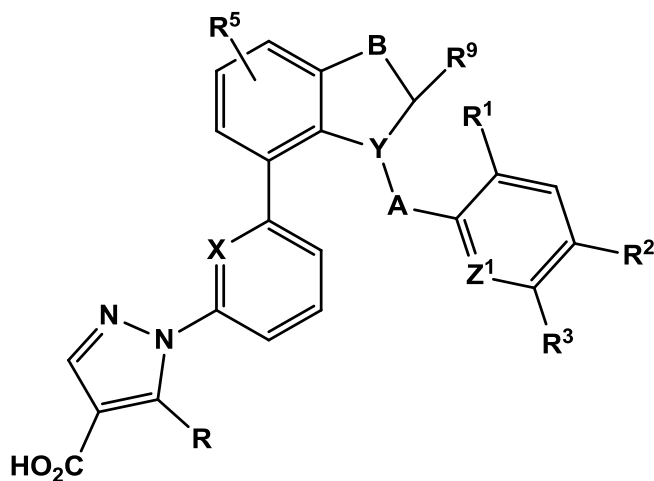


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto según la fórmula (I)



(I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

X es N o CH ;

Y es CH o N ;

A es CH_2 , O o N(H) cuando Y es CH , o

A es CH_2 , cuando Y es N ,

B es O o CR^7R^8 ;

Z^1 es CR^4 o N ;

R es hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, monofluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo;

R^1 es hidrógeno, halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o trifluorometilo;

R^2 es piperidinilo que es N -sustituido por alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, C(O) -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, S(O)_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, C(O) -cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, C(O) -haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, C(O) -alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, C(O) -alquenoxilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, heteroarilo o CO(O)_2 bencilo, en donde cada cicloalquilo es opcionalmente sustituido por hidroxilo y cada alquilo o alcoxilo es opcionalmente sustituido por hidroxilo, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o

cicloalquilo C₃-C₆ y en donde cada heteroarilo tiene 5 o 6 átomos en el anillo, 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S y están opcionalmente sustituidos por 1 o 2 sustituyentes de alquilo C₁-C₄;

R³ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁-C₄; o

R² y R³, tomados en combinación, forman un anillo azacíclico saturado fusionado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido por bencilo o heteroarilmetilo de 5 o 6 miembros, tal heteroarilo tiene 1 o 2 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S;

R⁴ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

R₅ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

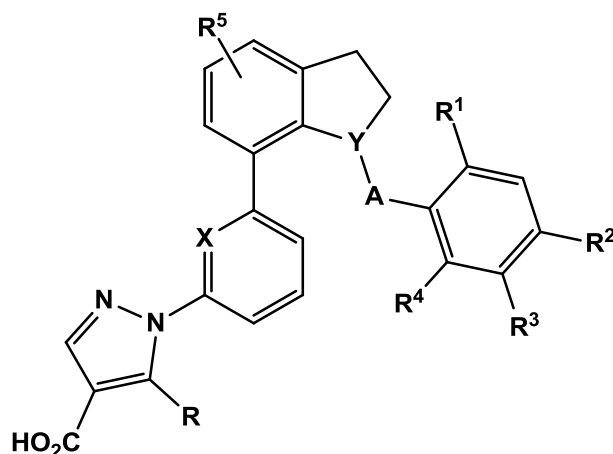
R⁷ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄; o

R⁷ y R⁹, tomados en combinación con los átomos en el anillo a los que están unidos, forman un enlace doble carbono-carbono;

R⁸ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄; y

R⁹ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄.

2. Un compuesto según la fórmula (Ia)



(Ia)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

X es N o CH;

Y es CH o N;

A es CH₂, O o N(H) cuando Y es CH, o

A es CH₂, cuando Y es N;

R es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o trifluorometilo;

R¹ es hidrógeno, halógeno o alquilo C₁-C₄;

R² es piperidinilo que es N-sustituido por alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)-alquilo C₁-C₄, C(O)-cicloalquilo C₃-C₆, C(O)-haloalquilo C₁-C₄ o C(O)-alcoxilo C₁-C₄;

R³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄; o

R² y R³, tomados en combinación, forman un anillo azacíclico saturado fusionado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido por bencilo o heteroarilmetilo de 5 o 6 miembros, tal heteroarilo tiene 1 o 2 heteroátomos en el anillo seleccionados independientemente a partir de N, O y S;

R⁴ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y

R₅ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆.

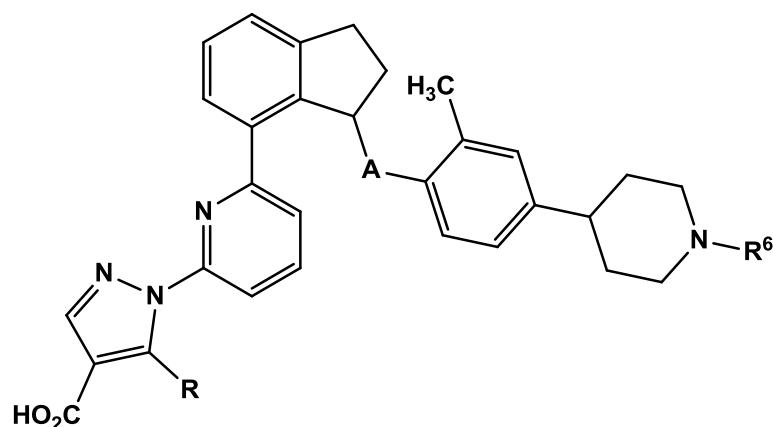
3. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 2 en donde Y es CH y A es N(H).

4. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, en donde R² es piperidin-4-ilo N-sustituido en donde el N-sustituyente es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)-ciclopropilo o C(O) alquiloC₁-C₄.

5. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, en donde R¹ es metilo; y R³ y R⁴ son hidrógeno.

6. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en donde R es metilo o etilo.

7. El compuesto de la Reivindicación 1 o 2, en donde el compuesto es un compuesto de la fórmula (II):



(II)

en donde

A es O, CH₂ o NH;

R es metilo, etilo o trifluorometilo;

R⁶ es 2,2,2-trifluoroetilo, C(O)-ciclopropilo o C(O)-alquilo C₁-C₄.

8. El compuesto de la Reivindicación 1, que es ácido 1-(6-(3-(4-(1-(ciclopropanocarbonil)piperidin-4-il)-2-metilfenil)amino)-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-2-il)-5-metil-1H-pirazol-4-carboxílico.

9. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8, o una sal del mismo, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

10. Una composición farmacéutica oftálmica que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
