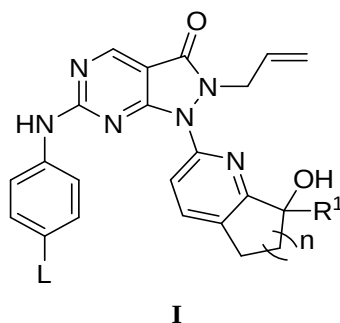


Reivindicaciones

1. Un compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, un solvato del mismo o un solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo;



en donde, R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es - (CH₂)_m-R², C₃-C₂₀ cicloalquilo, "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido con uno o dos R³", C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴";

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

R², R³ y R⁴ son independientemente -CN, -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³, - (C = NR²⁻⁴) R²⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁶, -O²⁻⁷, -SR²⁻⁸ o "C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente hidrógeno, - (C = O) R²⁻¹⁻¹, -S (= O)₂R²⁻¹⁻², - (C = NR²⁻¹⁻³) R²⁻¹⁻⁴ o "C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻¹⁻⁵;

o, R²⁻¹ y R²⁻² junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar un C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻¹⁻⁶; uno o más metilenos en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o -N (R²⁻¹⁻⁷) -; R²⁻¹⁻⁷ es independientemente C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻¹⁻¹, R²⁻¹⁻² y R²⁻¹⁻⁴ son independientemente hidrógeno, -NR²⁻¹⁻¹⁻¹R²⁻¹⁻¹⁻² o "C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻¹⁻¹⁻³;

R²⁻¹⁻¹⁻¹ y R²⁻¹⁻¹⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻¹⁻¹⁻³ es independientemente halógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, amino, C₁-C₇ alquilo, C₁-C₇ alcoxi, C₁-C₇ alquiltio, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻¹⁻³ se selecciona de hidrógeno, ciano, -OH, C₁-C₇ alquilo o C₁-C₇ alcoxi;

R²⁻¹⁻⁵ y R²⁻¹⁻⁶ son independientemente ciano, halógeno, -NR²⁻¹⁻⁵⁻¹R²⁻¹⁻⁵⁻², -OR²⁻¹⁻⁵⁻³, -SR²⁻¹⁻⁵⁻⁴ o C₁-C₇ alquilo;

$R^{2-1-5-1}$, $R^{2-1-5-2}$, $R^{2-1-5-3}$ y $R^{2-1-5-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-3} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-3-1}R^{2-3-2}$, $-OR^{2-3-3}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-3-4} ;

R^{2-3-1} y R^{2-3-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

o, R^{2-3-1} y R^{2-3-2} junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar una C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres $R^{2-3-1-1}$; uno o más metilenos en el C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o $-N(R^{2-3-1-2})-$; $R^{2-3-1-2}$ es independientemente C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

$R^{2-3-1-1}$ es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-3-1-1-1}R^{2-3-1-1-2}$, $-OR^{2-3-1-1-3}$, $-SR^{2-3-1-1-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-3-1-1-1}$, $R^{2-3-1-1-2}$, $R^{2-3-1-1-3}$ y $R^{2-3-1-1-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-3-3} es independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-3-4} es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-3-4-1}R^{2-3-4-2}$, $-OR^{2-3-4-3}$, $-SR^{2-3-4-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-3-4-1}$, $R^{2-3-4-2}$, $R^{2-3-4-3}$ y $R^{2-3-4-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-4} es independientemente hidrógeno, $-CN$, $-OR^{2-4-1}$ o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-4-1} es independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-5} es independiente $-NR^{2-5-1}R^{2-5-2}$, $-OR^{2-5-3}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-5-4} ;

R^{2-5-1} y R^{2-5-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

o, R^{2-5-1} y R^{2-5-2} junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar una C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres $R^{2-5-1-1}$; uno o más metilenos en el C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o $-N(R^{2-5-1-2})-$; $R^{2-5-1-2}$ es independientemente C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

$R^{2-5-1-1}$ es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-5-1-1-1}R^{2-5-1-1-2}$, $-OR^{2-5-1-1-3}$, $-SR^{2-5-1-1-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-5-1-1-1}$, $R^{2-5-1-1-2}$, $R^{2-5-1-1-3}$ y $R^{2-5-1-1-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-5-3} es independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-5-4} es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-5-4-1}R^{2-5-4-2}$, $-OR^{2-5-4-3}$, $-SR^{2-5-4-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-5-4-1}$, $R^{2-5-4-2}$, $R^{2-5-4-3}$ y $R^{2-5-4-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-6} es independiente $-NR^{2-6-1}R^{2-6-2}$, $-OR^{2-6-3}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-6-4} ;

