

REIVINDICACIONES

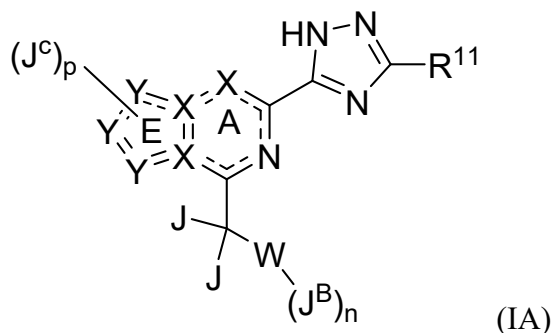
1. Un proceso para preparar un compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido, que comprende hacer reaccionar un compuesto amidrazona con un ácido carboxílico, un éster activado, un tioéster, un haluro de ácido, un haluro de tioacilo o un anhídrido de ácido en presencia de una base; donde si se usa un ácido carboxílico, también está presente un agente activante, y donde:

(i) el compuesto amidrazona comprende una amidrazona unida a un arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido;

(ii) el sustituyente en la posición 3 del compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido es el arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido unido a la amidrazona; y

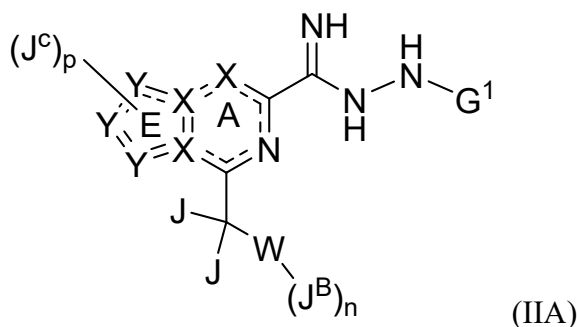
(iii) el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido puede estar opcionalmente sustituido en la posición 5.

2. El proceso de la reivindicación 1, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido se representa por medio de la Fórmula IA:



o una sal del mismo, y

donde el proceso comprende hacer reaccionar el compuesto amidrazona representado por la Fórmula IIA:



o una sal del mismo,

con $R^{11}C(O)OH$, $R^{11}C(O)X'$, $R^{11}C(S)X'$, $R^{11}C(O)OE'$, $R^{11}C(O)SR'$, o $R^{11}C(O)O''$, donde si se usa $R^{11}C(O)OH$, también está presente un agente activante,

donde:

los anillos E y A forman el núcleo de la molécula y son aromáticos; cada instancia de X e Y se selecciona en forma independiente entre N, NRⁿ y C; donde un máximo de 4 instancias de X e Y son simultáneamente N y Rⁿ es H o C₁₋₆alquilo;

5 W o bien

i) está ausente, donde J^B se conecta directamente al átomo de carbono que tiene dos grupos J, cada J es en forma independiente hidrógeno o metilo, n es 1 y J^B es una cadena C₁₋₇ alquilo opcionalmente sustituida con hasta 9 instancias de flúor; o bien

10 ii) un anillo B que es un fenilo, un anillo C₃₋₇ cicloalquilo o un anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno en el anillo;

donde si el anillo B es fenilo o anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros; cada J es en forma independiente hidrógeno o metilo; n es un entero seleccionado entre 0 y 3; y cada J^B se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, C₁₋₆ alifático, -OR^B y un anillo C₃₋₈ cicloalifático; y

15 donde si el anillo B es el anillo C₃₋₇ cicloalquilo; cada J es hidrógeno; n es un entero seleccionado entre 0 y 3 y cada J^B se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, C₁₋₆ alifático y -OR^{B1};

20 donde cada J^B que es un C₁₋₆ alifático y cada J^B que es un anillo C₃₋₈ cicloalifático está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R³;

cada R^B es en forma independiente un C₁₋₆ alifático o un anillo C₃₋₈ cicloalifático; dicho R^B está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R^{3a};

25 cada R^{B1} se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, C₁₋₆ alifático y un anillo C₃₋₈ cicloalifático; donde cada C₁₋₆ alifático y cada anillo C₃₋₈ cicloalifático está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R^{3b};

cada R³, R^{3a} y R^{3b} se selecciona en forma independiente en cada instancia entre halo, -CN, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ haloalquilo, -O(C₁₋₄ alquilo) y -O(C₁₋₄ haloalquilo);

30 p es un entero seleccionado entre 1, 2 o 3;

cada J^C se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, halo, C₁₋₄ alifático, C₁₋₄ alcoxi y -CN; donde cada C₁₋₄ alifático y C₁₋₄ alcoxi está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalcoxi, -OH o halo

