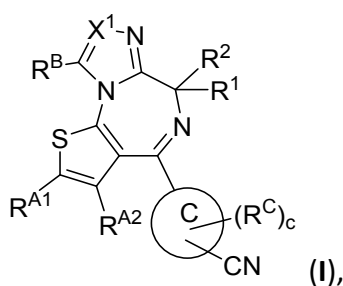


## CAPÍTULO REIVINDICATORIO

1. Un compuesto de fórmula (I):



o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R<sup>A1</sup> es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alqueno opcionalmente sustituido, alquino opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, -OR<sup>f</sup>, -SR<sup>f</sup>, -N(R<sup>f</sup>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub> o -CN;

$R^{A2}$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenoil opcionalmente sustituido, alquínico opcionalmente sustituido, carbocíclico opcionalmente sustituido, heterocíclico opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido,  $-OR^f$ ,  $-SR^f$ ,  $-N(R^f)_2$ ,  $-NO_2$  o  $-CN$ ;

$X^1$  es N o  $CR^5$ , en donde  $R^5$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido,  $-OR^f$ ,  $-SR^f$ ,  $-N(R^f)_2$ ,  $-NO_2$  o  $-CN$ ;

R<sup>B</sup> es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbocicilo opcionalmente sustituido, heterocicilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, -OR<sup>f</sup>, -SR<sup>f</sup>, -N(R<sup>f</sup>)<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub> o -CN;

el anillo C es arilo o heteroarilo;

cada aparición de R<sup>C</sup> es independientemente halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo

opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, sulfonilo opcionalmente sustituido,  $-OR^f$ ,  $-SR^f$ ,  $-N(R^f)_2$ ,  $-NO_2$  o  $-CN$ ;

c es 0, 1, 2, 3 o 4;

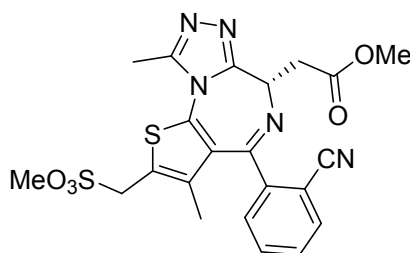
$R^1$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido o  $-(CH_2)_nL$ , en donde n es 0, 1, 2, 3 o 4 y L es  $-C(=O)R^3$ ,  $-C(=O)OR^3$ ,  $-C(=O)NR^3R^4$ ,  $-S(=O)_2R^3$ ,  $-S(=O)_2OR^3$ ,  $-S(=O)_2NR^3R^4$ ,  $-OR^3$ ,  $-NR^3R^4$ ,  $-N(R^4)C(=O)R^3$ , carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido;

$R^2$  es hidrógeno, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido;

