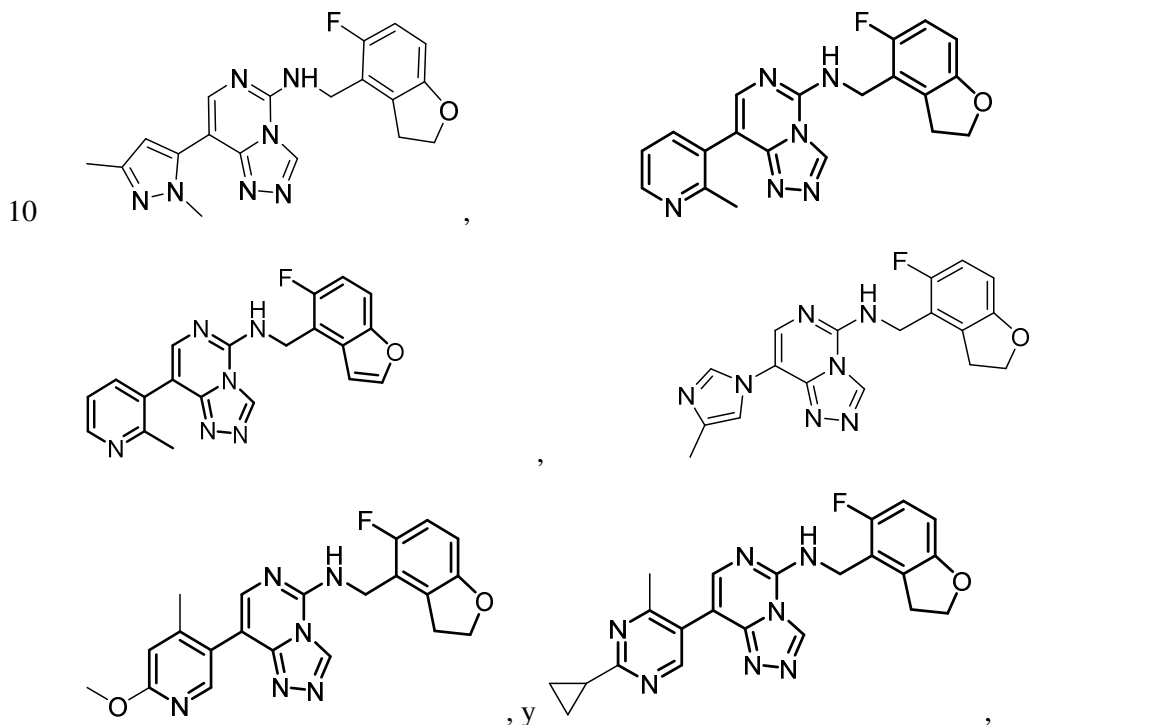


12. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según las reivindicaciones 1 a 11, en donde:

$R^1$  es F.

5 13. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en donde dicho compuesto se selecciona de los Ejemplos 1 a 245.

14. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto se selecciona a partir de



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15 15. Una composición farmacéutica, que comprende uno o más vehículos farmacéuticamente aceptables y un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14.

16. La composición farmacéutica de la Reivindicación 15 que además comprende al  
20 menos un agente farmacéutico adicional.

17. La composición farmacéutica de la reivindicación 16, donde al menos dicho agente terapéutico adicional se selecciona de otros agentes anti-cáncer, inmunomoduladores, agentes anti-alérgicos, anti-eméticos, analgésicos, agentes citoprotectores, y combinaciones de los mismos.

5

18. Un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de reivindicaciones 1 a 14, para uso en terapia.

19. El uso de un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, en la elaboración de un medicamento para tratar una enfermedad o trastorno mediado por EED y/o PRC2.

20. El uso de la reivindicación 19 en donde dicha enfermedad o trastorno es seleccionado entre linfoma difuso de células B grandes, linfoma folicular, otros linfomas, leucemia, mieloma múltiple, mesotelioma, cáncer gástrico, tumor rabdoide maligno, carcinoma hepatocelular, cáncer de próstata, carcinoma de mama, cánceres del conducto biliar y vesícula biliar, carcinoma de vejiga, tumores cerebrales, incluyendo neuroblastoma, schwannoma, glioma, glioblastoma y astrocitoma, cáncer cervical, cáncer de colon, melanoma, cáncer de endometrio, cáncer de esófago, cáncer de cabeza y cuello, cáncer de pulmón, carcinoma nasofaríngeo, cáncer de ovario, cáncer de páncreas, carcinoma de células renales, cáncer rectal, cáncer de tiroides, tumores paratiroides, tumores uterinos, y sarcomas de tejidos blandos.

25