R^{11} es H, $-NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)R^{15a}$, $-CN$, C_{2-6} alquenoilo
 opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-2 instancias de R^{b2} , C_{2-6}
 alquenoilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-2 instancias de R^{b2} ;
 C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de
 R^{15} , C_{1-6} alcoxi opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-5 instancias
 de R^{15} , fenilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de
 R^{15} , heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido en forma independiente
 con 0-3 instancias de R^{15} , C_{3-8} cicloalquilo opcionalmente sustituido en forma
 independiente con 0-3 instancias de R^{15} o heterociclilo de 3-8 miembros
 opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{15} ; donde
 cada heteroarilo de 5 o 6 miembros y cada heterociclilo de 3-8 miembros contiene
 hasta 3 heteroátomos en el anillo seleccionados en forma independiente entre N, O y
 S;

R^{15} es halo, $-OR^{b2}$, $-SR^{b2}$, $-NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)R^{b2}$, $-C(O)NR^{a2}R^{b2}$, $-$
 $NR^{b2}C(O)OR^{b2}$, $-OC(O)NR^{a2}R^{b2}$, C_{2-4} alquenoxi, C_{3-8} cicloalquilo opcionalmente
 sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{18} , fenilo opcionalmente
 sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{18} , heteroarilo de 5 o 6
 miembros opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{18}
 o heterociclilo de 3-10 miembros opcionalmente sustituido en forma independiente
 con 0-3 instancias de R^{18} ; donde cada anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros y cada
 heterociclilo de 3-10 miembros contiene hasta 3 heteroátomos en el anillo
 seleccionados en forma independiente entre N, O y S;

R^{15a} es C_{3-8} cicloalquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con
 0-3 instancias de R^{18} , fenilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3
 instancias de R^{18} , heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido en forma
 independiente con 0-3 instancias de R^{18} o heterociclilo de 3-10 miembros
 opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{18} ; donde
 cada anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros y cada heterociclilo de 3-10 miembros
 contiene hasta 3 heteroátomos en el anillo seleccionados en forma independiente entre
 N, O y S;

cada R^{18} se selecciona en forma independiente entre halo, hidroxilo, C_{1-6}
 alquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalquilo y fenilo;

R^{a2} es hidrógeno, $-C(O)R^{b2}$, C_{1-6} alquilo o C_{1-6} haloalquilo;

R^{b2} es hidrógeno, C_{1-6} alquilo o C_{1-6} haloalquilo;

X' es un haluro;

OE' es un grupo saliente éster activado;

SR' es un grupo saliente tioéster;

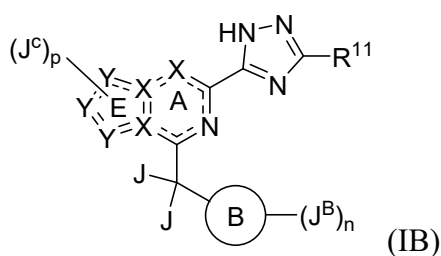
R'' es C(O)R¹¹, C(O)R^{11a}, N=CR^{11b}R^{11c}, P(O)(OH)₂, o PH(O)OH;

5 R^{11a} es C₁₋₆alquilo;

R^{11b} y R^{11c} son en forma independiente entre sí C₁₋₆alquilo o fenilo, o R^{11b} y R^{11c} junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un C₄₋₆cicloalquilo; y

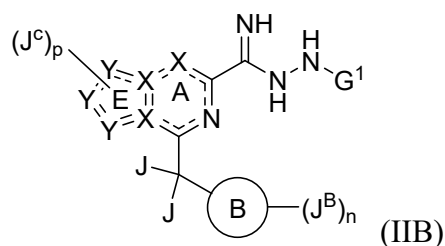
G¹ es un grupo protector de amidrazona.

- 10 3. El proceso de la reivindicación 2, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de Fórmula IA o una sal del mismo es de la Fórmula IB



o una sal del mismo, y

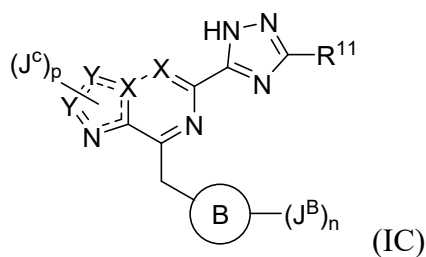
el compuesto amidrazona de Fórmula IIA es de la Fórmula IIB



15

o una sal del mismo.