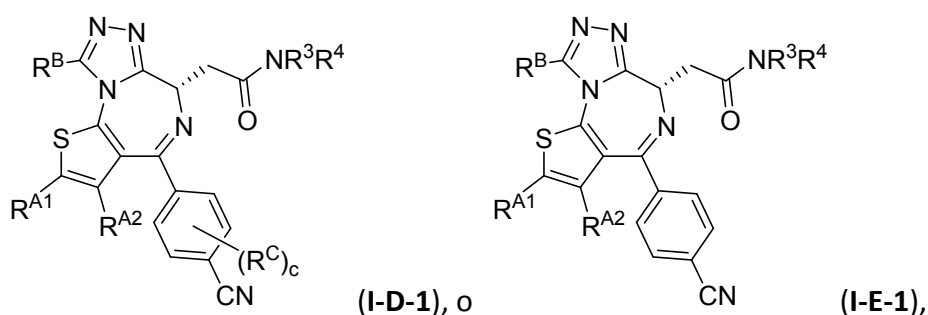
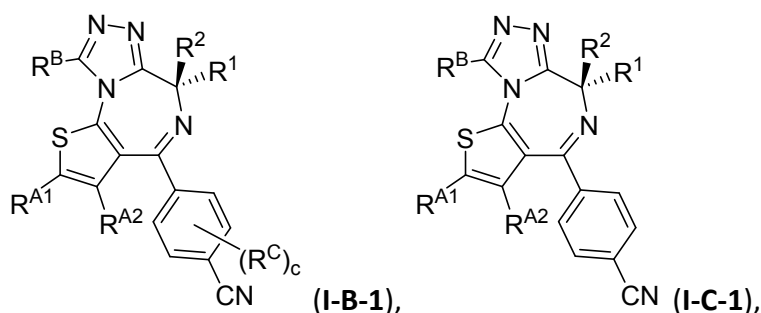
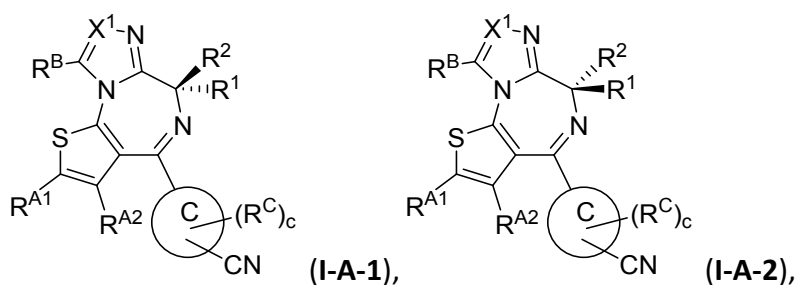
cada uno de  $R^3$  y  $R^4$  es independientemente hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o acilo opcionalmente sustituido, un grupo protector de oxígeno o un grupo protector de nitrógeno o  $R^3$  y  $R^4$  se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y

cada aparición de  $R^f$  es independientemente, hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, sulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo protector de oxígeno o un grupo protector de nitrógeno o dos  $R^f$  se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido;

a condición de que el compuesto no sea:

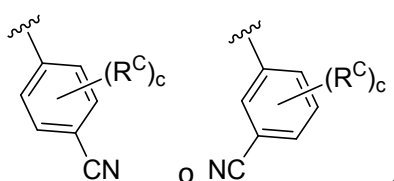


2. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto es de fórmula (I-A-1) (I-A-2), (I-B-1), (I-C-1), (I-D-1), o (I-E-1):



o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. El compuesto de la Reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo C es de fórmula:



4. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde los dos  $R^{A1}$  y  $R^{A2}$  son hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido.

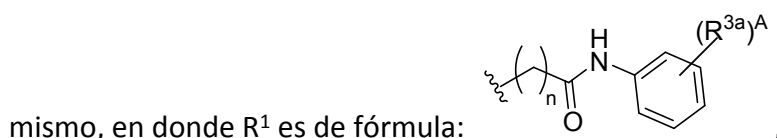
5. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^1$  es  $-(CH_2)_nC(=O)OR^3$ ,  $-(CH_2)_nS(=O)_2R^3$ , o  $-(CH_2)_nNR^3R^4$ , o  $-(CH_2)_nC(=O)NR^3R^4$ , en donde n es 0, 1, 2, 3 o 4.

6. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^1$  es  $-(CH_2)_nL$ , y L es carbociclilo

opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, y n es 0, 1, 2, 3 o 4.

7. El compuesto de la Reivindicación 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido o arilo opcionalmente sustituido.

8. El compuesto de la Reivindicación 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del



R<sup>3a</sup> es halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, -OR<sup>f</sup>, -SR<sup>f</sup>, -N(R<sup>g</sup>)<sub>2</sub> o -NO<sub>2</sub>;

R<sup>g</sup> es alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o grupo protector de nitrógeno; y

A es 0, 1, 2, 3, 4 o 5.

9. El compuesto de la Reivindicación 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub> sin sustituir o alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan entre el grupo que consiste en halógeno, hidroxilo y heterociclilo opcionalmente sustituido.