R^{2-6-1} y R^{2-6-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

o, R^{2-6-1} y R^{2-6-2} junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar una C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres $R^{2-6-1-1}$; uno o más metilenos en el C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o $-N(R^{2-6-1-2})-$; $R^{2-6-1-2}$ es independientemente C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

$R^{2-6-1-1}$ es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-6-1-1-1}R^{2-6-1-1-2}$, $-OR^{2-6-1-1-3}$, $-SR^{2-6-1-1-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-6-1-1-1}$, $R^{2-6-1-1-2}$, $R^{2-6-1-1-3}$ y $R^{2-6-1-1-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-6-3} es independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-6-4} es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-6-4-1}R^{2-6-4-2}$, $-OR^{2-6-4-3}$, $-SR^{2-6-4-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-6-4-1}$, $R^{2-6-4-2}$, $R^{2-6-4-3}$ y $R^{2-6-4-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-7} y R^{2-8} son independientemente hidrógeno o " C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-7-1} ;

R^{2-7-1} es independientemente ciano, halógeno, $-NR^{2-7-1-1}R^{2-7-1-2}$, $-OR^{2-7-1-3}$, $-SR^{2-7-1-4}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-7-1-1}$, $R^{2-7-1-2}$, $R^{2-7-1-3}$ y $R^{2-7-1-4}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-9} es independiente $-OR^{2-9-1}$, $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, $-SR^{2-9-4}$, halógeno, ciano, $-(C=O)R^{2-9-5}$, $-(C=NR^{2-9-6})R^{2-9-7}$, $-S(=O)_2R^{2-9-8}$, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-9-1} , R^{2-9-2} , R^{2-9-3} y R^{2-9-4} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

R^{2-9-5} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-9-5-1}R^{2-9-5-2}$, $-OR^{2-9-5-3}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres $R^{2-9-5-4}$;

$R^{2-9-5-1}$, $R^{2-9-5-2}$ y $R^{2-9-5-3}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_2-C_7 alqueno, C_2-C_7 alquino, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo, C_6-C_{10} arilo o C_1-C_7 heteroarilo;

$R^{2-9-5-4}$ es independientemente hidrógeno, halógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, amino, C_1-C_7 alquilo,

C₁-C₇ alcoxi, C₁-C₇ alquiltio, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁶ es independientemente hidrógeno, -CN, -OR²⁻⁹⁻⁶⁻¹ o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁶⁻¹ es independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁷ es independiente -NR²⁻⁹⁻⁷⁻¹R²⁻⁹⁻⁷⁻², -OR²⁻⁹⁻⁷⁻³, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁷⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁷⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

o, R²⁻⁹⁻⁷⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁷⁻² junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar un C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹⁻⁷⁻¹⁻¹; uno o más metilenos en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o -N (R²⁻⁹⁻⁷⁻¹⁻²) -; R²⁻⁹⁻⁷⁻¹⁻² es independientemente C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻⁷⁻¹⁻¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, amino, C₁-C₇ alquilo, C₁-C₇ alcoxi, C₁-C₇ alquiltio, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁷⁻³ es independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁸ es independiente -NR²⁻⁹⁻⁸⁻¹R²⁻⁹⁻⁸⁻², -OR²⁻⁹⁻⁸⁻³, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁸⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁸⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

o, R²⁻⁹⁻⁸⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁸⁻² junto con el átomo de nitrógeno se unen para formar un C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹⁻⁸⁻¹⁻¹; uno o más metilenos en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcional e independientemente sustituido con un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, sulfinilo, sulfonilo, carbonilo, vinilideno o -N (R²⁻⁹⁻⁸⁻¹⁻²) -; R²⁻⁹⁻⁸⁻¹⁻² es independientemente C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻⁸⁻¹⁻¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, mercapto, ciano, amino, C₁-C₇ alquilo, C₁-C₇ alcoxi, C₁-C₇ alquiltio, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

R²⁻⁹⁻⁸⁻³ es independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₂-C₇ alquenilo, C₂-C₇ alquinilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₆-C₁₀ arilo o C₁-C₇ heteroarilo;

en cualquiera de los casos anteriores, los heteroátomos en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, C₁-C₇ heteroarilo se seleccionan independientemente de uno o más de boro, silicio, oxígeno, azufre, selenio, nitrógeno y fósforo; el número de heteroátomos es independientemente 1, 2, 3 o 4.

2. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 1, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde, cuando L es C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido con uno o dos R³, el C₃-C₂₀ cicloalquilo es C₃-C₂₀ cicloalquilo monocíclico, C₃-C₂₀ cicloalquilo espiro, C₃-C₂₀ cicloalquilo

fusionado o C₃-C₂₀ cicloalquilo puenteado;

y / o, cuando L es C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido con uno o dos R³, el C₃-C₂₀ cicloalquilo es C₃-C₂₀ cicloalquilo saturado;

y / o, cuando R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo, el C₁-C₇ el alquilo es C₁-C₃ alquilo;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo monocíclico, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo puenteado;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo saturado;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el heteroátomo del C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el metileno en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido ni reemplazado;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo monocíclico, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo puenteado;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo saturado;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno o dos R⁴, el heteroátomo del C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido excepto por R⁴;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con uno o dos R⁴, el metileno en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido ni reemplazado;

y / o, cuando R⁴ es C₁-C₇ alquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el C₁-C₇ el alquilo es C₁-C₃ alquilo;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es C₃-C₇ cicloalquilo;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es C₃-C₁₄ cicloalquilo saturado;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₇ heterocicloalquilo;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo saturado;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el heteroátomo del C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido excepto R²⁻⁹;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el metileno en el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo no está sustituido ni reemplazado;

y / o, cuando R²⁻⁹ es independientemente C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es C₃-C₁₄ cicloalquilo monocíclico;

y / o, cuando R²⁻⁹ es independientemente C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es C₃-C₁₄ cicloalquilo saturado;

y / o, cuando R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo, el C_1-C_7 el alquilo es C_1-C_3 alquilo;
y / o, cuando R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo, el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo monocíclico;

y / o, cuando R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo, el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo saturado;

y / o, cuando R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo, el heteroátomo del C_3-C_{14} heterocicloalquilo no está sustituido;

y / o, cuando R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo, el metileno en el C_3-C_{14} heterocicloalquilo no está sustituido ni reemplazado;

y / o, cuando R^2 es C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} , el C_3-C_{14} heterocicloalquilo monocíclico es " C_3-C_9 heterocicloalquilo monocíclico que tiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre uno o dos de N, O y S ”;

y / o, cuando R^2 es C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido con un R^{2-9} , el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo saturado;

y / o, cuando R^2 es C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} , el heteroátomo del C_3-C_{14} heterocicloalquilo no está sustituido excepto R^{2-9} ;

y / o, cuando R^2 es C_3-C_{14} heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} , el metileno en el C_3-C_{14} heterocicloalquilo no está sustituido ni reemplazado;

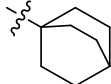
y / o, cuando R^{2-9} es independientemente C_1-C_7 alquilo, el C_1-C_7 alquilo es C_1-C_3 alquilo;

y / o la proporción de cada isómero en el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** es igual;

y / o, los átomos en el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representados por la fórmula **I**, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo existen todos en su abundancia natural.

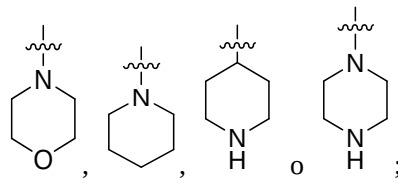
3. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según la reivindicación 2, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde, cuando L es C_3-C_{20} cicloalquilo sustituido con uno o dos R^3 , el C_3-C_{20} cicloalquilo es C_3-C_{20} cicloalquilo monocíclico; el C_3-C_{20} cicloalquilo monocíclico es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo;

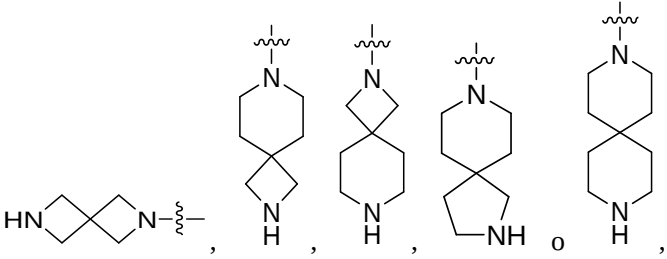
y / o, cuando L es C_3-C_{20} cicloalquilo sustituido con uno o dos R^3 , el C_3-C_{20} cicloalquilo es C_3-C_{20}