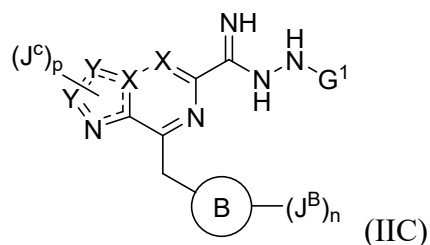
4. El proceso de la reivindicación 3, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de Fórmula IB o una sal del mismo es de la Fórmula IC



20

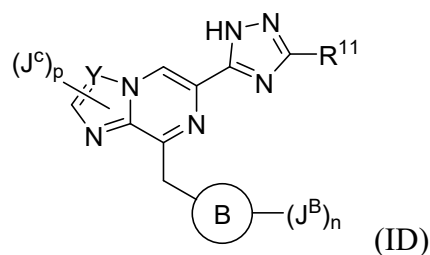
o una sal del mismo,

y el compuesto amidrazona de Fórmula IIB es de la Fórmula IIC



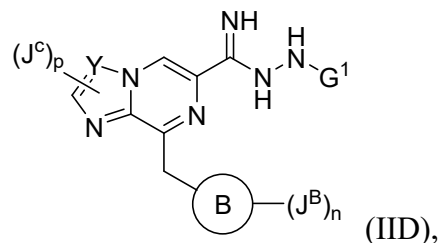
o una sal del mismo.

5. El proceso de la reivindicación 4, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de
 5 Fórmula IC o una sal del mismo es de la Fórmula ID



o una sal del mismo, y

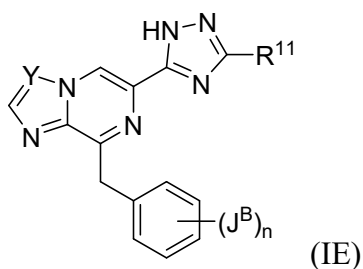
el compuesto amidrazona de Fórmula IIC es de la Fórmula IID



o una sal del mismo,

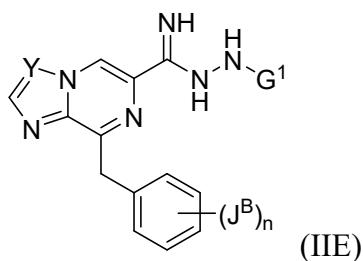
donde Y es N o C.

6. El proceso de la reivindicación 5, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de
 15 Fórmula ID o una sal del mismo es de la Fórmula IE



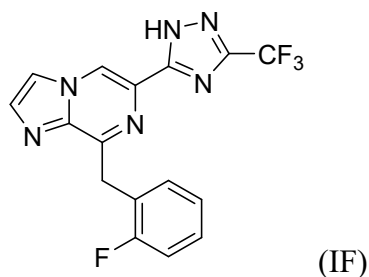
o una sal del mismo, y

el compuesto amidrazona de Fórmula IID es de la Fórmula IIE



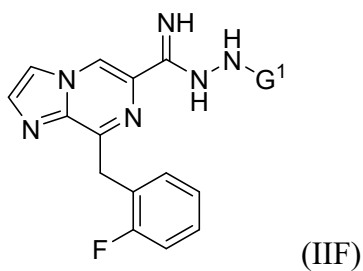
o una sal del mismo.

7. El proceso de la reivindicación 6, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de
5 Fórmula IE o una sal del mismo es de la Fórmula IF:



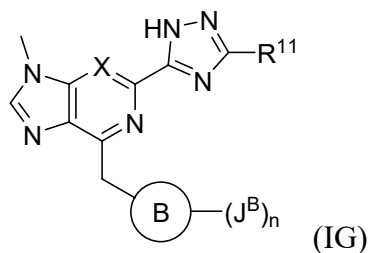
o una sal del mismo,

el compuesto amidrazona de Fórmula IIE es de la Fórmula IIF



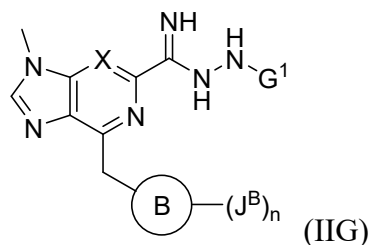
- 10 o una sal del mismo.

8. El proceso de la reivindicación 4, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de
Fórmula IC o una sal del mismo es de la Fórmula IG



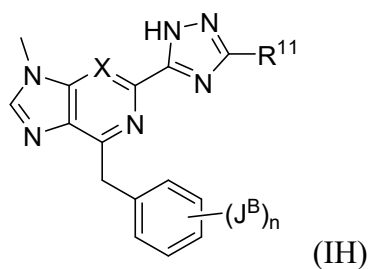
- 15 o una sal del mismo, y

el compuesto amidrazona de Fórmula IIC es de la Fórmula IIG

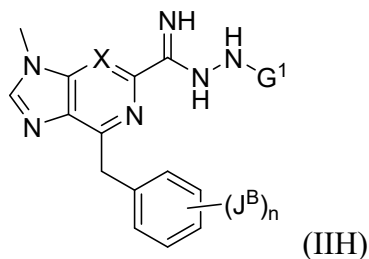


o una sal del mismo,
donde X es C o N.