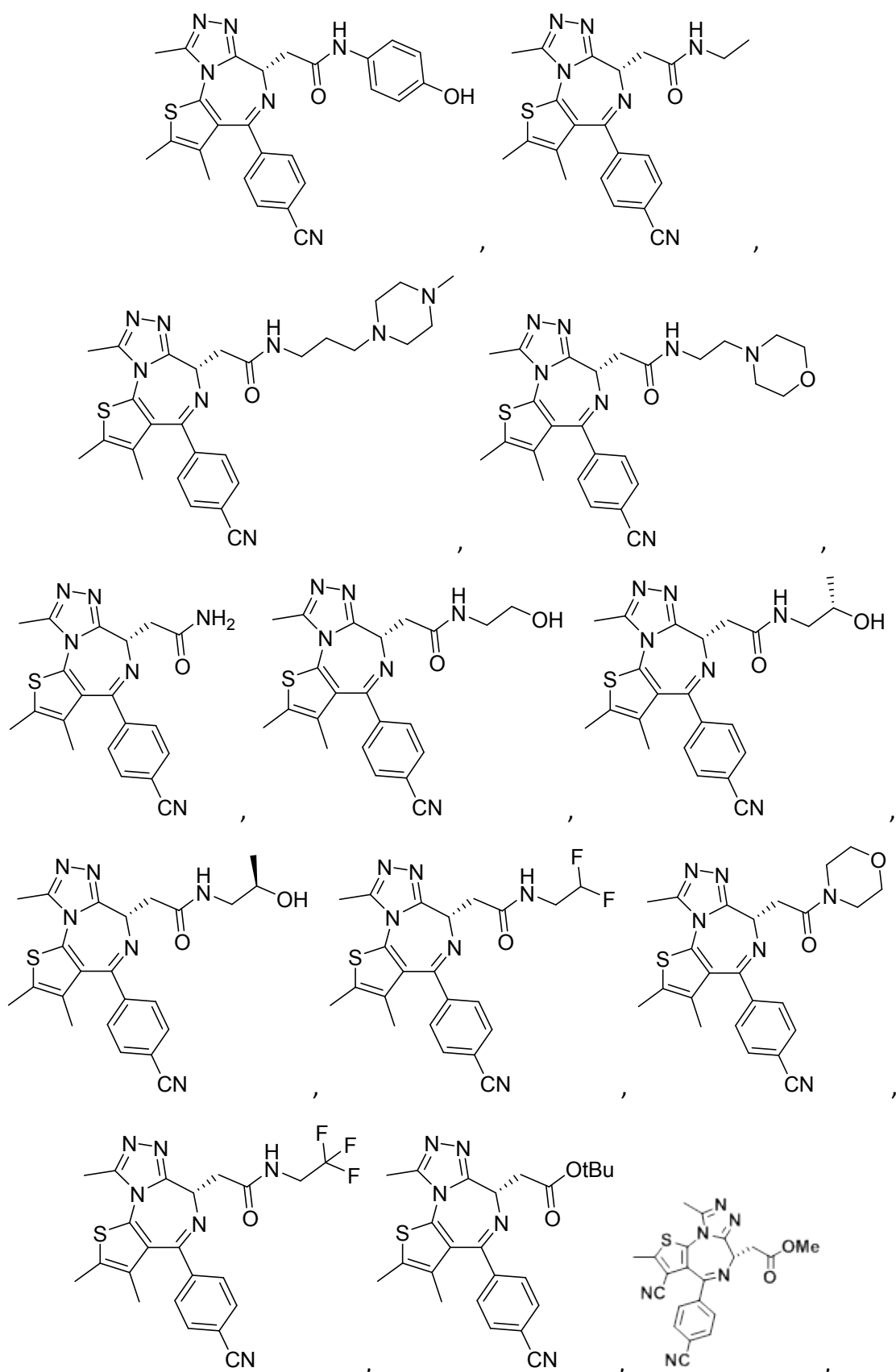
10. El compuesto de la Reivindicación 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido.

11. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>1</sup> es:



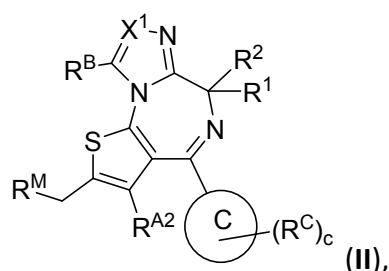
14. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6 u 8 a 13 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>B</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido.

15. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto es de fórmula:



o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

16. Un compuesto de fórmula (II):



o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

$R^M$  es  $-\text{CN}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^f)_2$  o  $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^f)_2$ ;

$R^{A2}$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido,  $-\text{OR}^f$ ,  $-\text{SR}^f$ ,  $-\text{N}(\text{R}^f)_2$ ,  $-\text{NO}_2$  o  $-\text{CN}$ ;

$X^1$  es N o  $\text{CR}^5$ , en donde  $\text{R}^5$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido,  $-\text{OR}^f$ ,  $-\text{SR}^f$ ,  $-\text{N}(\text{R}^f)_2$ ,  $-\text{NO}_2$  o  $-\text{CN}$ ;

$\text{R}^B$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido,  $-\text{OR}^f$ ,  $-\text{SR}^f$ ,  $-\text{N}(\text{R}^f)_2$ ,  $-\text{NO}_2$  o  $-\text{CN}$ ;

el anillo C es arilo o heteroarilo;

cada aparición de  $\text{R}^C$  es independientemente halógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, sulfonilo opcionalmente sustituido,  $-\text{OR}^f$ ,  $-\text{SR}^f$ ,  $-\text{N}(\text{R}^f)_2$ ,  $-\text{NO}_2$  o  $-\text{CN}$ ;

c es 0, 1, 2, 3 o 4;

$\text{R}^1$  es hidrógeno, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido o  $-(\text{CH}_2)_n\text{L}$ , en donde n es 0, 1, 2, 3 o 4 y L es  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^3$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^3$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OR}^3$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^3\text{R}^4$ ,  $-\text{OR}^3$ ,  $-\text{NR}^3\text{R}^4$ ,  $-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(=\text{O})\text{R}^3$ , carbociclilo opcionalmente sustituido,

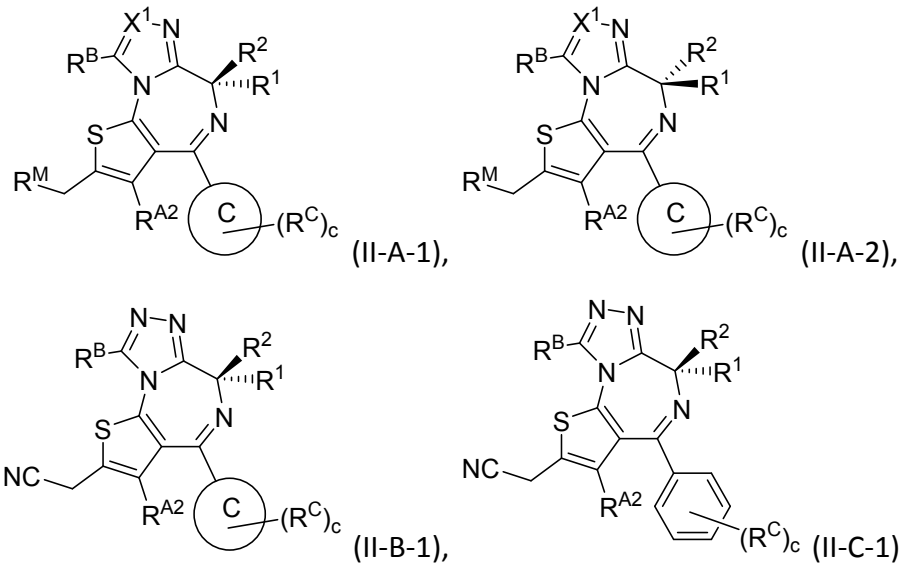
heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido;