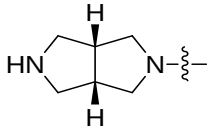
cicloalquilo puenteado; el C_3-C_{20} cicloalquilo puenteado es  o  ;

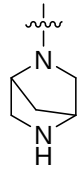
y / o, cuando R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo, el C_1-C_7 alquilo es metilo, etilo, *n*-propilo o isopropilo;

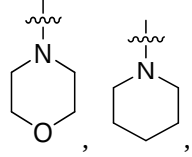
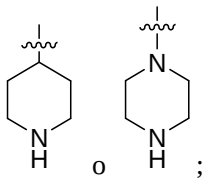
y / o, cuando L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo, el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo

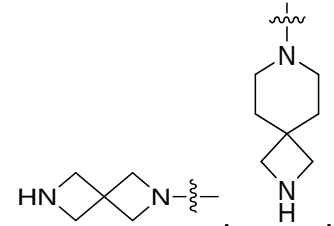
monocíclico; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo monocíclico es  ;
y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo

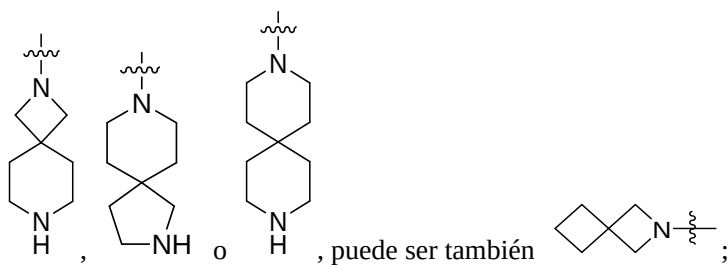
espiro; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro es  ,
puede ser también  ;
y / o, cuando L es independientemente C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄

heterocicloalquilo fusionado; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado es  ;
y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo

punteado; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo punteado es  ;
y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo

es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo monocíclico; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo monocíclico es  ,
 ;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo
es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro es  ,



y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo

es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado es ;

y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo

es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo puenteado; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo puenteado es ;

y / o, cuando R⁴ es C₁-C₇ alquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el C₁-C₇ alquilo es metilo, etilo, *n*-propilo o isopropilo;

y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es C₃-C₇ cicloalquilo monocíclico, por ejemplo ciclobutilo;

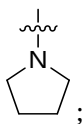
y / o, cuando R⁴ es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R²⁻⁹, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-

C₇ heterocicloalquilo monocíclico, por ejemplo azetidino, por ejemplo ;

y / o, cuando R²⁻⁹ es independientemente C₃-C₁₄ cicloalquilo, el C₃-C₁₄ cicloalquilo es ciclopropilo;

y / o, cuando R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo, el C₁-C₇ alquilo es metilo, etilo, *n*-propilo o isopropilo;

y / o, cuando R²⁻³ es independientemente C₃-C₁₄ heterocicloalquilo, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es



y / o, cuando R² es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹, el C₃-C₁₄

heterocicloalquilo monocíclico es ;

y / o, cuando R²⁻⁹ es independientemente C₁-C₇ alquilo, el C₁-C₇ alquilo es metilo, etilo, *n*-propilo o isopropilo.

4. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la

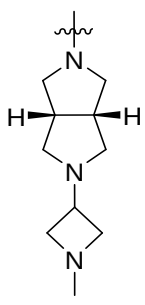
es -NR²⁻¹R²⁻²; el “C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³” es

[illegible]

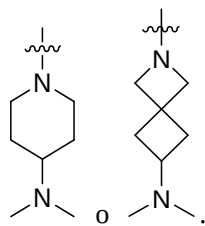
ser

C1CCC1N2CCN(C2)C3CCCC3

C



y / o, cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴, R⁴ es -NR²⁻¹R²⁻²; el "C₃-C₁₄



heterocicloalquilo sustituido por un R^{4"} es -N- o -N-.