- 5 9. El proceso de la reivindicación 8, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de Fórmula IG o una sal del mismo es de la Fórmula IH

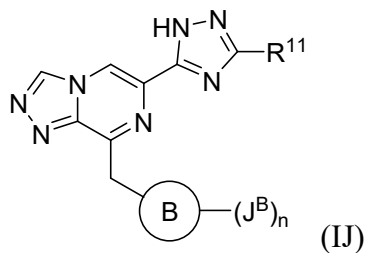


o una sal del mismo, y
el compuesto amidrazona de Fórmula IIG es de la Fórmula IIH

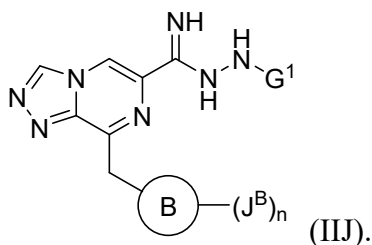


o una sal del mismo.

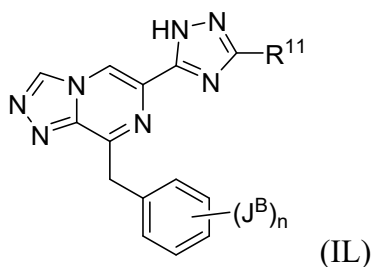
10. El proceso de la reivindicación 4, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de Fórmula IC o una sal del mismo es de la Fórmula IJ



o una sal del mismo, y
el compuesto amidrazona de Fórmula IIC es de la Fórmula IIJ

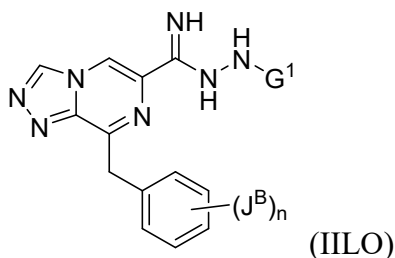


11. El proceso de la reivindicación 10, donde el compuesto 1,2,4-triazol 3-sustituido de Fórmula IJ o una sal del mismo es de la Fórmula IL



o una sal del mismo, y

el compuesto amidrazona de Fórmula IIJ es de la Fórmula IIL



o una sal del mismo.

12. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 2-5, 8 y 10, donde
el anillo B es fenilo o un anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno en el anillo.

13. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 2-12, donde:

J^B es en forma independiente halo o C₁₋₆ alquilo opcionalmente sustituido con hasta 3 instancias de halo;

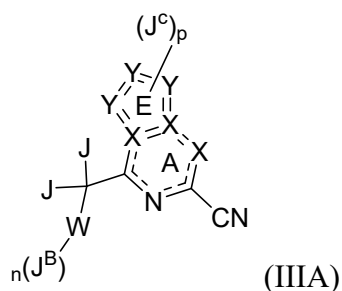
cada J^C, cuando está presente, se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, halo, -CN, y C₁₋₄ alquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de halo;

p, cuando está presente, es 1 o 2;

- R^{11} es H, $-NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)R^{15a}$, $-CN$, C_{1-6} alquilo
 opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{15} , C_{2-6}
 alquenilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-2 instancias de R^{b2} ,
 C_{2-6} alquinilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-2 instancias de
 R^{b2} ; C_{1-6} alcoxi opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-5 instancias
 de R^{15} , fenilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de
 R^{15} , heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido en forma independiente
 con 0-3 instancias de R^{15} , C_{3-8} cicloalquilo opcionalmente sustituido en forma
 independiente con 0-3 instancias de R^{15} o heterociclilo de 3-8 miembros
 opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de R^{15} ; donde
 cada heteroarilo de 5 o 6 miembros y cada heterociclilo de 3-8 miembros contiene
 hasta 3 heteroátomos en el anillo seleccionados en forma independiente entre N, O y
 S;
- R^{15} es halo, $-OR^{b2}$, $-SR^{b2}$, $-NR^{a2}R^{b2}$, $-C(O)R^{b2}$, $-C(O)NR^{a2}R^{b2}$, $-$
 $NR^{b2}C(O)OR^{b2}$, $-OC(O)NR^{a2}R^{b2}$, C_{2-4} alquenoxi, C_{3-8} cicloalquilo, fenilo, heteroarilo
 de 5 o 6 miembros, o heterociclilo de 3-10 miembros; donde cada anillo heteroarilo de
 5 o 6 miembros y cada heterociclilo de 3-10 miembros contiene hasta 3 heteroátomos
 en el anillo seleccionados en forma independiente entre N, O y S;
- R^{15a} es C_{3-8} cicloalquilo, fenilo, heterociclilo de 5-6 miembros o de 3-10
 miembros; donde cada anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros y cada heterociclilo de 3-
 10 miembros contiene hasta 3 heteroátomos en el anillo seleccionados en forma
 independiente entre N, O y S; y
- R^{a2} es hidrógeno, C_{1-6} alquilo o C_{1-6} haloalquilo; y
 R^{b2} es hidrógeno, C_{1-6} alquilo o C_{1-6} haloalquilo.
14. El proceso de la reivindicación 13, donde R^{11} es $-NR^{a2}R^{b2}$, C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de halo, heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de halo, o C_{3-8} cicloalquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de halo.
 15. El proceso de la reivindicación 14, donde R^{11} es C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con 0-3 instancias de halo.

