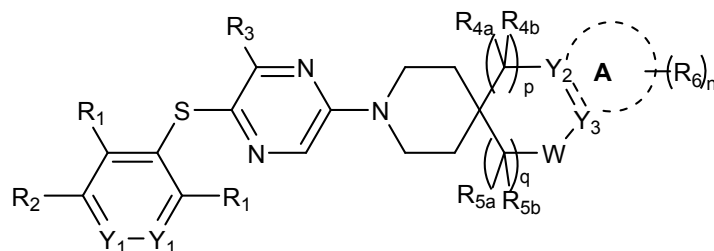


## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la Fórmula I o sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



I

caracterizado porque,

Cada  $R_1$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

$R_2$  es -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ ,  $-N_3$ , carboxilo, -NH alquilo  $C_{1-6}$ , -N(alquilo  $C_{1-6}$ )<sub>2</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -CONH alquilo  $C_{1-6}$ , -CON(alquilo  $C_{1-6}$ )<sub>2</sub>, -CO alquilo  $C_{1-6}$ , -NHCO alquilo  $C_{1-6}$ , -N alquilo  $C_{1-6}$ -CO-alquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido o heterocíclico- $C_{5-10}$ ; o

$R_2$  se combina con  $R_1$  al cual está adyacente para formar un arilo de 6-10 miembros, anillo de heteroarilo de 5-10 miembros o heterocíclico de 5-10 miembros, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

Cada  $Y_1$  es independientemente N o  $CR_{1a}$ ;

Cada  $R_{1a}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

$R_3$  es -H o  $-NH_2$ ;

Cada uno de  $R_{4a}$  y  $R_{4b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido; o

$R_{4a}$  y  $R_{4b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman CO, C=NH, o C=N-OH; p es 0, 1, 2 o 3;

Cada uno de  $R_{5a}$  y  $R_{5b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$ , o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido; o

$R_{5a}$  y  $R_{5b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman un heteroarilo heterocíclico de 3-10 miembros o 5-10 miembros o C=NR<sub>5c</sub>, y  $R_{5c}$  es -H, o alquilo- $C_{1-6}$ ; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

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

W está ausente, -O, -S o -NR<sub>w</sub>; y  $R_w$  es -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, -CO-alquilo  $C_{1-6}$ , -CO-alquilo OC<sub>1-6</sub>, alquilo- $C_{1-6}$ -O-alcoxi  $C_{1-6}$ , alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

El anillo A está ausente o un anillo de 3-10 miembros;

== representa un enlace individual o un enlace doble;

Cuando el anillo A está ausente,  $Y_2$  es  $CR_{2a}R_{2b}$ ,  $NR_{2a}$  u O, e  $Y_3$  es  $CR_{3a}R_{3b}$ ,  $NR_{3a}$  u O;

Cuando el anillo A es un anillo de 3-1 miembros,

i)  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  o N, e  $Y_3$  es  $CR_{3a}$  o N, cuando  $\equiv$  representa un enlace individual; o

ii)  $Y_2$  es C, e  $Y_3$  es C, cuando  $\equiv$  representa un enlace doble;

5 Cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

Cada uno de  $R_{3a}$  y  $R_{3b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

10 Cada  $R_6$  es independientemente -H, halógeno,  $-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , oxo,  $=O$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$ , alquilo- $C_{1-6}$ , alquilenio- $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilenio- $C_{1-6}-O$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alquilenio- $C_{1-6}-CO-OR_{6a}$ , alquilenio- $C_{1-6}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ , alquilenio- $C_{1-6}$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ , alquilenio- $C_{1-6}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilenio- $C_{1-6}-NR_{6a}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilenio- $C_{1-6}-NR_{6a}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CO-CO-NR_{6a}R_{6b}$ , carboxídico- $C_{3-10}$ , heterocíclico- $C_{3-10}$ ,  $-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alquilenio- $CO-C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CO-NR_{6a}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-CO-NR_{6a}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-CO$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-O$ -alquilenio  $C_{1-6}-CO-OR_{6a}$ ,  $-O$ -alquilenio  $C_{1-6}-CO-$   
 15  $NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-O$ -alquilenio  $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-O$ -carbocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-O$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-NR_{6a}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-NR_{6a}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-NR_{6a}-CO$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilenio  $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilenio  $C_{1-6}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilenio  $C_{1-6}$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ ,  $-NR_{6a}-SO_2$  alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SONR_{6a}R_{6b}$ ,  $-SO_2NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-SO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SO_2$  alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-PO$ (alquilo  $C_{1-6})_2$ ,  $-PO$ (alcoxi  $C_{1-6})_2$ , heterocíclico  $-C_{3-10}$  o heteroarilo- $C_{5-10}$ ; cada uno de los cuales está de manera independiente  
 20 opcionalmente sustituido; y n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; o

Dos de  $R_6$  adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un anillo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heterocíclico- $C_{3-6}$  o carbocíclico- $C_{3-6}$ , en donde cada uno del sistema de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

25 Cada uno de  $R_{6a}$  y  $R_{6b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6a}$ , o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido.

2. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque:

Cada  $R_1$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo  $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

30  $R_2$  es -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ ,  $-N_3$ , carboxilo,  $-NH$  alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-N$ (alquilo  $C_{1-6})_2$ ,  $-CONH_2$ ,  $-CONH$  alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-CON$ (alquilo  $C_{1-6})_2$ ,  $-CO$  alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-NH-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-N$  alquilo  $C_{1-6}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, alquilo  $-C_{1-6}$  sustituido o no sustituido o heterocíclico- $C_{5-10}$ ; o

35  $R_2$  se combina con  $R_1$  al cual está adyacente para formar un anillo de heteroarilo de 5-10 miembros o heterocíclico de 5-10 miembros, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

Cada  $Y_1$  es independientemente N o  $CR_{1a}$ ;

Cada  $R_{1a}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$

sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido;

R<sub>3</sub> es -H o -NH<sub>2</sub>;

Cada uno de R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> es independientemente -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

5 R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman CO;

p es 0, 1, 2 o 3;

Cada uno de R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> es independientemente -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

10 R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman un heteroarilo heterocíclico de 3-10 miembros o 5-10 miembros; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

q es 1, 2, 3 o 4;

W está ausente, O, NR<sub>w</sub> o S;

15 R<sub>w</sub> es -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, -CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-alquilo OC<sub>1-6</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido ;

El anillo A está ausente o un anillo de 3-10 miembros;

=== representa un enlace individual o doble;

Cuando el anillo A está ausente, Y<sub>2</sub> es -CR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>, -NR<sub>2a</sub> o -O, y Y<sub>3</sub> es -CR<sub>3a</sub>R<sub>3b</sub>, -NR<sub>3a</sub> u O;

Cuando el anillo A es un anillo de 3-1 miembros,

20 i) Y<sub>2</sub> es CR<sub>2a</sub> o N, e Y<sub>3</sub> es CR<sub>3a</sub> o N, cuando === representa un enlace individual; o

ii) Y<sub>2</sub> es C, e Y<sub>3</sub> es C, cuando === representa un enlace doble;

Cada uno de R<sub>2a</sub> y R<sub>2b</sub> es independientemente -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido;

25 Cada uno de R<sub>3a</sub> y R<sub>3b</sub> es independientemente -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido;

30 Cada R<sub>6</sub> es independientemente -H, halógeno, -NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, oxo, =O, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub>, alquilo-C<sub>1-6</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-O-alquilo C<sub>1-6</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-alquilenio C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, -CO-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, -O-alquilenio C<sub>1-6</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, alquilenio-O-C<sub>1-6</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -O-alquilenio C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -O-carbocíclico C<sub>3-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenio C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenio C<sub>1-6</sub>-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenio C<sub>1-6</sub>-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, -S-alquilo C<sub>1-6</sub>, -SONR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -SO<sub>2</sub>NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -SO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -SO<sub>2</sub>alquilo C<sub>1-6</sub>, -PO(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>, heterocíclico-C<sub>3-10</sub> o heteroarilo-C<sub>5-10</sub>, en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido; y n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; o

Dos de R<sub>6</sub> adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heterocíclico-C<sub>3-6</sub> o carbocíclico-C<sub>3-6</sub>, en donde

cada uno del sistema de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido;

Cada uno de R<sub>6a</sub> y R<sub>6b</sub> es independientemente -H, halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido.

3. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con las reivindicaciones 1o 2, caracterizado porque cada R<sub>1</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-6</sub>; alcoxi-C<sub>1-6</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o -C<sub>1-3</sub>alkoxi; o alcoxi -C<sub>1-6</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

4. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-3, en donde cada R<sub>1</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

5. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-4, caracterizado porque cada R<sub>1</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o alcoxi C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

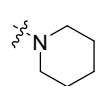
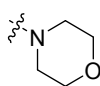
6. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-4, caracterizado porque cada R<sub>1</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; o metilo sustituido con uno o más sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

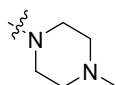
7. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-6, caracterizado porque cada R<sub>1</sub> es independientemente -Cl, o -H.

8. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, caracterizado porque R<sub>2</sub> es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; -N<sub>3</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-6</sub>; alcoxi-C<sub>1-6</sub>; -NH alquilo C<sub>1-6</sub>; -N(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>; -CONH<sub>2</sub>; -CONH alquilo C<sub>1-6</sub>; -CON(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>; -CO alquilo C<sub>1-6</sub>; -NHCO alquilo C<sub>1-6</sub>; -N(alquilo C<sub>1-6</sub>)-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>; heterocíclico-C<sub>5-10</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, -alquilo C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

9. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde R<sub>2</sub> es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; -N<sub>3</sub>; carboxilo; alquilo -C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; -NH alquilo C<sub>1-3</sub>; -N(alquilo C<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>; -CONH<sub>2</sub>; -CONH alquilo C<sub>1-3</sub>; -CON(alquilo C<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>; CO alquilo C<sub>1-3</sub>; NH alquilo COC<sub>1-3</sub>; -N(alquilo C<sub>1-3</sub>)-CO-alquilo C<sub>1-3</sub>; heterocíclico-C<sub>5-10</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

10. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-9, caracterizado porque  $R_2$  es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; -N<sub>3</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; -NHCH<sub>3</sub>; -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; -

CONH<sub>2</sub>; -CONHCH<sub>3</sub>; -CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; -COCH<sub>3</sub>; -NH-COCH<sub>3</sub>; -N(CH<sub>3</sub>)-COCH<sub>3</sub>; ; ; ;

; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o C<sub>1-3</sub>alkoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

11. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-10, caracterizado porque  $R_2$  es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; o metilo sustituido con uno o más sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

12. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-11, caracterizado porque  $R_2$  es -NH<sub>2</sub>.

13. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1-7, caracterizado porque  $R_2$  se combina con  $R_1$  al cual está adyacente para formar un anillo de heteroarilo de 5-10 miembros o heterocíclico de 5-10 miembros, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-O-alquilo C<sub>1-6</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-COOH, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-NHCONH<sub>2</sub>, -CO-N(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>, alquilenio-C<sub>1-6</sub>-NHCO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-CO-N(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>, -CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -SONH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SOCH<sub>3</sub>, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, heterocíclico-C<sub>5-10</sub> o heteroarilo-C<sub>5-10</sub>.

14. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7 o 13, caracterizado porque  $R_2$  se combina con  $R_1$  al cual está adyacente para formar un heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros, heteroarilo de 9 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros o heterocíclico de 9 miembros; y cada uno del heteroarilo o heterocíclico contienen 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, alquilo C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, alquilenio-C<sub>1-3</sub>-O-alquilo C<sub>1-3</sub>, alquilenio-C<sub>1-3</sub>-COOH, alquilenio-C<sub>1-3</sub>-NHCONH<sub>2</sub>, -CO-N(alquilo C<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>, alquilenio-C<sub>1-3</sub>-NHCO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -CO-CO-N(alquilo C<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>, -CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -SONH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SOCH<sub>3</sub> o -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

15. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7 o 13-14, caracterizado porque  $R_2$  se combina con  $R_1$  al cual está adyacente para formar un heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7

miembros, heteroarilo de 8 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros o heterocíclico de 8 miembros; y cada uno del heteroarilo o heterocíclico contienen 1 heteroátomo seleccionado de N u O; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; oxo; =O; -CONH<sub>2</sub>; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>; -CH<sub>2</sub>COOH; -CH<sub>2</sub>NHCONH<sub>2</sub>; -CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; -CH<sub>2</sub>NHCOCH<sub>3</sub>; -CO-CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; -COCH<sub>3</sub>; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub> o carboxilo; o alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub> o carboxilo.

16. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7 o 13-15, caracterizado porque R<sub>2</sub> se combina con R<sub>1</sub> al cual está adyacente para formar un heterocíclico de 5 miembros, y opcionalmente sustituido con -F o -COCH<sub>3</sub>.

17. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7 o 13-16, caracterizado porque R<sub>2</sub>, y R<sub>1</sub> que es adyacente a, junto

con el anillo aromático se unen para formar .

18. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-17, caracterizado porque cada Y<sub>1</sub> es independientemente N o CH.

19. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-18, caracterizado porque cada uno de R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman C=O, C=NH, o C=N-OH.

20. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-19, caracterizado porque cada uno de R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxiC<sub>1-6</sub>alcoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o

R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman C=O.

21. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-20, caracterizado porque cada uno de R<sub>4a</sub> o R<sub>4b</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; alquilo C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o alcoxi C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o

R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman C=O.

22. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-21, caracterizado porque cada uno de R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> es independientemente -H, -NH<sub>2</sub>, -OH, metilo, etilo, metoxi, etoxi; o

$R_{4a}$  y  $R_{4b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman  $C=O$ .

23. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-22, caracterizado porque  $p$  es 0, 1, 2 o 3.

24. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, caracterizado porque cada uno de  $R_{5a}$  y  $R_{5b}$  es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -I; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o aloxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o

$R_{5a}$  y  $R_{5b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros, heterocíclico de 9 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros o heteroarilo de 9 miembros; y cada uno del heterocíclico o heteroarilo contienen 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con -H, -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

25. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-24, caracterizado porque cada uno de  $R_{5a}$  o  $R_{5b}$  es independientemente -H, -NH<sub>2</sub>, -OH, metilo, etilo, metoxi o etoxi; o

$R_{5a}$  y  $R_{5b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman a heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros o heteroarilo de 6 miembros; y cada uno del heterocíclico o heteroarilo contienen 1 heteroátomo seleccionados de N u O.

26. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-25, caracterizado porque cada uno de  $R_{5a}$  o  $R_{5b}$  es independientemente -H o -NH<sub>2</sub>.

27. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-26, caracterizado porque  $W$  está ausente, O, o NR<sub>w</sub>.

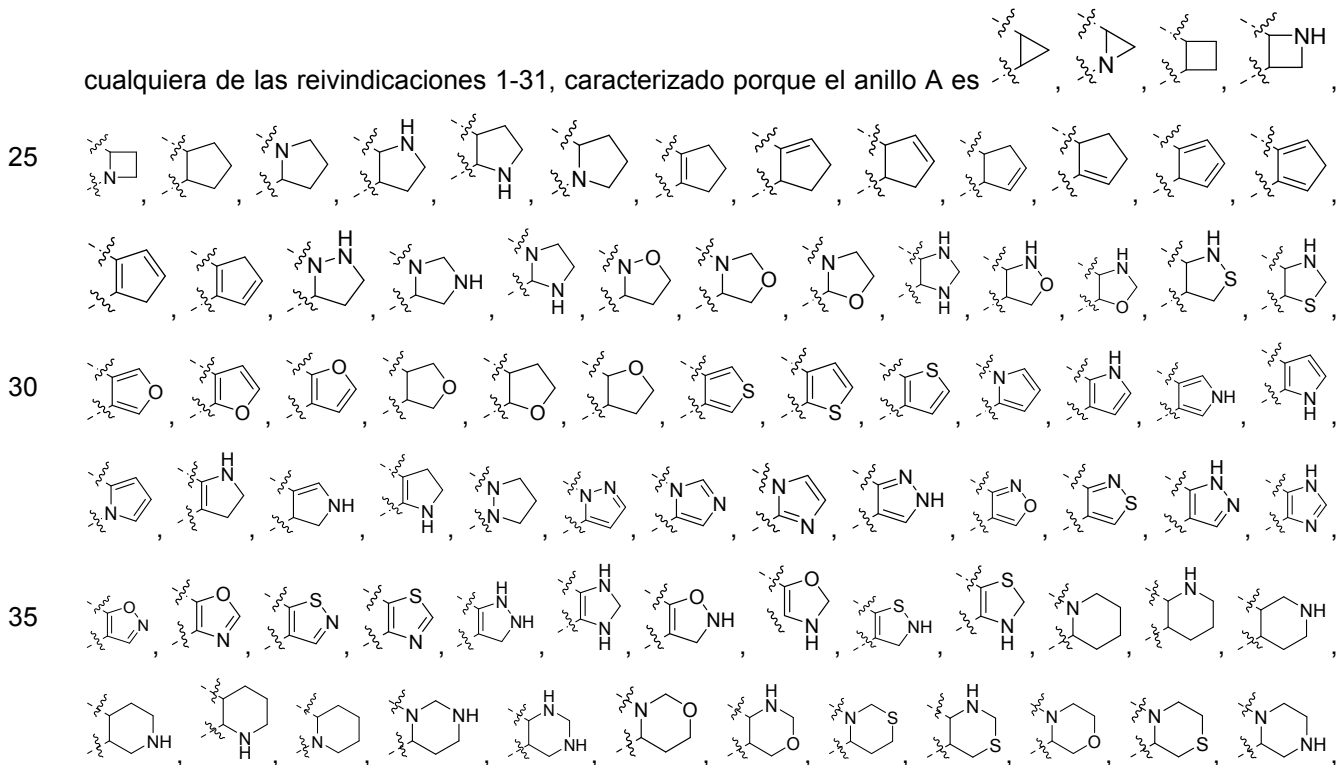
28. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-27, caracterizado porque  $W$  es NR<sub>w</sub>, y  $R_w$  es -H, -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, -CO-alquiloC<sub>1-3</sub>, -COO alquilo C<sub>1-3</sub>, alquilo-C<sub>1-3</sub>-CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

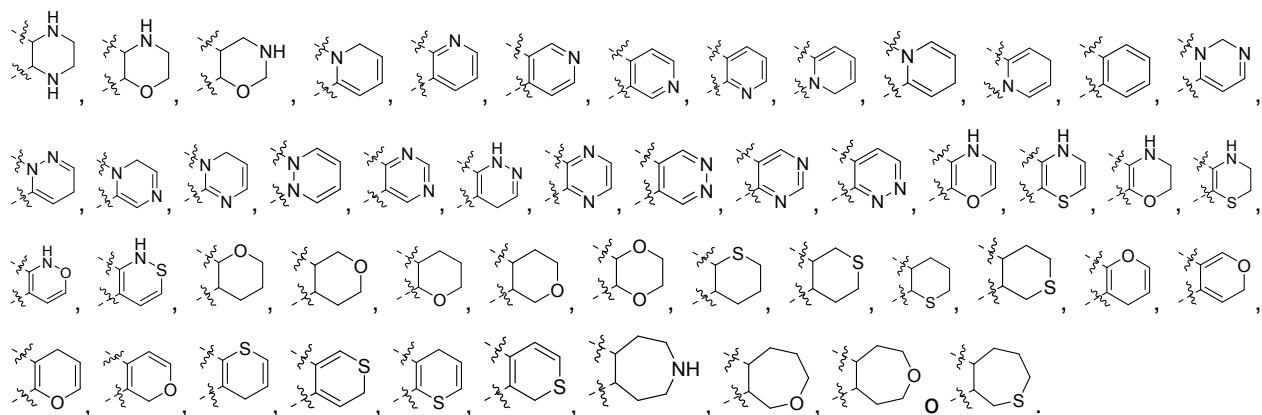
29. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-28, caracterizado porque  $W$  es NR<sub>w</sub>, y  $R_w$  es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; metil-CO-metil; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o alcoxi C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

30. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-29, caracterizado porque el anillo A es arilo de 6 miembros, arilo de 7 miembros, arilo de 8 miembros, arilo de 9 miembros, arilo de 10 miembros; heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros, heteroarilo de 9 miembros, heteroarilo de 10 miembros; heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros, heterocíclico de 9 miembros, heterocíclico de 10 miembros; carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, carbocíclico de 7 miembros, carbocíclico de 8 miembros, carbocíclico de 9 miembros o carbocíclico de 10 miembros; y cada uno del heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; cada uno del heterocíclico contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N u O.

31. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-30, caracterizado porque el anillo A es arilo de 6 miembros, arilo de 7 miembros, arilo de 8 miembros; heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros; heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros; carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, carbocíclico de 7 miembros o carbocíclico de 8 miembros; y cada uno del heteroarilo contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; cada uno del heterocíclico contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O.

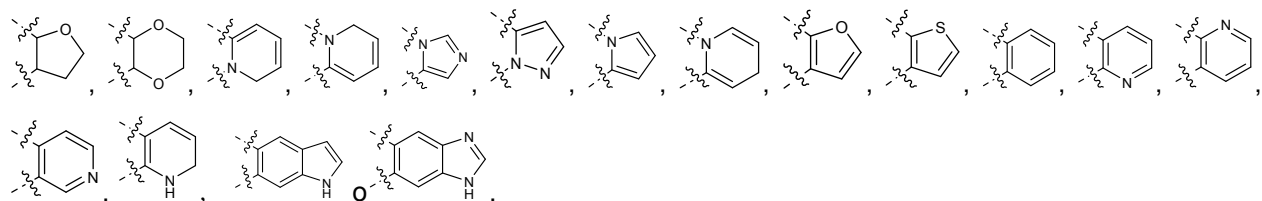
32. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-31, caracterizado porque el anillo A es





33. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con

cualquiera de las reivindicaciones 1-32, caracterizado porque el anillo A es



34. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-33, caracterizado porque  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  o N, y  $Y_3$  es  $CR_{3a}$  o N.

35. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-34, caracterizado porque  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  e  $Y_3$  es  $CR_{3a}$ .

36. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-35, caracterizado porque cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; alquilo-C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; -alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

37. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 36, caracterizado porque cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

38. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 36 o 37, caracterizado porque cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  es independientemente -H o metilo.

39. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 36-38, caracterizado porque  $R_{2a}$  es -H o metilo, y  $R_{2b}$  es -H.

40. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 36-39, caracterizado porque  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  ambos son -H.

41. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-35, caracterizado porque  $Y_2$  es CH o N, e  $Y_3$  es CH o N.

42. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 41, caracterizado porque  $Y_2$  es CH, e  $Y_3$  es CH.

5 43. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 41, caracterizado porque  $Y_2$  es CH, e  $Y_3$  es N.

44. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 41, caracterizado porque  $Y_2$  es N, e  $Y_3$  es CH.

10 45. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-40, caracterizado porque cada uno de  $R_{3a}$  y  $R_{3b}$  es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub>, alcoxi-C<sub>1-3</sub>, o alquilo-C<sub>1-6</sub> o alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>.

46. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 45, caracterizado porque cada uno de  $R_{3a}$  y  $R_{3b}$  es independientemente -H.

15 47. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-35 y 41-44, caracterizado porque cada  $R_6$  es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -I, -NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub>, alquilo-C<sub>1-6</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-O-alquilo C<sub>1-6</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilo-CO-C<sub>1-6</sub>, alquilen-CO-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, -CO-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, -O-alquilen-C<sub>1-6</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, -O-alquilen-C<sub>1-6</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -O-alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -O-carbocíclico C<sub>5-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-heteroarilo C<sub>5-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilen-C<sub>1-6</sub>-heterocíclico C<sub>3-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilen-C<sub>1-6</sub>-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, -S-alquilo C<sub>1-6</sub>, -SO<sub>2</sub>NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -SO<sub>2</sub> alquilo C<sub>1-6</sub>, -PO(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, heterocíclico -C<sub>5-10</sub> o heteroarilo-C<sub>5-10</sub>, en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido; o

30 Dos de  $R_6$  adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un arilo de 6 miembros; carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros; heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros; heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros o heterocíclico de 6 miembros; y en donde cada uno de heteroarilo o heterocíclico contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; y cada uno del sistema de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, =O, oxo, carboxilo, -CONH<sub>2</sub>, -PO(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido.

48. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 47, caracterizado porque cada  $R_6$  es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub>, alquilo-C<sub>1-6</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilen-C<sub>1-6</sub>-O-alquilo C<sub>1-6</sub>,

alquilenos-C<sub>1-6</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, alquilenos-C<sub>1-6</sub>-heterocíclicos C<sub>5-10</sub>, alquilenos-C<sub>1-6</sub>-heteroarilos C<sub>5-10</sub>, alquilenos-C<sub>1-6</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenos-C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilo-CO-C<sub>1-6</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heterocíclicos C<sub>5-10</sub>, -CO- heterocíclicos C<sub>5-10</sub>, -O-carbocíclicos C<sub>5-10</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenos C<sub>1-6</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenos C<sub>1-6</sub>-heterocíclicos C<sub>3-10</sub>, -S-alquilo C<sub>1-6</sub>, -SO<sub>2</sub>NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -SO<sub>2</sub> alquilo C<sub>1-6</sub>, heterocíclicos-C<sub>5-10</sub> o heteroarilos-C<sub>5-10</sub>, en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido -F, -Cl, Br, -NH<sub>2</sub>, -OH, carboxilo, oxo, =O, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o

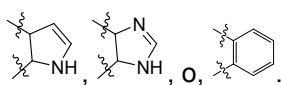
Dos de R<sub>6</sub> adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un arilo de 6 miembros; carbocíclico de 5 miembros, heteroarilo de 5 miembros o heterocíclico de 5 miembros; y en donde cada uno de heteroarilo o heterocíclico contienen 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; y cada uno del sistema de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, =O, oxo, carboxilo, -CONH<sub>2</sub>, -PO(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

49. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 47 o 48, caracterizado porque cada R<sub>6</sub> es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-3</sub>, alquilo-C<sub>1-3</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-O-alquilo C<sub>1-3</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-CO-OR<sub>6a</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-heterocíclicos C<sub>5-6</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-heteroarilos C<sub>5-6</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, alquilenos-C<sub>1-3</sub>-NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>-heterocíclicos C<sub>5-6</sub>, -CO-heterocíclicos C<sub>5-6</sub>, -O-carbocíclicos C<sub>5-6</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenos C<sub>1-3</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilenos-C<sub>1-6</sub>-heterocíclicos C<sub>3-6</sub>, -S-alquilo C<sub>1-3</sub>, -SO<sub>2</sub>NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -SO<sub>2</sub> alquilo C<sub>1-3</sub>, heterocíclicos-C<sub>5-6</sub> o heteroarilos-C<sub>5-6</sub>, en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de -F, -Cl, Br, -NH<sub>2</sub>, -OH, carboxilo, oxo, =O, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o

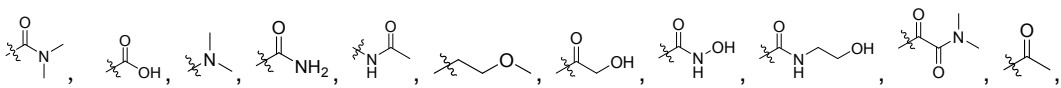
Dos de R<sub>6</sub> adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un arilo de 6 miembros; carbocíclico de 5 miembros, heteroarilo de 5 miembros o heterocíclico de 5 miembros; y en donde cada uno de heteroarilo o heterocíclico contienen 1, o 2 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; y cada uno del sistema de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, =O, oxo, carboxilo, -CONH<sub>2</sub>, -PO(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

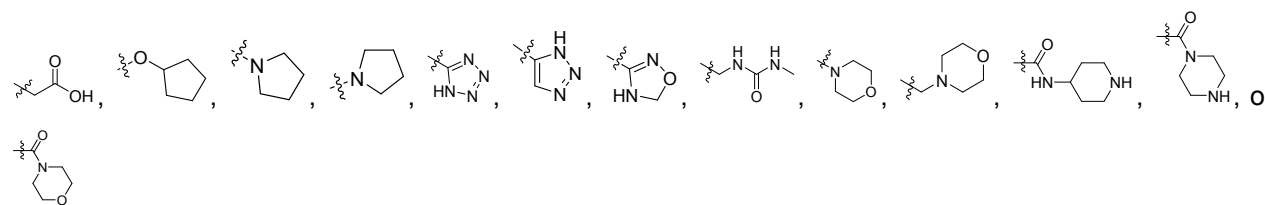
50. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-49, caracterizado porque cada R<sub>6</sub> es independientemente -F, -Cl, -Br, =O, -OH, -CN, -NH<sub>2</sub>, , -CH<sub>3</sub>, , -CF<sub>3</sub>, , -OCH<sub>3</sub>, -SCH<sub>3</sub>, -SOCH<sub>3</sub>, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -PO(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -

PO(OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(O)NH<sub>2</sub>, , , , -NHCOCH<sub>3</sub>, , -NHCONHCH<sub>3</sub>, , , , , , , , , , , o dos R<sub>6</sub> adyacente se pueden unir

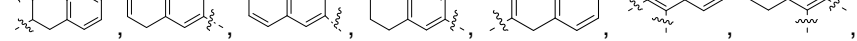
conjuntamente para formar .

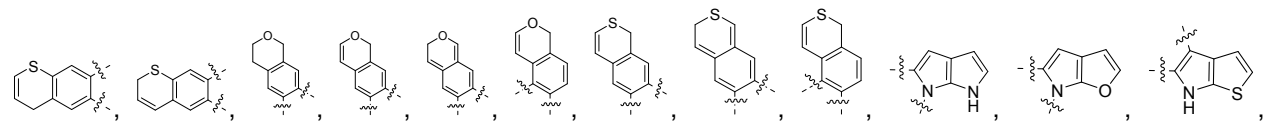
51. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-50, caracterizado porque cada  $R_6$  es independientemente metilo, etilo, isopropilo, metoxi, etoxi, =O, oxo, -OH, -CN, -NH<sub>2</sub>, -Cl, -Br, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -F, -

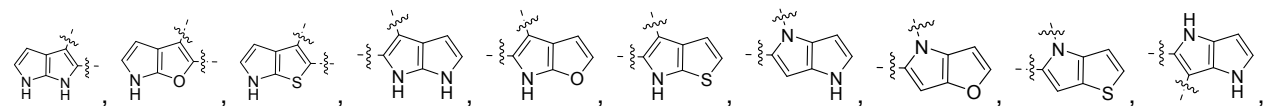
CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SCH<sub>3</sub>, .

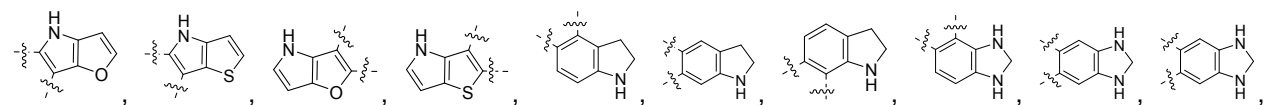
.

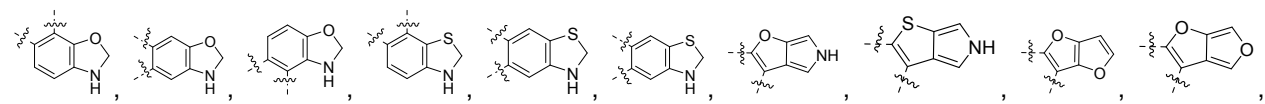
52. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-51, caracterizado porque el anillo A y los dos

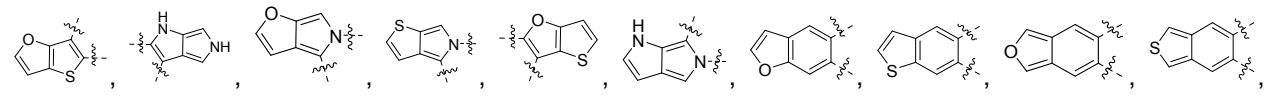
de  $R_6$  adyacentes juntos forman .

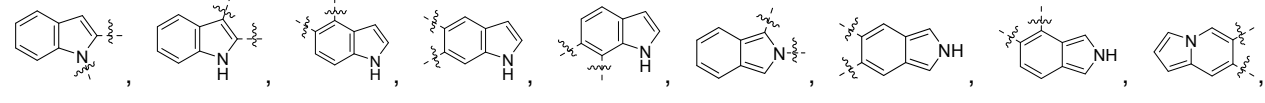
.

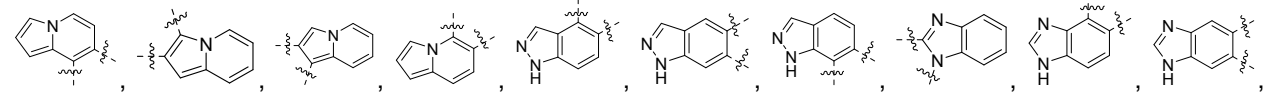
.

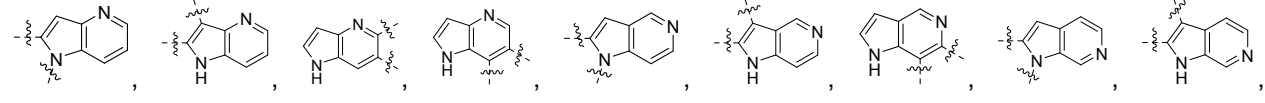
.

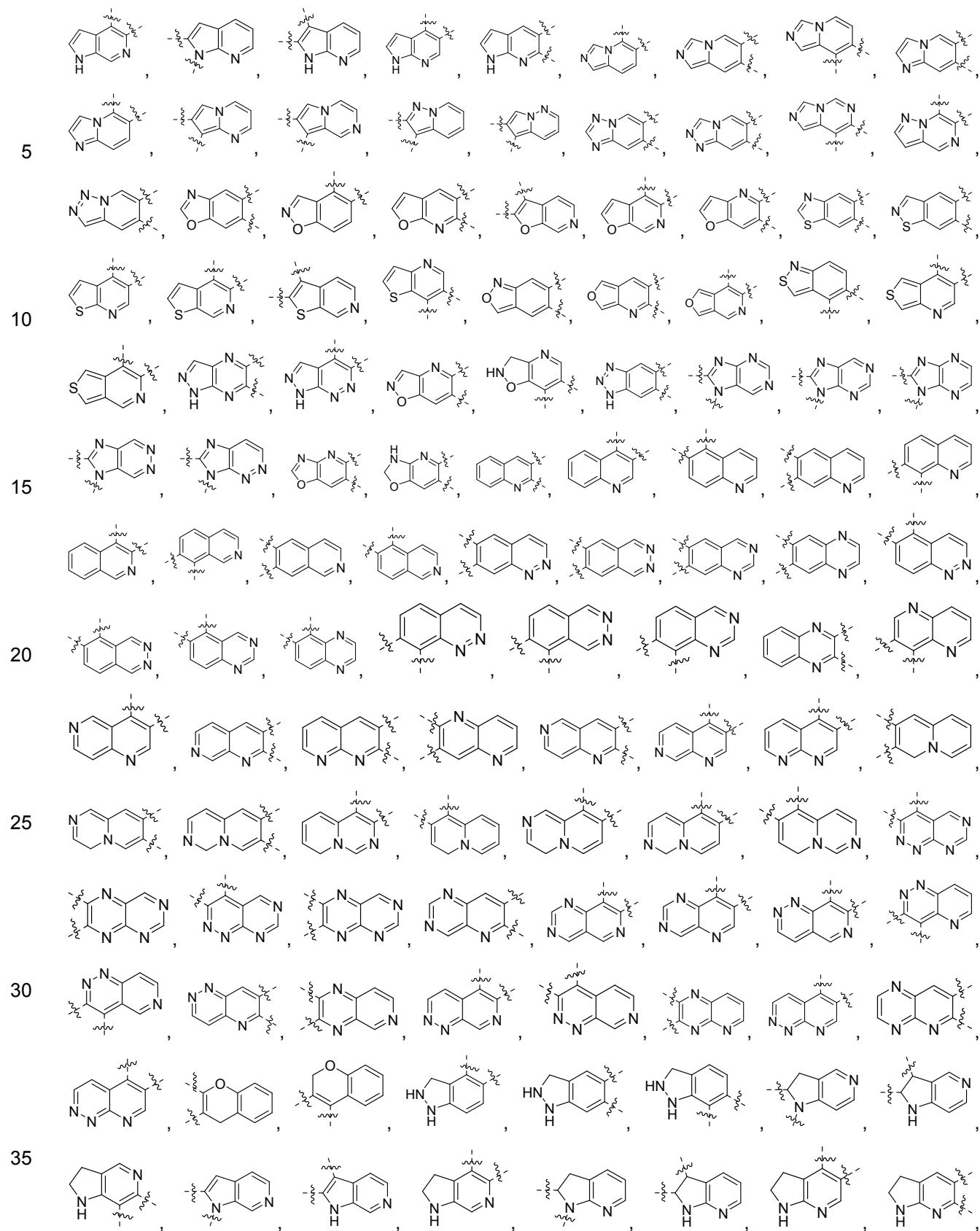
.