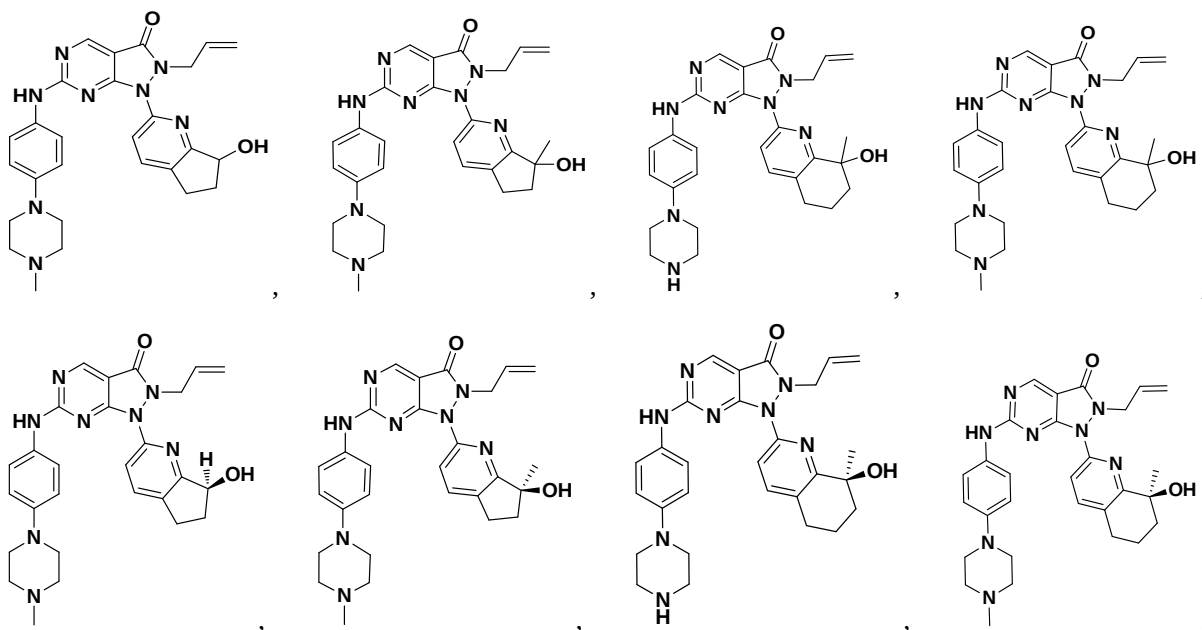
5. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 1, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde, R¹ es hidrógeno o metilo;

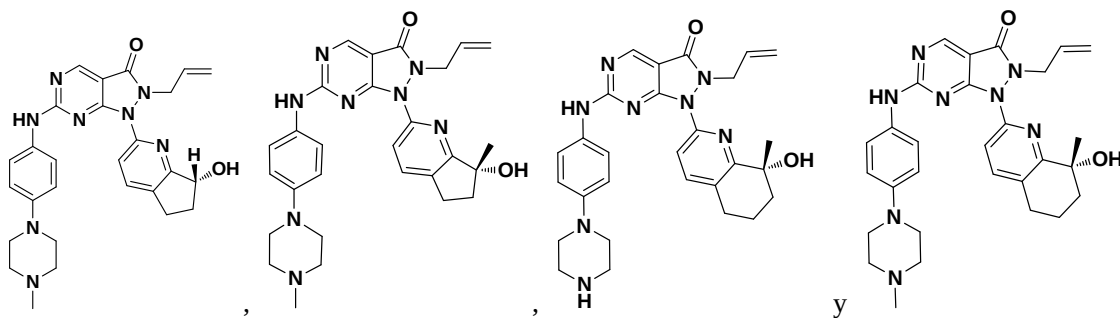
y / o n es 1 o 2;

y / o, L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³", C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; m es 1 o 2, y también puede ser 3;

y / o, R², R³ y R⁴ son independientes -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³ o "C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹; R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo; R²⁻³ es independientemente C₃-C₁₄ heterocicloalquilo; R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo; R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

y / o los compuestos de pirimidina fusionada con pirazolona representados por la fórmula I no son





6. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 5, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde L es “C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³”, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o “C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴”;

y / o, R³ y R⁴ son independientemente -NR²⁻¹R²⁻² o “C₁-C₇ alquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹”; R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo; R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³ o C₃-C₁₄ cicloalquilo; R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo”.

7. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 2, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde L es - (CH₂)_m-R², “C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado sustituido con uno o dos R⁴” o “C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro sustituido con uno o dos R⁴”;

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado es C₅-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado;

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro es C₅-C₁₄ heterocicloalquilo espiro.