16. El proceso de la reivindicación 14, donde R^{11} es CF_3 .
17. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 2-16, donde G^1 es un grupo protector de amino carbamato, grupo protector de amino amida, o grupo protector de amino sulfonilo.
18. El proceso de la reivindicación 17, donde G^1 es tert-butoxicarbonilo (Boc), 2,2,2-tricloroetiloxycarbonilo (Troc), benciloxycarbonilo (Cbz), 9-Fluorenilmetoxycarbonilo (Fmoc), metilsulfonilo, p-toluensulfonilo (Tos), 4-nitrobencensulfonilo (NOSilo), 2-nitrobencensulfonilo, p-bromobencensulfonilo (Brosilo), trifluoroacetilo, acetilo o benzoilo.
19. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-18, donde el proceso comprende hacer reaccionar la amidrazona con $R^{11}C(O)OE'$, donde $-OE'$ es $-O-(C_{1-6}alquilo)$, $-O-(C_{1-6}haloalquilo)$, $-O-(fenilo)$, $-O-(heteroarilo)$, $-O-(heterociclilo)$, donde fenilo, heteroarilo, y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con entre 1 y 6 grupos seleccionados en forma independiente entre halo, ciano, nitro, oxo, SO_3H , y $SO_3C_{1-6}alquilo$.
20. El proceso de la reivindicación 19, donde $-OE'$ es $-O-(C_{1-6}haloalquilo)$.
21. El proceso de la reivindicación 19, donde $-OE'$ es $-O-(CH_2CF_3)$, $-O-(nitrofenilo)$ (por ejemplo, 2 o 4-nitrofenilo), $-O-(dinitrofenilo)$ (por ejemplo 2,4-dinitrofeniléster), $-O-(triclorofenilo)$ (por ejemplo, 2,4,5-triclorofenilo), $-O-(pentafluorofenilo)$, $-O-(sulfo-tetrafluorofenilo)$ (por ejemplo, 4-sulfo-2,3,5,6-tetrafluorofenilo), $-O-(succinimidilo)$, $-O-(benzotriazol)$, $-O-(7-azabenzotriazol)$, $-O-(ftalimidilo)$, $-O-(5-norborneno-endo-2,3-dicarboxiimida)$, o $-O-(sulfo-succinimidilo)$.
22. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-18, donde el proceso comprende hacer reaccionar la amidrazona con $R^{11}C(O)O''$, donde R'' es $N=CR^{11b}R^{11c}$, $P(O)(OH)_2$, o $PH(O)OH$.
23. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-18, donde el proceso comprende hacer reaccionar la amidrazona con $R^{11}C(O)OH$ en presencia de un agente activante.

24. El proceso de la reivindicación 23, donde el agente activante es una carbodiimida, un uronio, un fosfonio, 2-alquil-1-alquilcarbonil-1,2-dihidroquinolina, 2-alcóxi-1-alcóxicarbonil-1,2-dihidroquinolina, cianohidroxiiminoacetato de etilo (Oxime®), o cloroformiato de alquilo.
- 5
25. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-18, donde el proceso comprende hacer reaccionar la amidrazona con $R^{11}C(O)SR'$, donde $-SR'$ es $-S-(arilo)$, $-S-(C_{1-20}alquilo)$, o $-S-(heteroarilo)$.
- 10
26. El proceso de la reivindicación 25, donde $-SR'$ es $-S-(etilo)$, $-S-(dodecilo)$, $-S-(p-clorofenilo)$, o $-S-(2-benzotiazolilo)$.
27. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-26, donde la base se selecciona entre el grupo que consiste en trialkilamina, un fosfazeno, 1,8-
- 15
- diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN), guanidina, 1,1,3,3-tetrametilguanidina, piridina opcionalmente sustituida o 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano (DABCO).
28. El proceso de la reivindicación 27, donde la base es 4-dimetilaminopiridina (DMAP).
- 20
29. El proceso de la reivindicación 27, donde la base es DABCO.
30. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 1-29, donde el proceso comprende además retirar el grupo protector de amidrazona de ser necesario después de la
- 25
- reacción del compuesto amidrazona con un ácido carboxílico, haluro de ácido, haluro de tioacilo, éster activado, tioéster o anhídrido de ácido haciendo reaccionar el producto de la reacción con un agente de desprotección de amidrazona.
31. El proceso de la reivindicación 2, donde el compuesto amidrazona de Fórmula IIA o una sal del mismo se prepara por medio de un proceso que comprende hacer
- 30
- reaccionar un compuesto de Fórmula IIIA:



o una sal del mismo,

en primer lugar con una segunda base y en segundo lugar con un compuesto de Fórmula H_2NNHG^1 en un solvente de reacción.

5

32. El proceso de la reivindicación 31, donde el solvente de reacción es un alcohol.

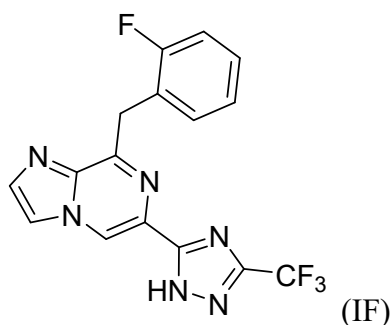
33. El proceso de la reivindicación 32, donde el solvente de reacción es MeOH.

10 34. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 31-33, donde la segunda base es NaOMe.

35. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 31-34, donde el compuesto de Fórmula H_2NNHG^1 es $H_2NNHC(O)OC(CH_3)_3$, $H_2NNHC(O)OCH_2CCl_3$,

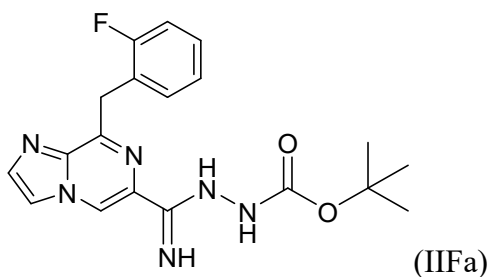
15 $H_2NNHC(O)Obencilo$, $H_2NNHC(O)OCH_2(9\text{-fluorenilo})$, $NH_2NHSO_2CH_3$, $NH_2NHSO_2(p\text{-tolueno})$, $NH_2NHSO_2(4\text{-nitrofenilo})$, $NH_2NHSO_2(2\text{-nitrofenilo})$, $NH_2NHSO_2(4\text{-bromofenilo})$, $NH_2NHC(O)CF_3$, $H_2NNHC(O)fenilo$ o $H_2NNHC(O)CH_3$.

20 36. El proceso de la reivindicación 1, donde el compuesto 1,2,4-triazol se representa por medio de la Fórmula IF



o una sal del mismo; y

donde el proceso que comprende hacer reaccionar una amidrazona de Fórmula IIFa:



o una sal del mismo, con $\text{CF}_3\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$ en presencia de una base.

37. El proceso de la reivindicación 36, donde la base es DABCO.

5

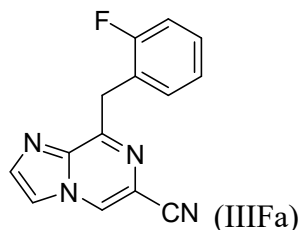
38. El proceso de la reivindicación 36 o 37, donde el proceso comprende además purificar el compuesto 1,2,4-triazol de Fórmula IF por cristalización.

39. El proceso de la reivindicación 38, donde la cristalización se realiza agregando n-heptano a la mezcla de reacción una vez completa la reacción entre el compuesto amidrazona de Fórmula IIFa y $\text{CF}_3\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$.

10

40. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 36-39, donde el compuesto amidrazona de Fórmula IIFa o una sal del mismo se prepara por medio de un proceso que comprende el paso de hacer reaccionar un compuesto de Fórmula IIIFa:

15



o una sal del mismo,

en primer lugar con una segunda base y en segundo lugar con $\text{H}_2\text{NNHC}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$ en un solvente de reacción.