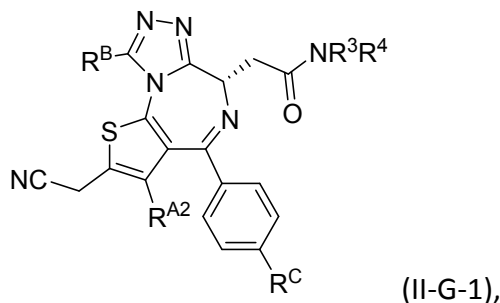
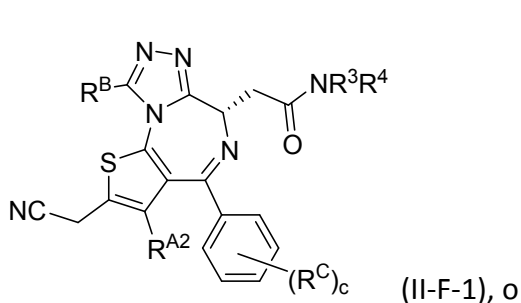
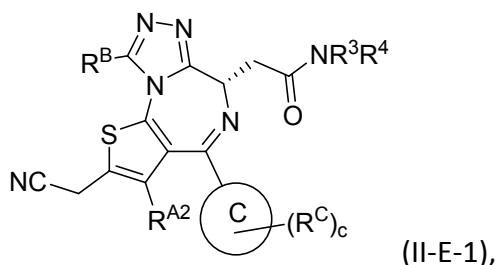
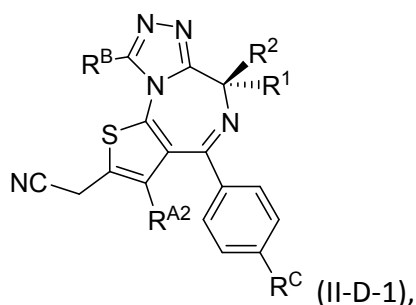
R<sup>2</sup> es hidrógeno, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido;

cada uno de R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido o acilo opcionalmente sustituido, un grupo protector de oxígeno o un grupo protector de nitrógeno o R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; y

cada aparición de R<sup>f</sup> es independientemente, hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, acilo opcionalmente sustituido, sulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo protector de oxígeno o un grupo protector de nitrógeno o dos R<sup>f</sup> se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

17. El compuesto de la Reivindicación 16, en donde el compuesto es de fórmula (II-A-1), (II-A-2), (II-B-1), (II-C-1), (II-D-1), (II-E-1), (II-F-1), o (II-G-1):



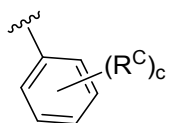


o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

18. El compuesto de la Reivindicación 16 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^M$  es  $-\text{CN}$ ,  $-\text{NHR}^f$  y  $R^f$  es hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$  sin sustituir, sulfonilo o un grupo protector de nitrógeno.

19. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 18 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^{A2}$  es hidrógeno o alquilo  $\text{C}_{1-6}$  opcionalmente sustituido.

20. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 19 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo C es de fórmula:

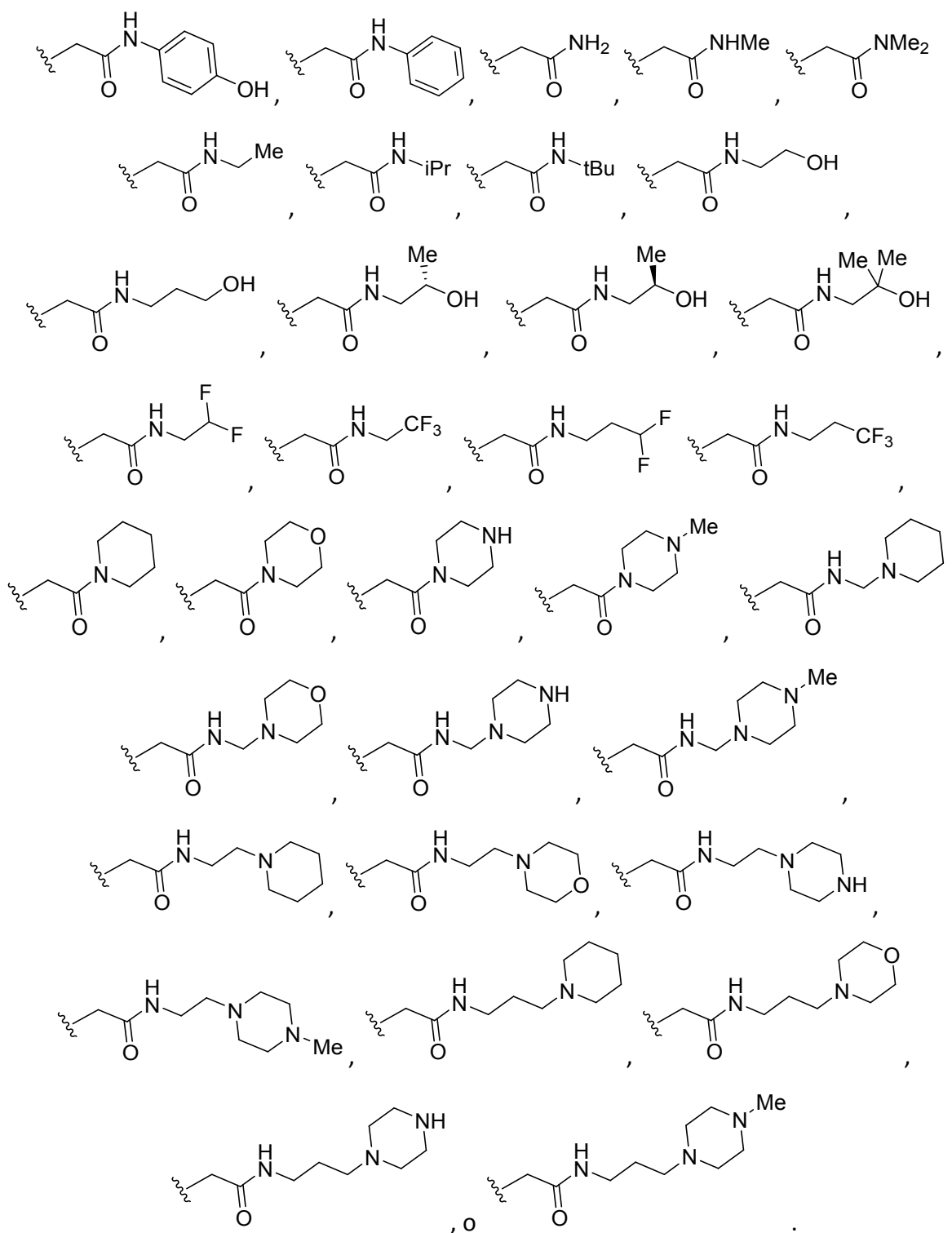


21. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^1$  es  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(=\text{O})\text{OR}^3$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^3$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^3\text{R}^4$ ,  $-(\text{CH}_2)_n\text{L}$ , y L es carbociclilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido o  $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ , en donde n es 0, 1, 2, 3, o 4.

22. El compuesto de la Reivindicación 21 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^3$  es hidrógeno y  $R^4$  es alquilo  $\text{C}_{1-6}$  opcionalmente sustituido o arilo opcionalmente sustituido.

23. El compuesto de la Reivindicación 21 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^3$  y  $R^4$  se unen para formar un anillo heterocíclico opcionalmente sustituido.

24. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde  $R^1$  es:

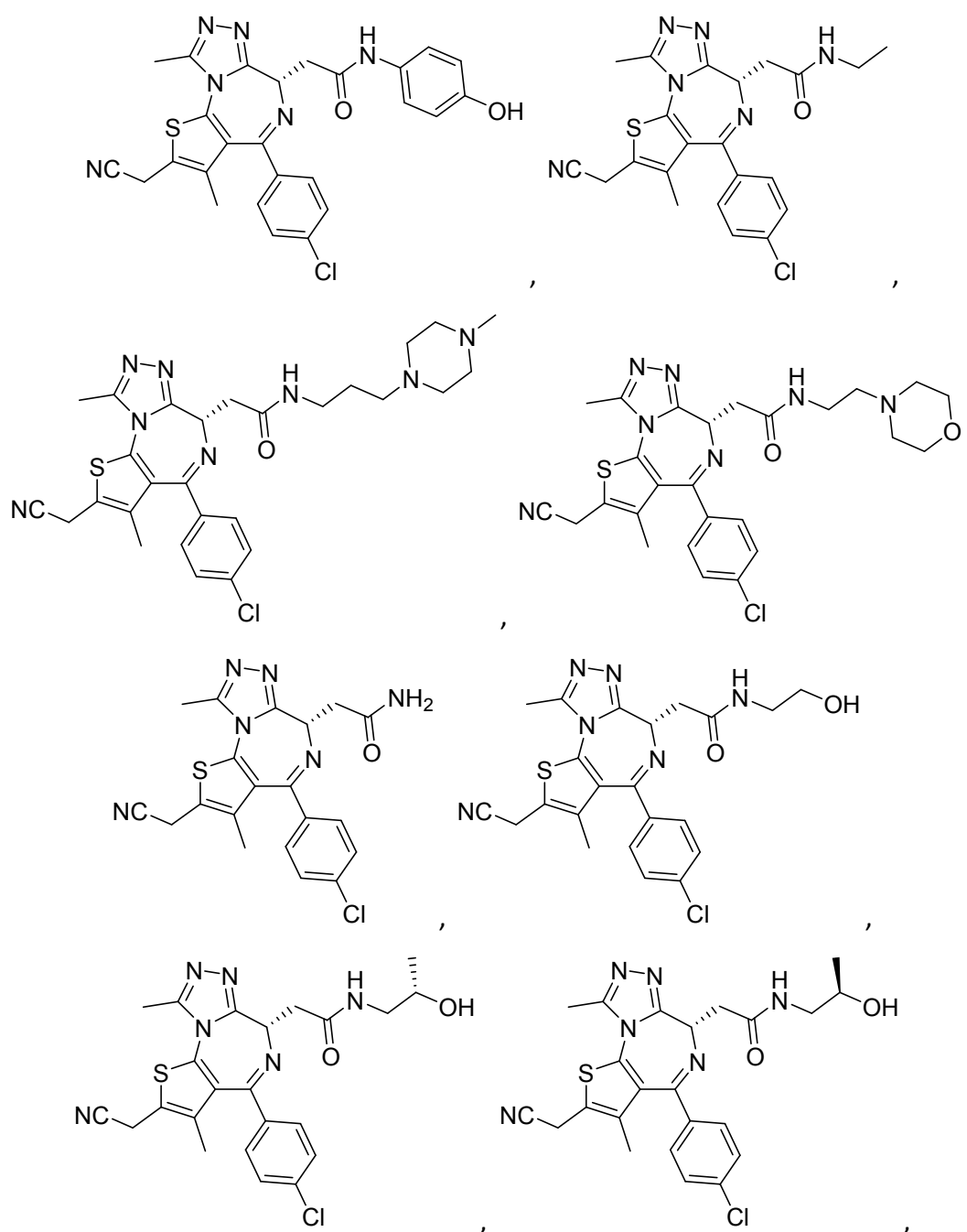


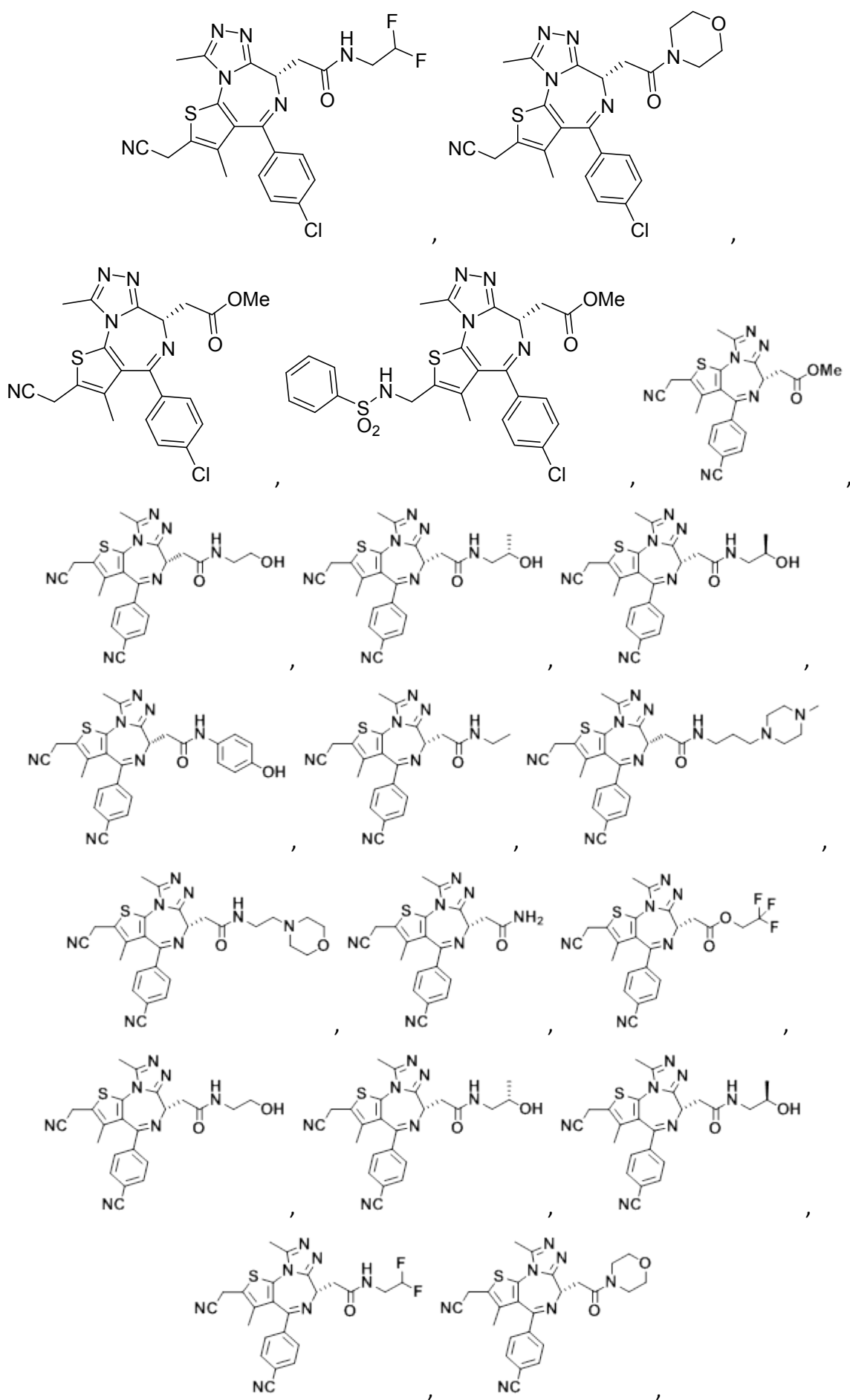
25. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 24 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>2</sup> es hidrógeno.

26. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 25 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde X<sup>1</sup> es N.

27. El compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 16 a 26 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R<sup>B</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido.

28. El compuesto de la Reivindicación 16, en donde el compuesto es de fórmula:





o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo.

29. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1, o 17-28 o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

30. Un kit que comprende un recipiente, un compuesto de una cualquiera de las Reivindicaciones 1, o 17-28 o una sal, estereoisómero o tautómero farmacéuticamente aceptable del mismo o una composición farmacéutica de la Reivindicación 29 e instrucciones para administrar el compuesto o la composición a un sujeto.

SCO\SCO\ID-563090\WPC17908