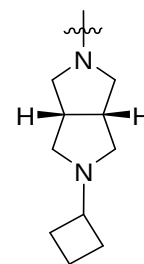
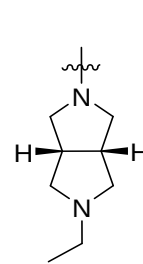
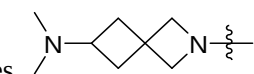
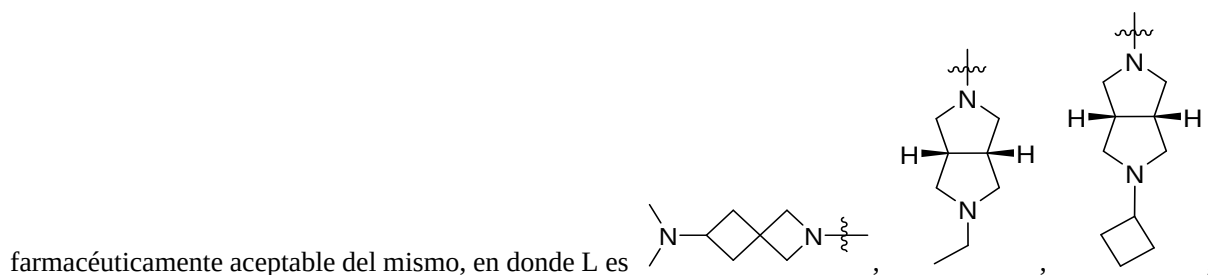
8. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 7, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde, R² es -NR²⁻¹R²⁻²;

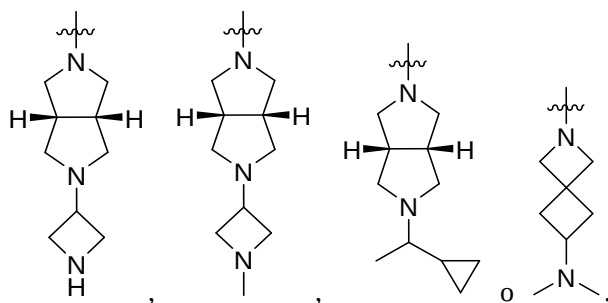
y / o, R⁴ es -NR²⁻¹R²⁻² o “C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo” opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

y / o, R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

y / o, R²⁻⁹ es independientemente C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo.

9. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según la reivindicación 8, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal





10. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según la reivindicación 1, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** es cualquiera de los siguientes esquemas:

Esquema 1):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es $-(CH_2)_m-R^2$, C_3-C_{20} cicloalquilo, " C_3-C_{20} cicloalquilo sustituido con uno o dos $R^{3''}$ ", C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido con uno o dos $R^{4''}$ ";

m es 1, 2, 3 o 4;

R^2 , R^3 y R^4 son independientemente $-CN$, $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$, $-(C=NR^{2-4})R^{2-5}$, $-S(=O)_2R^{2-6}$, $-OR^{2-7}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-3} es independiente $-NR^{2-3-1}R^{2-3-2}$, $-OR^{2-3-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-3-1} y R^{2-3-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-3-3} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-4} es independientemente hidrógeno, $-CN$ o $-OR^{2-4-1}$;

R^{2-4-1} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-5} es independiente $-NR^{2-5-1}R^{2-5-2}$ o C_1-C_7 cicloalquilo;

R^{2-5-1} y R^{2-5-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-6} es independiente $-NR^{2-6-1}R^{2-6-2}$;

R^{2-6-1} y R^{2-6-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, halógeno, ciano, $-(C=O)R^{2-9-5}$, $-S(=O)_2R^{2-9-8}$, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-5} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-9-5-1}R^{2-9-5-2}$, $-OR^{2-9-5-3}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-9-5-1}$, $R^{2-9-5-2}$ y $R^{2-9-5-3}$ son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-8} es independiente $-NR^{2-9-8-1}R^{2-9-8-2}$;

$R^{2-9-8-1}$ y $R^{2-9-8-2}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

esquema (2):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³", C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; m es 1 o 2, y también puede ser 3;

R², R³ y R⁴ son independientemente -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³ o "C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻³ es independientemente C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (3):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³", C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴;

R³ y R⁴ son independientemente -NR²⁻¹R²⁻² o "C₁-C₇ alquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹";

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³ o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (4):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado sustituido con uno o dos R⁴" o " C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro sustituido con uno o dos R⁴";

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado es C₅-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado;

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro es C₅-C₁₄ heterocicloalquilo espiro;

R² es -NR²⁻¹R²⁻²;

R⁴ es -NR²⁻¹R²⁻² o "C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

esquema (5):

R¹ es hidrógeno;

n es 1;

L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado sustituido con uno o dos R⁴" o " C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro sustituido con uno o dos R⁴";