20

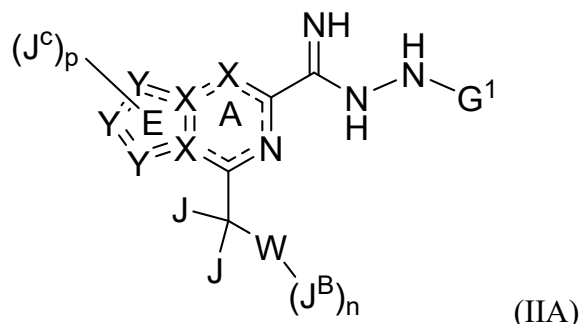
41. El proceso de la reivindicación 40, donde el solvente de reacción es un alcohol.

42. El proceso de la reivindicación 41, donde el solvente de reacción es MeOH.

43. El proceso de cualquiera de las reivindicaciones 40-42, donde la segunda base es NaOMe.

25

44. Un compuesto representado por la Fórmula IIA:



o una sal del mismo, donde:

- 5 los anillos E y A forman el núcleo de la molécula y son aromáticos; cada instancia de X e Y se selecciona en forma independiente entre N, NRⁿ y C; donde un máximo de 4 instancias de X e Y son simultáneamente N y Rⁿ es H o C₁₋₆alquilo;
- W o bien
- 10 i) está ausente, donde J^B se conecta directamente al átomo de carbono que tiene dos grupos J, cada J es en forma independiente hidrógeno o metilo, n es 1 y J^B es una cadena C₁₋₇ alquilo opcionalmente sustituida con hasta 9 instancias de flúor; o bien
- 15 ii) un anillo B que es un fenilo, un anillo C₃₋₇ cicloalquilo o un anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno en el anillo;
- donde si el anillo B es fenilo o anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros; cada J es en forma independiente hidrógeno o metilo; n es un entero seleccionado entre 0 y 3; y cada J^B se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, C₁₋₆ alifático, -OR^B y un anillo C₃₋₈ cicloalifático; y
- 20 donde si el anillo B es el anillo C₃₋₇ cicloalquilo; cada J es hidrógeno; n es un entero seleccionado entre 0 y 3 y cada J^B se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, C₁₋₆ alifático y -OR^{B1};
- donde cada J^B que es un C₁₋₆ alifático y cada J^B que es un anillo C₃₋₈ cicloalifático está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R³;
- 25 cada R^B es en forma independiente un C₁₋₆ alifático o un anillo C₃₋₈ cicloalifático; dicho R^B está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R^{3a};

cada R^{B1} se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, C_{1-6} alifático y un anillo C_{3-8} cicloalifático; donde cada C_{1-6} alifático y cada anillo C_{3-8} cicloalifático está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de R^{3b} ;

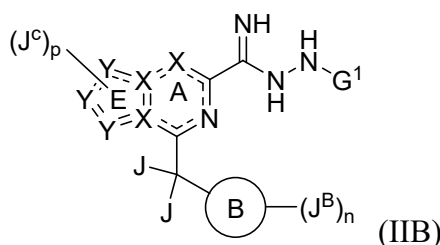
cada R^3 , R^{3a} y R^{3b} se selecciona en forma independiente en cada instancia entre halo, $-CN$, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} haloalquilo, $-O(C_{1-4}$ alquilo) y $-O(C_{1-4}$ haloalquilo);

p es un entero seleccionado entre 1, 2 o 3;

cada J^C se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, halo, C_{1-4} alifático, C_{1-4} alcoxi y $-CN$; donde cada C_{1-4} alifático y C_{1-4} alcoxi está opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalcoxi, $-OH$ o halo; y

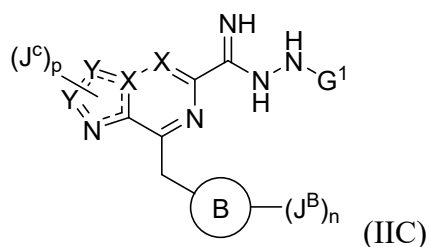
G^1 es un grupo protector de amidrazona.

45. El compuesto de la reivindicación 43, donde el compuesto de Fórmula IIA es de la Fórmula IIB



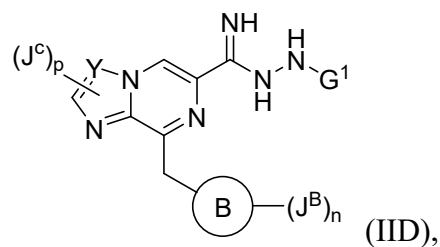
o una sal del mismo.

46. El compuesto de la reivindicación 45, donde el compuesto de Fórmula IIB es de la Fórmula IIC



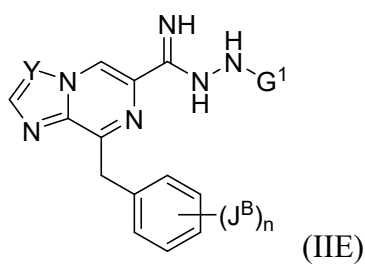
o una sal del mismo.