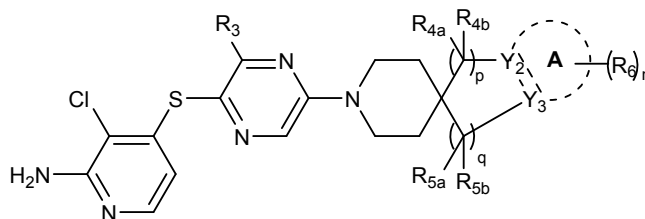
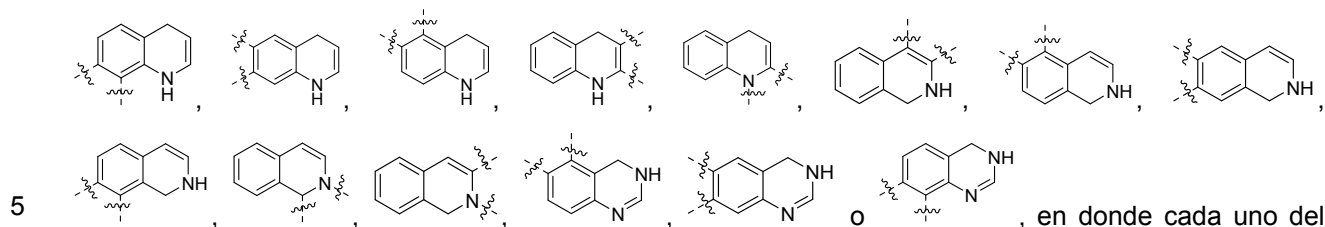
.

.

.

.





II

En donde,

$R_3$  es -H o  $-NH_2$ ;

Cada uno de  $R_{4a}$  o  $R_{4b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido; o

$R_{4a}$  y  $R_{4b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman  $C=O$ ,  $C=NH$ , o  $C=N-OH$ ;

5 p es 0, 1, 2 o 3;

Cada uno de  $R_{5a}$  o  $R_{5b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alxoci- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o  $-C_{1-6}$  sustituido o no sustituido; o

$R_{5a}$  y  $R_{5b}$  juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman un heteroarilo heterocíclico de 3-10 miembros o 5-10 miembros; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera  
10 independiente opcionalmente sustituido;

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

El anillo A está ausente o un anillo de 3-10 miembros;

== representa un enlace individual o doble;

Cuando el anillo A está ausente,  $Y_2$  es  $CR_{2a}R_{2b}$ ,  $NR_{2a}$  o O, e  $Y_3$  es  $CR_{3a}R_{3b}$ ,  $NR_{3a}$  u O;

15 Cuando el anillo A es un anillo de 3-1 miembros, en donde,

i)  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  o N, y  $Y_3$  es  $CR_{3a}$  o N, cuando == representa un enlace individual; o

ii)  $Y_2$  es C, e  $Y_3$  es C, cuando == representa un enlace doble;

Cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{2b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

20 Cada uno de  $R_{3a}$  y  $R_{3b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

Cada  $R_6$  es independientemente -H, halógeno,  $-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , oxo,  $=O$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$ , alquilo- $C_{1-6}$ , alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilen- $C_{1-6}-O$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alquilen- $C_{1-6}-CO-OR_{6a}$ , alquilen- $C_{1-6}-C_{3-10}$ heterocíclico, alquilen- $C_{1-6}$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ , alquilen- $C_{1-6}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ , alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CO-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-CO$ -alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-CO-NR_{6a}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-CO-NR_{6a}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-CO$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-O$ -alquilen- $C_{1-6}-CO-OR_{6a}$ ,  $-O$ -alquilen- $C_{1-6}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-O$ -alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-O-C_{3-10}$ carbocíclico,  $-NR_{6a}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-NR_{6a}-CO-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-NR_{6a}-CO$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilen- $C_{1-6}-NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilen- $C_{1-6}$ -heterocíclico  $C_{3-10}$ ,  $-NR_{6a}$ -alquilen- $C_{1-6}$ -heteroarilo  $C_{5-10}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SONR_{6a}R_{6b}$ ,  $-SO_2NR_{6a}R_{6b}$ ,  $-SO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SO_2$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-PO$ (alquilo  $C_{1-6})_2$ , heterocíclico- $C_{3-1}$  o heteroarilo- $C_{5-10}$ , en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido; y n es 0, 1, 2 o 3; o dos  $R_6$  adyacente se pueden unir conjuntamente para formar un arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heterocíclico- $C_{3-6}$  o carbocíclico- $C_{3-6}$ , en donde cada uno del sistema de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido;

35 Cada uno de  $R_{6a}$  y  $R_{6b}$  es independientemente -H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido.

59. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 58, caracterizado porque cada uno de  $R_{4a}$  o  $R_{4b}$  es independientemente -H, halógeno, -

NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman C=O.

60. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con las reivindicaciones 58 o 59, caracterizado porque cada uno de R<sub>4a</sub> o R<sub>4b</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; carboxilo; metilo; etilo; metoxi; etoxi; metilo sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi; etilo sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi; metoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi; o etoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, metoxi o etoxi; o

R<sub>4a</sub> y R<sub>4b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman C=O.

61. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-60, caracterizado porque p es 0, 1 o 2.

62. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-61, caracterizado porque cada uno de R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; carboxilo; alquilo-C<sub>1-3</sub>; alcoxi-C<sub>1-3</sub>; alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-3</sub> o alcoxi-C<sub>1-3</sub>; o

R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman a heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros o heterocíclico de 6 miembros; y cada uno del heterocíclico contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O; y cada uno del sistema de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alquilo-C<sub>1-6</sub>, o alcoxi-C<sub>1-6</sub>.

63. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-62, caracterizado porque cada uno de R<sub>5a</sub> o R<sub>5b</sub> es independientemente -H; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -OH; carboxilo; metilo; etilo; metoxi; etoxi; metilo sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo o metoxi; etilo sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo o metoxi; metoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo o metoxi; o etoxi sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo o metoxi; o

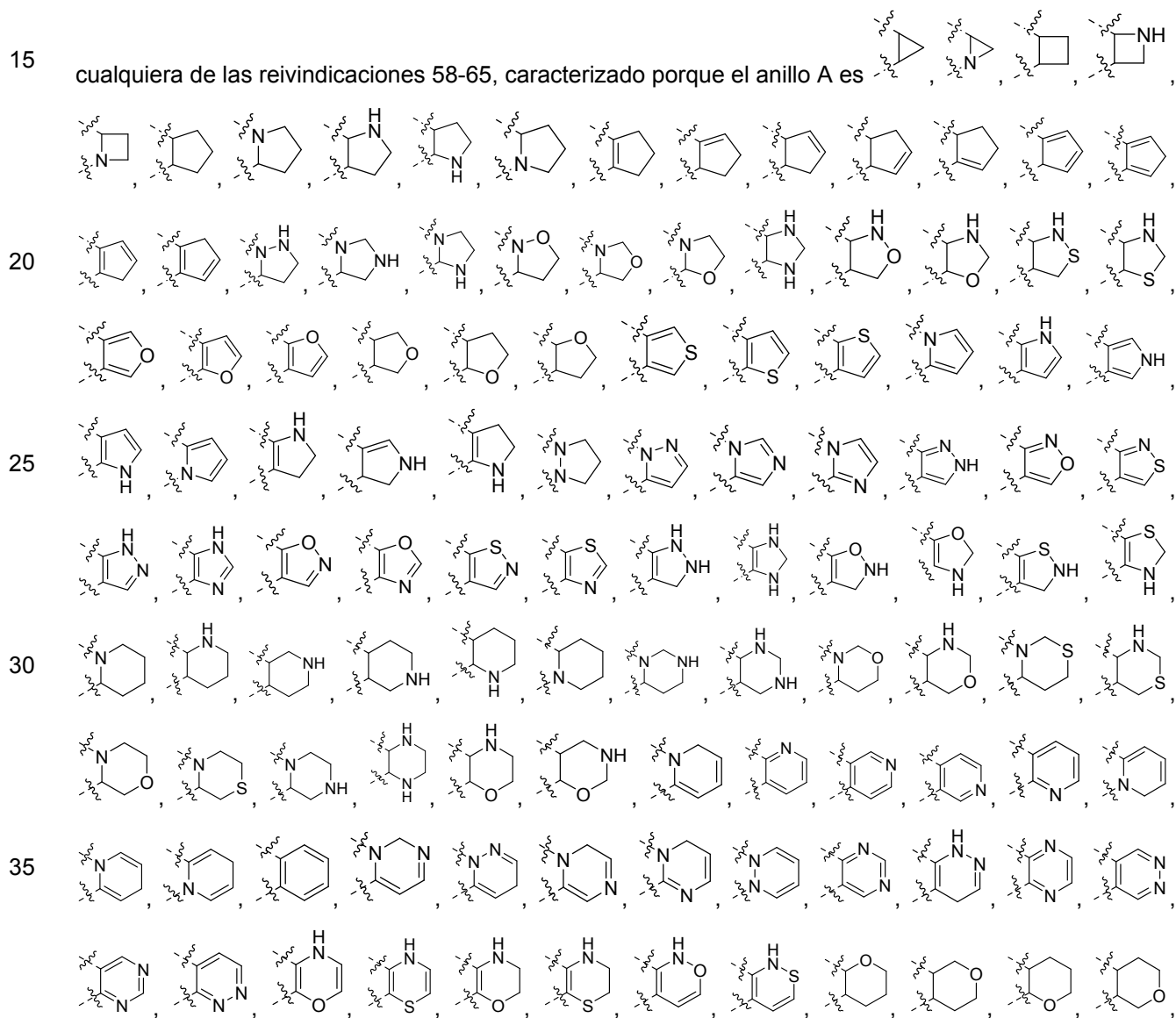
R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> juntos con el átomo de carbono al cual ambos se unen forman , y \*C representa el átomo de carbono al cual R<sub>5a</sub> y R<sub>5b</sub> se unen.

64. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-63, caracterizado porque el anillo A es arilo de 6 miembros, arilo de 7 miembros, arilo de 8 miembros, arilo de 9 miembros; heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros, heteroarilo de 9 miembros; heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros, heterocíclico de 9 miembros; carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6

miembros, carbocíclico de 7 miembros, carbocíclico de 8 miembros o carbocíclico de 9 miembros; y cada uno del heteroarilo contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; cada uno del heterocíclico contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N u O.

65. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-64, caracterizado porque el anillo A es arilo de 6 miembros, arilo de 7 miembros, arilo de 8 miembros; heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros; heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros; carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, carbocíclico de 7 miembros o carbocíclico de 8 miembros; y cada uno del heteroarilo contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; cada uno del heterocíclico contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O.

66. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-65, caracterizado porque el anillo A es



cualquiera de las reivindicaciones 58-66, caracterizado porque el anillo A es , , , 

Chemical structures of various heterocyclic compounds, including tetrahydrofuran, tetrahydropyran, pyridine, pyrrole, imidazole, indazole, pyrazole, furan, thiophene, benzene, quinoline, and indole, each with wavy lines indicating attachment points.

69. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-68, caracterizado porque cada uno de R<sub>2a</sub>, R<sub>2b</sub>, R<sub>3a</sub> y R<sub>3b</sub> es independientemente -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metilo; etilo; propilo; isopropilo; metoxi; etoxi; propoxi; isopropoxi; -C<sub>1-3</sub>alkyl sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi; o alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

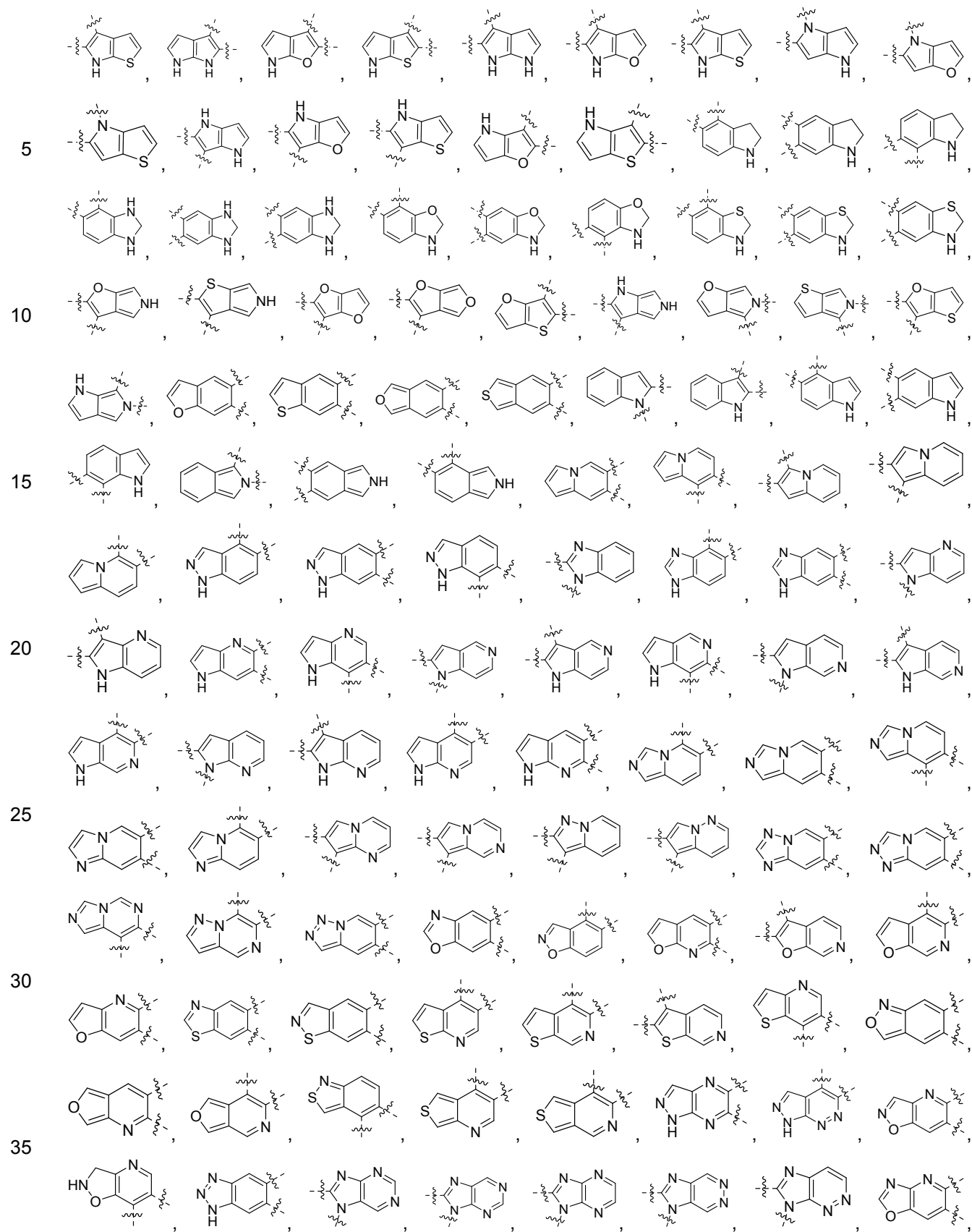
71. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-70, caracterizado porque  $R_{2a}$ ,  $R_{2b}$ ,  $R_{3a}$  y  $R_{3b}$  todos son -H.

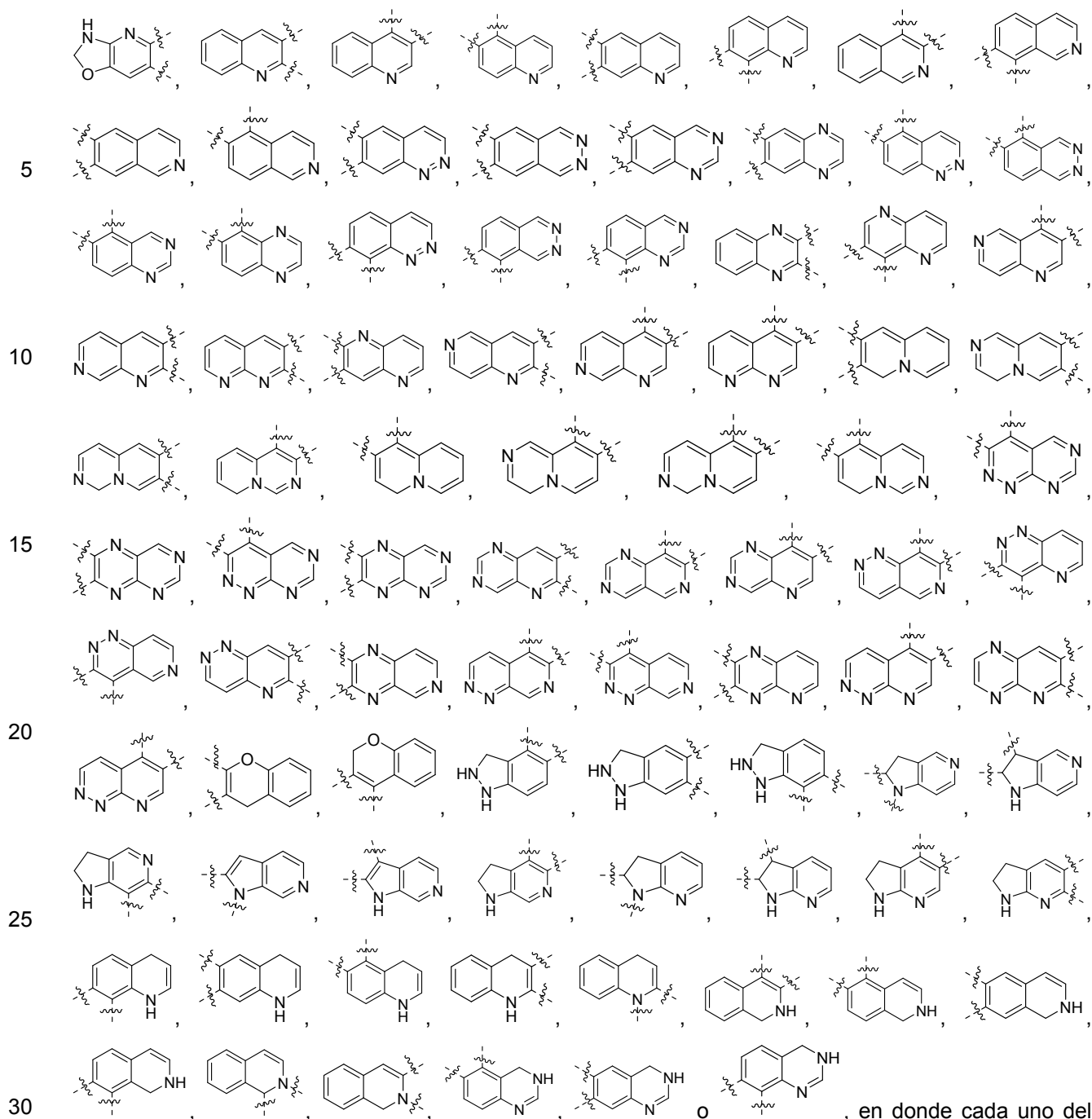
72. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-71, caracterizado porque  $Y_2$  es CH o N, e  $Y_3$  es CH o N.

73. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-67, caracterizado porque  $Y_2$  es C, e  $Y_3$  es C.

74. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-73, caracterizado porque cada R<sub>6</sub> es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-3</sub>, alquilo-C<sub>1-3</sub>, -CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, alquilen-C<sub>1-3</sub>, -OCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-COOH, -CH<sub>2</sub>-COO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -CH<sub>2</sub>-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, aquileno-C<sub>1-3</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CH<sub>2</sub>NH-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -COCO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -CO-alquiloC<sub>1-3</sub>, -CONH-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, -CO-heterocíclico de 5 miembros, -CO-heterocíclico de 6 miembros, -O-carbocíclico de 5 miembros, -O-carbocíclico de 6 miembros, -NH-CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -NR<sub>6a</sub>-CO-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilen-C<sub>1-3</sub>-NR<sub>6a</sub>R<sub>6b</sub>, -NR<sub>6a</sub>-alquilen-C<sub>1-3</sub>-heterocíclico C<sub>5-10</sub>, -S-alquilo C<sub>1-3</sub>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, o heteroarilo de 6 miembros, en donde cada uno







anillo A es de manera independiente opcionalmente sustituido con uno o más  $R_6$ .

78. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-77, caracterizado porque cada uno de  $R_{6a}$  y  $R_{6b}$  es independientemente -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcox-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

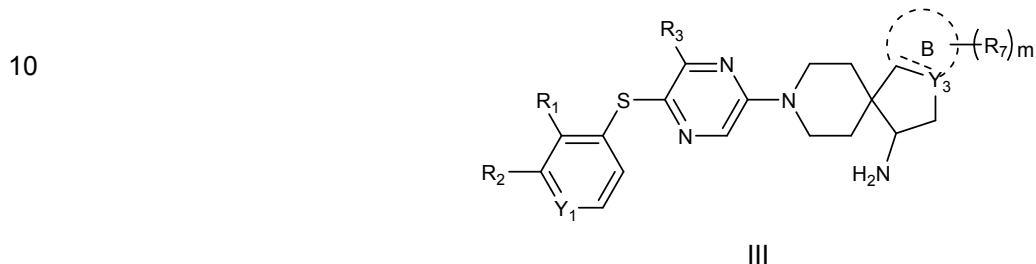
79. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-78, caracterizado porque cada uno de  $R_{6a}$  y  $R_{6b}$  es independientemente -H, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -OH, carboxilo, metilo, etilo, metoxi, etoxi propoxi, isopropoxi,

metilo sustituido con -OH, o etilo sustituido con -OH.

80. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-79, caracterizado porque cada uno de  $R_{6a}$  y  $R_{6b}$  es independientemente -H, -CH<sub>3</sub>, -OH, o -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH.

5 81. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 58-80, caracterizado porque n es 0, 1 o 2.

82. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula III:



15 en donde,

$R_1$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido;

$R_2$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

20  $R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un anillo heterocíclico de 5-10 miembros contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N u O, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o -CO-alquilo C<sub>1-6</sub>;

25  $Y_1$  es N o CH;

$R_3$  es -H o -NH<sub>2</sub>;

El anillo B es un arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros, carbocíclico de 3-6 miembros o heterocíclico de 3-6 miembros;

$Y_3$  es CH, N o C;

30  $R_7$  es halógeno, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, -NH-COCH<sub>3</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; y m es 0, 1 o 2.

83. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 82, caracterizado porque  $R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros, heterocíclico de 9 miembros o heterocíclico de 10 miembros; y cada uno del heterocíclico contiene 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N u O; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o -CO-alquilo C<sub>1-3</sub>.

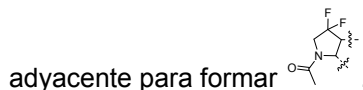
35

84. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con las reivindicaciones 82 o 83, caracterizado porque  $R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar



; y los sistemas de anillos es de manera independiente opcionalmente sustituido con -F o -COCH<sub>3</sub>.

5 85. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 82-84, caracterizado porque  $R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está

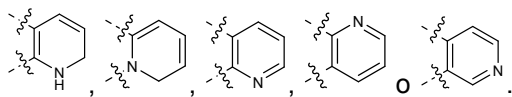


adyacente para formar

10 86. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 82-85, caracterizado porque el anillo B es anillo de 6 miembros, heteroanillo de 5 miembros, heteroanillo de 6 miembros, carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros o heterocíclico de 6 miembros; y cada uno del heteroanillo o heterocíclico contienen 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S.

15 87. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con

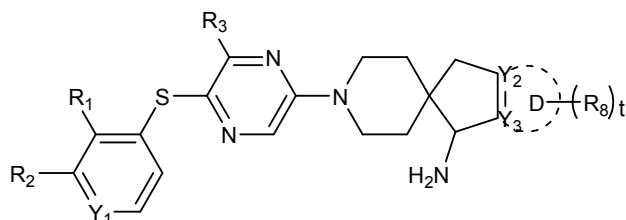
cualquiera de las reivindicaciones 82-86, caracterizado porque el anillo B es



20 88. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 82-87, caracterizado porque  $R_7$  es -NH<sub>2</sub>, -CN, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, -NH-COCH<sub>3</sub>, metilo o metoxi.

25 89. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 82-88, caracterizado porque m es 0 o 1.

90. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-57, caracterizado porque el compuesto es de la Fórmula IV:



IV

en donde,

35  $R_1$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido;

$R_2$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, -NH alquilo C<sub>1-6</sub>, -N(alquilo C<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-6</sub> sustituido o no sustituido; o

$R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un anillo heterocíclico de 5-12 miembros contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N u O, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, oxo,  $=O$ ,  $-CONH_2$ , alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o  $-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ;

$Y_1$  es N o CH;

$R_3$  es  $-H$  o  $-NH_2$ ;

El anillo D es a arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 3 miembros, heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros, o heterocíclico de 6 miembros;

$==$  representa un enlace individual o doble; y

i)  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  o N, e  $Y_3$  es  $CR_{3a}$  o N, cuando  $==$  representa un enlace individual; o

ii)  $Y_2$  es C, e  $Y_3$  es C, cuando  $==$  representa un enlace doble;

Cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{3a}$  es  $-H$ , halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido;

$R_8$  es halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, oxo,  $=O$ ,  $-SO_2NR_{8a}R_{8b}$ ,  $-S$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-SO_2$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-CO-NR_{8a}R_{8b}$ ,  $-PO$ (alquilo  $C_{1-6}$ ) $_2$ ,  $-PO$ (alquilo  $C_{1-6}$ ) $_2$ ,  $-NR_{8a}-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ ,  $-NR_{8a}-CO-NR_{8a}R_{8b}$ ,  $-O$ -carbocíclico  $C_{5-10}$ ,  $-O$ -heterocíclico  $C_{5-10}$ , heterocíclico- $C_{5-10}$  o heteroarilo- $C_{5-10}$ , arilo- $C_{5-10}$ , alcoxi- $C_{1-6}$ , o alquilo- $C_{1-6}$ ; y cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido; y t es 0, 1, 2 o 3; y

Cada uno de  $R_{8a}$  y  $R_{8b}$  es independientemente H, halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido.

91. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 90, caracterizado porque  $R_2$  es  $-H$ ,  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido; o

$R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un anillo heterocíclico de 5-10 miembros contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N u O, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con halógeno,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, oxo,  $=O$ ,  $-CONH_2$ , alcoxi- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, alquilo- $C_{1-6}$  sustituido o no sustituido, o  $-CO$ -alquilo  $C_{1-6}$ .

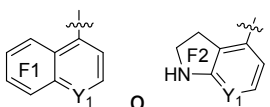
92. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 90 o 91, caracterizado porque  $R_2$  es  $-H$ ,  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo,  $-NH$  alquilo  $C_{1-3}$ ,  $-N$ (alquilo  $C_{1-3}$ ) $_2$ , alcoxi- $C_{1-3}$ , alquilo- $C_{1-3}$ ; o

$R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un 5,6-, o heterocíclico de 7 miembros ring contiene 1, o 2 heteroátomos seleccionados de N u O, y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-NH_2$ ,  $-CN$ ,  $-OH$ ,  $-NO_2$ , carboxilo, oxo,  $=O$ ,  $-CONH_2$ , metoxi, etoxi, metilo, etilo,  $-CO$ -metil, o  $-CO$ -etilo.

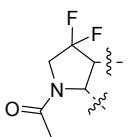
93. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-92, caracterizado porque  $R_2$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, -NHCH<sub>3</sub>, -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, metoxi, etoxi, metilo, o etilo; o

$R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está adyacente para formar un heterocíclico de 5 miembros contiene 1 heteroátomos seleccionados de N u O, o el anillo heterocíclico de 6 miembros seleccionados de N u O; y cada uno de los sistemas de anillos está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -CONH<sub>2</sub>, metoxi, etoxi, metilo, etilo, -CO-metilo, o -CO-etilo.

94. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93, caracterizado porque  $R_1$ , y  $R_2$ , junto con el anillo aromático se

unen para formar  en donde el anillo F1 o F2 es de manera independiente opcionalmente sustituido con -F o -COCH<sub>3</sub>.

95. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-94, caracterizado porque  $R_1$  se combina con  $R_2$  al cual está

adyacente para formar .

96. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93, caracterizado porque  $R_2$  es -NH<sub>2</sub>.

97. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93 y 96, caracterizado porque  $R_1$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

98. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93 o 96-97, caracterizado porque  $R_1$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, metoxi, etoxi, metil, o metilo sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno.

99. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93 o 96-98, caracterizado porque  $R_1$  es -H; -F; -Cl; -Br; -NH<sub>2</sub>; -CN; -OH; -NO<sub>2</sub>; carboxilo; metil; o metilo sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de -F, -Cl, o -Br.

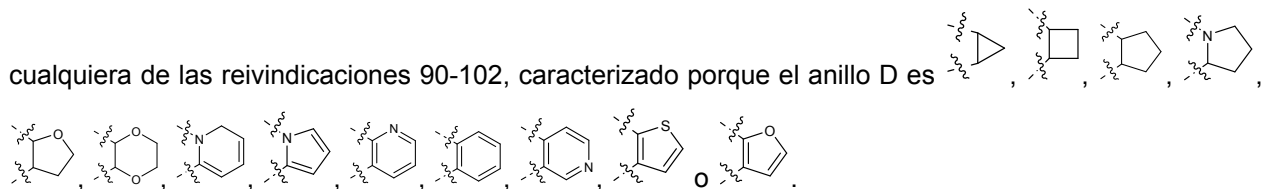
100. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-93 o 96-99, caracterizado porque  $R_1$  es -Cl.

101. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-100, caracterizado porque el anillo D es arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 3 miembros,

heterocíclico de 4 miembros, heterocíclico de 5 miembros o heterocíclico de 6 miembros; y cada uno del heteroarilo o heterocíclico contienen 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S.

102. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-101, caracterizado porque el anillo D es arilo de 6 miembros, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, carbocíclico de 3 miembros, carbocíclico de 4 miembros, carbocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 5 miembros o heterocíclico de 6 miembros; y cada uno del heteroarilo o heterocíclico contienen 1 o 2 heteroátomos seleccionados de N, O, o S.

103. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con

10 cualquiera de las reivindicaciones 90-102, caracterizado porque el anillo D es 

104. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-103, caracterizado porque  $Y_2$  es  $CR_{2a}$  o N, e  $Y_3$  es  $CR_{3a}$  o N.

105. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-104, caracterizado porque cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{3a}$  es -H, -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

106. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-105, caracterizado porque cada uno de  $R_{2a}$  y  $R_{3a}$  es -H, metilo o metoxi.

107. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-106, caracterizado porque  $Y_2$  es CH o N, e  $Y_3$  es CH o N.

108. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-103, caracterizado porque tanto  $Y_2$  como  $Y_3$  son C.

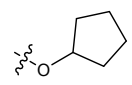
109. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-108, caracterizado porque  $R_8$  es -F, -Cl, -Br, -I, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -SO<sub>2</sub>NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -S-alquilo C<sub>1-6</sub>, -CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -NR<sub>8a</sub>-CO-alquilo C<sub>1-6</sub>, -NR<sub>8a</sub>-CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -O-carbocíclico C<sub>5-10</sub>, heterocíclico-C<sub>5-10</sub> o heteroarilo-C<sub>5-10</sub>, alcoxi-C<sub>1-6</sub>, o alquilo-C<sub>1-6</sub>; en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, alcoxi-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido, o alquilo-C<sub>1-3</sub> sustituido o no sustituido.

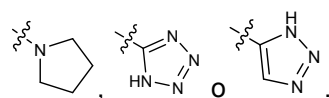
110. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-109, caracterizado porque  $R_8$  es -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, -SO<sub>2</sub>NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -S-alquilo C<sub>1-3</sub>, -CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -NH-CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -NH-CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -O-carbocíclico C<sub>5-10</sub>, heterocíclico-C<sub>5-10</sub>, heteroarilo-C<sub>5-10</sub>, alcoxi-C<sub>1-3</sub>, o alquilo-C<sub>1-3</sub>; en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, alcoxi-C<sub>1-3</sub>, o alquilo-C<sub>1-3</sub>.

111. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con

cualquiera de las reivindicaciones 90-110, caracterizado porque  $R_8$  es -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, -NO<sub>2</sub>, carboxilo, oxo, =O, metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, -SO<sub>2</sub>NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -S-alquilo C<sub>1-3</sub>, -CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -NH-CO-alquilo C<sub>1-3</sub>, -NH-CO-NR<sub>8a</sub>R<sub>8b</sub>, -O-carbocíclico C<sub>5-10</sub>, heterocíclico-C<sub>5-10</sub> o heteroarilo-C<sub>5-10</sub>; en donde cada uno de los cuales está de manera independiente opcionalmente sustituido con -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, metoxi, etoxi, metilo, o etilo.

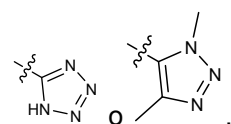
112. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-111, caracterizado porque el carbocíclico C<sub>5-10</sub> es carbocíclico de 5 miembros, carbocíclico de 6 miembros, carbocíclico de 7 miembros, carbocíclico de 8 miembros, carbocíclico de 9 miembros o carbocíclico de 10 miembros; el heterocíclico C<sub>5-10</sub> es heterocíclico de 5 miembros, heterocíclico de 6 miembros, heterocíclico de 7 miembros, heterocíclico de 8 miembros, heterocíclico de 9 miembros o heterocíclico de 10 miembros; y el heteroarilo C<sub>5-10</sub> es heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, heteroarilo de 7 miembros, heteroarilo de 8 miembros, heteroarilo de 9 miembros o heteroarilo de 10 miembros; y cada uno del heterocíclico o heteroarilo contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O, o S.

113. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-112, caracterizado porque  $R_8$  es -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo, =O, metilo, etilo, isopropilo, metoxi, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -SCH<sub>3</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -NH-COCH<sub>3</sub>, -NH-CONHCH<sub>3</sub>, ,



114. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-113, caracterizado porque  $R_8$  es -F, -Cl, -Br, -NH<sub>2</sub>, -CN, -OH, oxo,

=O, metil, metoxi, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -SCH<sub>3</sub>, -CONH<sub>2</sub>, -NH-COCH<sub>3</sub>, -NH-CONHCH<sub>3</sub>, , , ,



115. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 90-114, caracterizado porque t es 0, 1 o 2.