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado es C₅-C₁₄

heterocicloalquilo fusionado;

cuando L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro, el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro es C₅-C₁₄ heterocicloalquilo espiro; R² es -NR²⁻¹R²⁻²;

R⁴ es -NR²⁻¹R²⁻² o "C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹ es independientemente C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

esquema (6):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido con uno o dos R³" o " C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴";

m es 1, 2, 3 o 4;

R², R³ y R⁴ son independientes -NR²⁻¹R²⁻²;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

esquema (7):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es - (CH₂)_m-R², "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³", "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; m es 1 o 2 y también puede ser 3;

R², R³ y R⁴ son independientes -NR²⁻¹R²⁻²;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (8):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido por un R³" o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴;

R³ y R⁴ son independientes -NR²⁻¹R²⁻²;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (9):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C₃-C₂₀ cicloalquilo o "C₃-C₂₀ cicloalquilo sustituido con uno o dos R³";

R³ es independientemente -CN, -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³, - (C = NR²⁻⁴) R²⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁶, -OR²⁻⁷ o "C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻³ es independiente -NR²⁻³⁻¹R²⁻³⁻², -OR²⁻³⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻³⁻¹ y R²⁻³⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R^{2-3-3} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-4} es independientemente hidrógeno, $-CN$ o $-OR^{2-4-1}$;
 R^{2-4-1} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-5} es independiente $-NR^{2-5-1}R^{2-5-2}$ o C_1-C_7 cicloalquilo;
 R^{2-5-1} y R^{2-5-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-6} es independiente $-NR^{2-6-1}R^{2-6-2}$;
 R^{2-6-1} y R^{2-6-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, halógeno, ciano, $-(C=O)R^{2-9-5}$, $-S(=O)_2R^{2-9-8}$, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-9-5} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-9-5-1}R^{2-9-5-2}$, $-OR^{2-9-5-3}$ o C_1-C_7 alquilo;
 $R^{2-9-5-1}$, $R^{2-9-5-2}$ y $R^{2-9-5-3}$ son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-9-8} es independiente $-NR^{2-9-8-1}R^{2-9-8-2}$;
 $R^{2-9-8-1}$ y $R^{2-9-8-2}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

esquema (10):

R^1 es hidrógeno o metilo;
 n es 1 o 2;
 L es C_3-C_{20} cicloalquilo sustituido por un R^3 ;
 R^3 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$ o " C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo;
 R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;
 R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (11):

R^1 es hidrógeno o metilo;
 n es 1 o 2;
 L es C_3-C_{20} cicloalquilo sustituido por un R^3 ;
 R^3 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$ o " C_1-C_7 alquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ";
 R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;
 R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$ o C_3-C_{14} cicloalquilo;
 R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (12):

R^1 es hidrógeno o metilo;
 n es 1 o 2;
 L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R^4 "; el C_3-C_{14}

heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro;

R⁴ es independientemente -CN, -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³, - (C = NR²⁻⁴) R²⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁶, -OR²⁻⁷ o "C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻³ es independiente -NR²⁻³⁻¹R²⁻³⁻², -OR²⁻³⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻³⁻¹ y R²⁻³⁻² son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻³⁻³ es independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁴ es independientemente hidrógeno, -CN o -OR²⁻⁴⁻¹;

R²⁻⁴⁻¹ es independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁵ es independiente -NR²⁻⁵⁻¹R²⁻⁵⁻² o C₁-C₇ cicloalquilo;

R²⁻⁵⁻¹ y R²⁻⁵⁻² son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁶ es independiente -NR²⁻⁶⁻¹R²⁻⁶⁻²;

R²⁻⁶⁻¹ y R²⁻⁶⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³, halógeno, ciano, - (C = O) R²⁻⁹⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁹⁻⁸, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁵ es independientemente hidrógeno, -NR²⁻⁹⁻⁵⁻¹R²⁻⁹⁻⁵⁻², -OR²⁻⁹⁻⁵⁻³ o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁵⁻¹, R²⁻⁹⁻⁵⁻² y R²⁻⁹⁻⁵⁻³ son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁸ es independiente -NR²⁻⁹⁻⁸⁻¹R²⁻⁹⁻⁸⁻²;

R²⁻⁹⁻⁸⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁸⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

esquema (13):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro;

R⁴ es independiente -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³ o "C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻³ es independientemente C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (14):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; el C₃-C₁₄

heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo espiro;