47. El compuesto de la reivindicación 46, donde el compuesto de Fórmula IIC es de la Fórmula IID



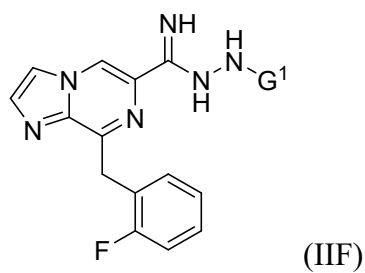
o una sal del mismo; y
donde Y es N o C.

- 5 48. El compuesto de la reivindicación 47, donde el compuesto de Fórmula IID es de la Fórmula IIE



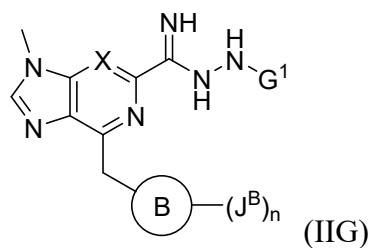
o una sal del mismo.

- 10 49. El compuesto de la reivindicación 48, donde el compuesto de Fórmula IIE es de la Fórmula IIF



o una sal del mismo.

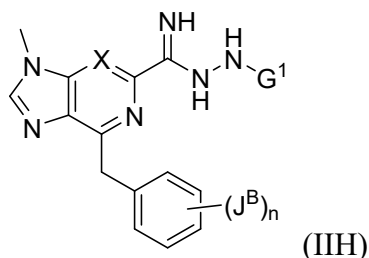
- 15 50. El compuesto de la reivindicación 46, donde el compuesto de Fórmula IIC es de la Fórmula IIG



o una sal del mismo; y

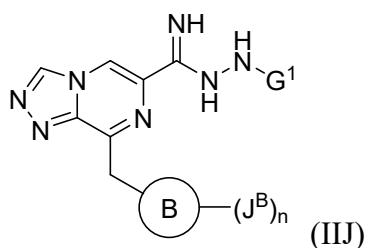
donde X es C o N.

51. El compuesto de la reivindicación 50, donde el compuesto de Fórmula IIG es de la Fórmula IIH



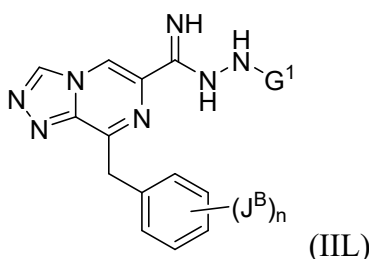
o una sal del mismo.

52. El compuesto de la reivindicación 46, donde el compuesto de Fórmula IIC es de la Fórmula IIJ



o una sal del mismo.

53. El compuesto de la reivindicación 52, donde el compuesto de Fórmula IIJ es de la Fórmula IIL



o una sal del mismo.

54. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 44-47, 50 y 52, donde
el anillo B es fenilo o un anillo heteroarilo de 5 o 6 miembros, que contiene 1
o 2 átomos de nitrógeno en el anillo.

55. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 44-54, donde:

J^B es en forma independiente halo o C₁₋₆ alquilo opcionalmente sustituido con hasta 3 instancias de halo;

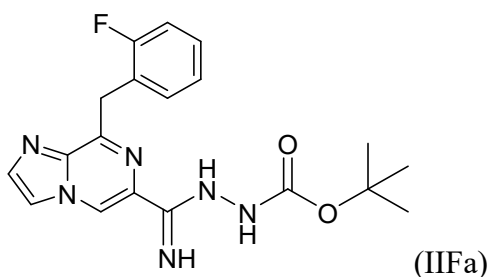
5 cada J^C, cuando está presente, se selecciona en forma independiente entre hidrógeno, halo, -CN, y C₁₋₄ alquilo opcionalmente sustituido en forma independiente con hasta 3 instancias de halo;

p, cuando está presente, es 1 o 2.

56. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 44-55, donde G¹ es un grupo protector de amino carbamato, grupo protector de amino amida, o grupo protector de amino sulfonilo.

57. El compuesto de la reivindicación 56, donde G¹ es tert-butoxicarbonilo (Boc), 2,2,2-tricloroetiloxicarbonilo (Troc), benciloxicarbonilo (Z), 9-Fluorenilmetoxicarbonilo (Fmoc), metilsulfonilo, p-toluensulfonilo (Tos), 4-nitrobencensulfonilo (NOSilo), 2-nitrobencensulfonilo, p-bromobencensulfonilo (Brosilo), trifluoroacetilo, acetilo o benzoilo.

58. El compuesto de la reivindicación 44, donde el compuesto se representa por medio de la Fórmula IIFa:



o una sal del mismo.