116. El compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con la reivindicación 1-115, caracterizado porque el compuesto es

|   |                                                                                                                           |
|---|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina        |
| 2 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina        |
| 3 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3,4-dihidro-2H-espiro[naftaleno-1,4'-piperidin]-2-amina |

|    |    |                                                                                                                                           |
|----|----|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 4  | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-7,4'-piperidin]-6-amina          |
|    | 5  | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |
|    | 6  | (R)-1-(4-((3-amino-5-(2-amino-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona        |
|    | 7  | 1-(4-((3-amino-5-((2R)-2-aminoespiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona     |
|    | 8  | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3,4-dihidro-1H-espiro[naftaleno-2,4'-piperidin]-1-amina                 |
| 10 | 9  | (R)-1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-7',8'-dihidro-5'H-espiro[piperidin-4,6'-quinolin]-7'-amina               |
|    | 10 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina          |
|    | 11 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |
| 15 | 12 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]tiofeno-5,4'-piperidin]-4-amina          |
|    | 13 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carbonitrilo         |
|    | 14 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |
| 20 | 15 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-cloro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                |
|    | 16 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-carbonitrilo         |
|    | 17 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-carboxamida          |
| 25 | 18 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                        |
|    | 19 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina  |
|    | 20 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3-metoxi-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-7-amina |
| 30 | 21 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-7-amina          |
|    | 22 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-                                                                    |
|    |    |                                                                                                                                           |

|    |    |                                                                                                                                               |
|----|----|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|    |    | dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                                                                    |
| 5  | 23 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metil-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                    |
|    | 24 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(metilsulfonyl)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina          |
|    | 25 | (1S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(metilsulfinil)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina         |
| 10 | 26 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carboxamida              |
|    | 27 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-N,N-dimetil-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carboxamida  |
|    | 28 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-bromo-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                    |
| 15 | 29 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4-bromo-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                    |
|    | 30 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                      |
| 20 | 31 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[ciclopenta[a]naftaleno-2,4'-piperidin]-3-amina            |
|    | 32 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-cloro-5-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina           |
|    | 33 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1,6-diamina                        |
| 25 | 34 | (S)-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-il)dimetilfosfina oxide |
|    | 35 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(trifluorometil)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina         |
| 30 | 36 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1H-imidazol-1-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina       |
|    | 37 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1H-pirrol-1-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina         |
| 35 | 38 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-bromo-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina           |
|    | 39 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6-difluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |
|    | 40 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-difluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |

|    |    |                                                                                                                                                        |
|----|----|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 41 | (S)-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)dimetilfosfina oxide |
|    | 42 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carbonitrilo             |
|    | 43 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carboxamida              |
|    | 44 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina                |
| 10 | 45 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[benzofuran-2,4'-piperidin]-3-amina                                         |
|    | 46 | (S)-1-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)urea                        |
| 15 | 47 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-bromo-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                             |
|    | 48 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                             |
|    | 49 | (S)-1'-(5-((3-cloro-2-(dimetilamino)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                    |
| 20 | 50 | (S)-1'-(5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                                    |
|    | 51 | (S)-1'-(5-((3-cloro-2-metoxipiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                            |
|    | 52 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-(dimetilamino)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                            |
| 25 | 53 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                            |
|    | 54 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-metoxipiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                    |
| 30 | 55 | (S)-1'-(6-amino-5-((2,3-diclorofenil)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                                |
|    | 56 | (R)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[benzofuran-2,4'-piperidin]-3-amina                                                 |
| 35 | 57 | (S)-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)dimetilfosfina oxide          |
|    | 58 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-((tetrahydro-2H-piran-4-il)oxi)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina   |
|    | 59 | (S)-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)(piperidin-1-il)metanona      |

|    |    |                                                                                                                                              |
|----|----|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 60 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-morfolino-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina               |
|    | 61 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6,7-trifluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina           |
|    | 62 | (S)-4-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)morfolin-3-ona    |
|    | 63 | (S)-N-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)metanosulfonamida |
| 10 | 64 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[ciclopenta[b]quinolina-2,4'-piperidin]-1-amina           |
|    | 65 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina             |
| 15 | 66 | (S)-1'-(6-amino-5-((2,3-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                               |
|    | 67 | (1R,3R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1,3-diamina                   |
|    | 68 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-6-amina              |
| 20 | 69 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-6-amina      |
|    | 70 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[indolizin-2,4'-piperidin]-5(1H)-ona                      |
| 25 | 71 | (R)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[indolina-2,4'-piperidin]-3-amina                                             |
|    | 72 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-5,4'-piperidin]-6-amina             |
|    | 73 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3-cloro-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina     |
| 30 | 74 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(metiltio)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina              |
|    | 75 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(4-metilpiperazin-1-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina |
| 35 | 76 | (S)-1'-(5-((2,3-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                       |
|    | 77 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-(trifluorometil)piridin-3-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                        |
|    | 78 | (S)-1-(4-((3-amino-5-(1-amino-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona           |

|    |    |                                                                                                                                                |
|----|----|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 79 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-(ter-butil)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]tiofeno-5,4'-piperidin]-4-amina |
|    | 80 | ácido (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carboxílico         |
|    | 81 | (2R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-2-amina                          |
|    | 82 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-7-amina               |
|    | 83 | (S)-1'-(5-(quinolin-4-iltio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                       |
| 10 | 84 | (S)-1'-(6-amino-5-((2,3-diclorofenil)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                          |
|    | 85 | (S)-1'-(5-((3-cloro-2-(dimetilamino)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina              |
|    | 86 | (S)-1'-(5-(piridin-4-iltio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                        |
| 15 | 87 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                      |
|    | 88 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina                       |
|    | 89 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-(metilamino)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina        |
|    | 90 | dietil(S)-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)fosfonato       |
| 20 | 91 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina              |
|    | 92 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                      |
| 25 | 93 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                       |
|    | 94 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-(dimetilamino)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina      |
|    | 95 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina                |
| 30 | 96 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[furo[2,3-b]piridin-2,4'-piperidin]-3-amina                         |
|    | 97 | (S)-1'-(5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                              |

|    |     |                                                                                                                                                  |
|----|-----|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 98  | (S)-1'-(6-amino-5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
|    | 99  | (S)-1'-(5-((3-cloro-2-metoxipiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
|    | 100 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-metoxipiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                |
|    | 101 | (S)-1'-(5-((5-cloro-2-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
| 10 | 102 | (S)-1'-(6-amino-5-((5-cloro-2-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                |
|    | 103 | (S)-1-(4-((3-amino-5-(5-amino-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona |
| 15 | 104 | (S)-1'-(5-((2,3-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                             |
|    | 105 | (S)-1'-(6-amino-5-((2,3-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                     |
|    | 106 | (S)-1'-(5-((4-cloropiridin-3-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                 |
| 20 | 107 | (S)-1'-(6-amino-5-((4-cloropiridin-3-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                         |
|    | 108 | (S)-1'-(5-((3-aminopiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                 |
| 25 | 109 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-aminopiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                         |
|    | 110 | (S)-1'-(5-((3,5-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                             |
|    | 111 | (S)-1'-(6-amino-5-((3,5-dicloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                     |
| 30 | 112 | (S)-1'-(5-((2-amino-5-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                         |
|    | 113 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-5-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                 |
| 35 | 114 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-(trifluorometil)piridin-3-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina              |
|    | 115 | (S)-1'-(5-((3-cloro-2-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
|    | 116 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-cloro-2-fluoropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-                                                                          |

|    |     |                                                                                                                                             |
|----|-----|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|    |     | dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                                                                                  |
| 5  | 117 | (S)-3-((5-(5-amino-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)picolinonitrilo                            |
|    | 118 | (S)-3-((3-amino-5-(5-amino-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)picolinonitrilo                    |
|    | 119 | (S)-1'-(5-((2-cloro-5-(trifluorometil)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina         |
| 10 | 120 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-cloro-5-(trifluorometil)piridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina |
|    | 121 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                |
|    | 122 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
| 15 | 123 | 1'-(6-amino-5-((3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                        |
|    | 124 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                              |
| 20 | 125 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                                      |
|    | 126 | 1'-(6-amino-5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                       |
|    | 127 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                |
| 25 | 128 | 1'-(5-((3-amino-2-clorofenil)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina                               |
|    | 129 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-bromo-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                      |
| 30 | 130 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina         |
|    | 131 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-cloro-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina                 |
|    | 132 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina                                      |
| 35 | 133 | (S)-4-((5-(1-amino-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3-cloropiridin-2-ol                                     |
|    | 134 | (S)-4-((3-amino-5-(1-amino-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3-cloropiridin-2-ol                             |

|    |     |                                                                                                                                          |
|----|-----|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 135 | (S)-4-((5-(5-amino-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3-cloropiridin-2-ol                    |
|    | 136 | (S)-4-((3-amino-5-(5-amino-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3-cloropiridin-2-ol            |
|    | 137 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-ol                  |
|    | 138 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-ol                  |
| 10 | 139 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-metil-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-6,4'-piperidin]-5-amina     |
|    | 140 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[indolizin-2,4'-piperidin]-7(1H)-ona (2 mg)               |
| 15 | 141 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[indolizin-2,4'-piperidin]-5(1H)-ona                      |
|    | 142 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(1-imino-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina                           |
|    | 143 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(1-imino-5-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina                  |
| 20 | 144 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(4-imino-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]tiofeno-5,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina             |
|    | 145 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(1-bromo-4-imino-4H,6H-espiro[ciclopenta[c]tiofeno-5,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina          |
| 25 | 146 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(4-imino-4H,6H-espiro[ciclopenta[c]tiofeno-5,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina                  |
|    | 147 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(2-bromo-4-imino-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]tiofeno-5,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-amina     |
| 30 | 148 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-7-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                  |
|    | 149 | Oxima de (Z)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[indeno-2,4'-piperidin]-1(3H)-ona                        |
| 35 | 150 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2-metoxi-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina |
|    | 151 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina          |
|    | 152 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-                                    |

|    |     |                                                                                                                                       |
|----|-----|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|    |     | piperidin]-4-amina                                                                                                                    |
| 5  | 153 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina           |
|    | 154 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-4-amina                   |
|    | 155 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-6-amina       |
| 10 | 156 | (S)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[d]tiazol-5,4'-piperidin]-6-amina               |
|    | 157 | (S)-1'-(6-amino-5-((3-fluoro-1H-indol-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                         |
|    | 158 | (S)-1-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)etan-1-ona |
| 15 | 159 | (S)-1-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-il)etan-1-ona |
|    | 160 | (R)-1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1-metilspiro[indolina-2,4'-piperidin]-3-amina                               |
|    | 161 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina                        |
| 20 | 162 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3,4-dihidro-2H-espiro[naftaleno-1,4'-piperidin]-2-amina                 |
|    | 163 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-7,4'-piperidin]-6-amina          |
|    | 164 | 1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)tetrahidro-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-1'-amina             |
| 25 | 165 | (1'S)-1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)tetrahidro-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-1'-amina       |
|    | 166 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]furan-5,4'-piperidin]-4-amina            |
|    | 167 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]furan-5,4'-piperidin]-4-amina        |
| 30 | 168 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-5,4'-piperidin]-6-amina          |
|    | 169 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidroespiro[ciclopenta[b]furan-5,4'-piperidin]-4-amina               |
|    | 170 | (4R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidroespiro[ciclopenta[b]furan-5,4'-piperidin]-4-amina          |

|    |     |                                                                                                                                        |
|----|-----|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 171 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-2-amina                       |
|    | 172 | 1'-amino-1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)tetrahidro-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-3'-ona       |
|    | 173 | (1'S)-1'-amino-1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)tetrahidro-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-3'-one |
|    | 174 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.1.0]hexano-2,4'-piperidin]-3-amina                       |
| 10 | 175 | (3R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.1.0]hexano-2,4'-piperidin]-3-amina                  |
|    | 176 | 3-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)-6-(11-oxa-1,7-diazadispiro[2.0.5 <sup>4</sup> .3 <sup>3</sup> ]dodecan-7-il)pirazin-2-amina       |
| 15 | 177 | 1-(4-((3-amino-5-(2-aminoespiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona       |
|    | 178 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1-metilspiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-4-amina                |
|    | 179 | (4R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1-metilspiro[biciclo[3.1.0]hexano-3,4'-piperidin]-4-amina           |
| 20 | 180 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.2.0]heptano-3,4'-piperidin]-2-amina                      |
|    | 181 | (2R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[biciclo[3.2.0]heptano-3,4'-piperidin]-2-amina                 |
|    | 182 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidro-1H-espiro[pentalene-2,4'-piperidin]-1-amina                     |
| 25 | 183 | (1R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidro-1H-espiro[pentalene-2,4'-piperidin]-1-amina                |
|    | 184 | 1-(4-((3-amino-5-(2-amino-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-1'-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-difluoroindolin-1-il)etan-1-ona         |
| 30 | 185 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4-metoxi-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina                |
|    | 186 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4-metoxi-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina            |
| 35 | 187 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,5-dihidroespiro[ciclopenta[b]furan-6,4'-piperidin]-5-amina             |
|    | 188 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,5-dihidroespiro[ciclopenta[b]furan-6,4'-piperidin]-5-amina         |
|    | 189 | 1-(4-((3-amino-5-(11-oxa-1,7-diazadispiro[2.0.5 <sup>4</sup> .3 <sup>3</sup> ]dodecan-7-il)pirazin-2-il)tio)-3,3-                      |

|    |     |                                                                                                                                            |
|----|-----|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|    |     | difluoroindolin-1-il)etan-1-ona                                                                                                            |
| 5  | 190 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidroespiro[ciclopenta[b][1,4]dioxin-6,4'-piperidin]-5-amina              |
|    | 191 | (5S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)hexahidroespiro[ciclopenta[b][1,4]dioxin-6,4'-piperidin]-5-amina         |
|    | 192 | 6-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-5,4'-piperidin]-2(1H)-ona     |
| 10 | 193 | (R)-6-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[b]piridin-5,4'-piperidin]-2(1H)-ona |
|    | 194 | 2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidro-5H-espiro[indolizin-1,4'-piperidin]-5-ona                |
|    | 195 | (S)-2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidro-5H-espiro[indolizin-1,4'-piperidin]-5-ona            |
| 15 | 196 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[cromano-4,4'-piperidin]-3-amina                                        |
|    | 197 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)espiro[cromano-4,4'-piperidin]-3-amina                                    |
|    | 198 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                    |
| 20 | 199 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3,4-dihidro-1H-espiro[naftaleno-2,4'-piperidin]-1-amina                      |
|    | 200 | 1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-7',8'-dihidro-5'H-espiro[piperidin-4,6'-quinolin]-7'-amina                    |
|    | 201 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-5,4'-piperidin]-6-amina               |
| 25 | 202 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-5,4'-piperidin]-6-amina           |
|    | 203 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-3,4-dihidro-1H-espiro[naftaleno-2,4'-piperidin]-1-amina             |
|    | 204 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-3,4-dihidro-1H-espiro[naftaleno-2,4'-piperidin]-1-amina         |
| 30 | 205 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6-dimetoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                |
|    | 206 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,6-dimetoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina            |
|    | 207 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-ol                        |

|    |     |                                                                                                                                  |
|----|-----|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 208 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina          |
|    | 209 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4,6-dihidroespiro[ciclopenta[b]tiofeno-5,4'-piperidin]-4-amina     |
|    | 210 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carbonitrilo    |
|    | 211 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-4-metoxi-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina          |
| 10 | 212 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1,6-diamina               |
|    | 213 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-4-ol              |
|    | 214 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-cloro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina           |
| 15 | 215 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-bromo-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina           |
|    | 216 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2,5-diamina               |
|    | 217 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2,5-diamina           |
| 20 | 218 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina          |
|    | 219 | (R)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-metoxi-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina      |
|    | 220 | 1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-1'-amina                  |
| 25 | 221 | (S)-1-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1'H,3'H-espiro[piperidin-4,2'-pirrolizin]-1'-amina              |
|    | 222 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidroespiro[ciclopenta[c]piridin-6,4'-piperidin]-7-amina     |
|    | 223 | 2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-4-carboxamida     |
| 30 | 224 | (R)-2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-4-carboxamida |
|    | 225 | 2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-4-carbonitrilo    |
|    | 226 | (R)-2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-                              |

|    |     |                                                                                                                                                          |
|----|-----|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|    |     | 1,4'-piperidin]-4-carbonitrilo                                                                                                                           |
| 5  | 227 | N-(2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-4-il)acetamida                         |
|    | 228 | (R)-N-(2-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-4-il)acetamida                     |
|    | 229 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(pirrolidin-1-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                       |
| 10 | 230 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(pirrolidin-1-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                   |
|    | 231 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1,4-dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina     |
|    | 232 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1,4-dimetil-1H-1,2,3-triazol-5-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina |
| 15 | 233 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(metiltio)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                              |
|    | 234 | 2-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)propan-2-ol                       |
| 20 | 235 | (S)-2-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)propan-2-ol                   |
|    | 236 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(metilsulfonil)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                         |
|    | 237 | N-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)acetamida                         |
| 25 | 238 | (S)-N-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)acetamida                     |
|    | 239 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-carboxamida                             |
| 30 | 240 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(ciclopentyloxi)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                        |
|    | 241 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(ciclopentyloxi)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina                    |
|    | 242 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-3H-espiro[indolizin-2,4'-piperidin]-7(1H)-ona                                      |
| 35 | 243 | 1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-ol                             |
|    | 244 | (S)-1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5-fluoro-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-ol                         |

|    |     |                                                                                                                                         |
|----|-----|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5  | 245 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidro-1H-espiro[ciclopenta[f]indol-6,4'-piperidin]-7-amina          |
|    | 246 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidro-1H-espiro[ciclopenta[f]indol-6,4'-piperidin]-7-amina      |
|    | 247 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidro-1H-espiro[indeno[5,6-d]imidazol-6,4'-piperidin]-7-amina       |
|    | 248 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-5,7-dihidro-1H-espiro[indeno[5,6-d]imidazol-6,4'-piperidin]-7-amina   |
| 10 | 249 | 1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1H-tetrazol-5-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina     |
|    | 250 | (S)-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-6-(1H-tetrazol-5-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-1-amina |
| 15 | 251 | 1-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)-3-metilurea     |
|    | 252 | (S)-1-(1-amino-1'-(6-amino-5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-1,3-dihidroespiro[indeno-2,4'-piperidin]-6-il)-3-metilurea |
|    | 253 | 1'-(5-((2-amino-3-cloropiridin-4-il)tio)pirazin-2-il)-2,3-dihidroespiro[indeno-1,4'-piperidin]-2-amina                                  |

20 117. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende al menos un compuesto de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-116 y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.

118. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 117, caracterizada porque, el compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo en una relación en peso al excipiente dentro del intervalo de aproximadamente 0.0001 a aproximadamente 10.

119. Uso de una composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 117 o 118 para la preparación de un medicamento.

120. El uso de conformidad con la reivindicación 119, en donde el medicamento es para tratamiento o prevención de una enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2.

121. El uso de conformidad con la reivindicación 119 o 120, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es cáncer, metástasis de cáncer, enfermedad cardiovascular, un trastorno inmunológico, fibrosis, o un trastorno ocular.

122. El uso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 119-121, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es uno o más seleccionado de Síndrome de Noonan, Síndrome de Leopard, leucemias mielomonocíticas juveniles, neuroblastoma, melanoma, carcinoma de células escamosas de cabeza y cuello, leucemia mieloide aguda, cáncer de mama, tumor esofágico, cáncer de pulmón, cáncer de colon, cáncer de cabeza, carcinoma gástrico, linfoma, glioblastoma, cáncer gástrico, cáncer pancreático, y combinación de los mismos.

123. Uso de al menos un compuesto de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-116 para la preparación de un medicamento.

124. El uso de conformidad con la reivindicación 123, el medicamento es para tratamiento o prevención de una enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2.

5 125. El uso de conformidad con la reivindicación 123 o 124, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es cáncer, metástasis de cáncer, enfermedad cardiovascular, un trastorno inmunológico, fibrosis, o un trastorno ocular.

126. El uso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 123-125, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es uno o más seleccionado de Síndrome de Noonan, Síndrome de Leopard, leucemias mielomonocíticas juveniles, neuroblastoma, melanoma, carcinoma de células escamosas de cabeza y cuello, leucemia mieloide aguda, cáncer de mama, tumor esofágico, cáncer de pulmón, cáncer de colon, cáncer de cabeza, carcinoma gástrico, linfoma, glioblastoma, cáncer gástrico, cáncer pancreático, y combinación de los mismos.

10

127. Al menos un compuesto de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo como se define de conformidad con las reivindicaciones 1-116, la composición farmacéutica como se define en la reivindicación 117 o 118, caracterizado porque es para la preparación de un medicamento.

15

128. El uso de conformidad con la reivindicación 127, en donde, el medicamento es para tratamiento o prevención de una enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2.

129. El uso de conformidad con la reivindicación 127 o 128, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es cáncer, metástasis de cáncer, enfermedad cardiovascular, un trastorno inmunológico, fibrosis, o un trastorno ocular.

20

130. El uso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 127-129, en donde, la enfermedad o trastorno mediado por la actividad de SHP2 es uno o más seleccionado de Síndrome de Noonan, Síndrome de Leopard, leucemias mielomonocíticas juveniles, neuroblastoma, melanoma, carcinoma de células escamosas de cabeza y cuello, leucemia mieloide aguda, cáncer de mama, tumor esofágico, cáncer de pulmón, cáncer de colon, cáncer de cabeza, carcinoma gástrico, linfoma, glioblastoma, cáncer gástrico, cáncer pancreático, y combinación de los mismos.

25

131. Un método para tratar un paciente que tiene una afección que es mediada por la actividad de SHP2, el método caracterizado porque comprende administrar al paciente una cantidad terapéuticamente efectiva de al menos un compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-116, o la composición farmacéutica de la reivindicación 117 o 118.

30

132. El método de conformidad con la reivindicación 131, caracterizado porque la afección mediada por la actividad de SHP2 es cáncer, metástasis de cáncer, enfermedad cardiovascular, un trastorno inmunológico, fibrosis, o un trastorno ocular.

35

133. El método de conformidad con la reivindicación 131, caracterizado porque la afección mediada por la actividad de SHP2 es síndrome de Noonan, síndrome de Leopard, leucemias mielomonocíticas juveniles, cáncer de hígado, neuroblastoma, melanoma, carcinoma de células

escamosas de cabeza y cuello, leucemia mieloide aguda, cáncer de mama, cáncer de esófago, cáncer de pulmón, cáncer de colon, cáncer de cabeza, carcinoma gástrico, neuroblastoma, linfoma, glioblastoma, cáncer gástrico, cáncer pancreático, y combinación de los mismos.

134. Un método para tratar cáncer, caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de síndrome de Noonan, síndrome de Leopard, leucemias mielomonocíticas juveniles, cáncer de hígado, neuroblastoma, melanoma, carcinoma de células escamosas de cabeza y cuello, leucemia mieloide aguda, cáncer de mama, cáncer de esófago, cáncer de pulmón, cáncer de colon, cáncer de cabeza, carcinoma gástrico, neuroblastoma, linfoma, glioblastoma, cáncer gástrico, cáncer pancreático, y combinaciones de los mismo, que comprende administrar a un mamífero en necesidad de tal tratamiento una cantidad efectiva de al menos un compuesto de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-116, o la composición farmacéutica de la reivindicación 117 o 118.

15

20

25

30

35