R⁴ es independiente -NR²⁻¹R²⁻² o "C₁-C₇ alquilo opcionalmente sustituido con un R²⁻⁹";

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³ o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

esquema (15):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R⁴"; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado;

R⁴ es independientemente -CN, -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³, - (C = NR²⁻⁴) R²⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁶, -OR²⁻⁷ o "C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo, C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o C₁-C₇ heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R²⁻⁹;

R²⁻¹ y R²⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, o C₃-C₁₄ cicloalquilo;

R²⁻³ es independiente -NR²⁻³⁻¹R²⁻³⁻², -OR²⁻³⁻³, C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻³⁻¹ y R²⁻³⁻² son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻³⁻³ es independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁴ es independientemente hidrógeno, -CN o -OR²⁻⁴⁻¹;

R²⁻⁴⁻¹ es independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁵ es independiente -NR²⁻⁵⁻¹R²⁻⁵⁻² o C₁-C₇ cicloalquilo;

R²⁻⁵⁻¹ y R²⁻⁵⁻² son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁶ es independiente -NR²⁻⁶⁻¹R²⁻⁶⁻²;

R²⁻⁶⁻¹ y R²⁻⁶⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹ es independiente -NR²⁻⁹⁻²R²⁻⁹⁻³, halógeno, ciano, - (C = O) R²⁻⁹⁻⁵, -S (= O)₂R²⁻⁹⁻⁸, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

R²⁻⁹⁻² y R²⁻⁹⁻³ son independientemente C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁵ es independientemente hidrógeno, -NR²⁻⁹⁻⁵⁻¹R²⁻⁹⁻⁵⁻², -OR²⁻⁹⁻⁵⁻³ o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁵⁻¹, R²⁻⁹⁻⁵⁻² y R²⁻⁹⁻⁵⁻³ son independientemente hidrógeno o C₁-C₇ alquilo;

R²⁻⁹⁻⁸ es independiente -NR²⁻⁹⁻⁸⁻¹R²⁻⁹⁻⁸⁻²;

R²⁻⁹⁻⁸⁻¹ y R²⁻⁹⁻⁸⁻² son independientemente hidrógeno, C₁-C₇ alquilo, C₃-C₁₄ cicloalquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo;

esquema (16):

R¹ es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo o "C₃-C₁₄ heterocicloalquilo sustituido por un R⁴"; el C₃-C₁₄ heterocicloalquilo es C₃-C₁₄ heterocicloalquilo fusionado;

R⁴ es independiente -NR²⁻¹R²⁻², - (C = O) R²⁻³ o "C₁-C₇ alquilo o C₃-C₁₄ heterocicloalquilo"

opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (17):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido por un R^4 "; el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo fusionado;

R^4 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$ o " C_1-C_7 alquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ";

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$ o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (18):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido con uno o dos R^4 "; el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo puenteado;

R^4 es independientemente $-CN$, $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$, $-(C=NR^{2-4})R^{2-5}$, $-S(=O)_2R^{2-6}$, $-OR^{2-7}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-3} es independiente $-NR^{2-3-1}R^{2-3-2}$, $-OR^{2-3-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-3-1} y R^{2-3-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-3-3} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-4} es independientemente hidrógeno, $-CN$ o $-OR^{2-4-1}$;

R^{2-4-1} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-5} es independiente $-NR^{2-5-1}R^{2-5-2}$ o C_1-C_7 cicloalquilo;

R^{2-5-1} y R^{2-5-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-6} es independiente $-NR^{2-6-1}R^{2-6-2}$;

R^{2-6-1} y R^{2-6-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, halógeno, ciano, $-(C=O)R^{2-9-5}$, $-S(=O)_2R^{2-9-8}$, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-5} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-9-5-1}R^{2-9-5-2}$, $-OR^{2-9-5-3}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-9-5-1}$, $R^{2-9-5-2}$ y $R^{2-9-5-3}$ son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-8} es independiente $-NR^{2-9-8-1}R^{2-9-8-2}$;

$R^{2-9-8-1}$ y $R^{2-9-8-2}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

esquema (19):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido por un R^4 "; el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo puenteado;

R^4 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$ o " C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo" opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (20):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es C_3-C_{14} heterocicloalquilo o " C_3-C_{14} heterocicloalquilo sustituido por un R^4 "; el C_3-C_{14} heterocicloalquilo es C_3-C_{14} heterocicloalquilo puenteado;

R^4 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$ o " C_1-C_7 alquilo opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ";

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$ o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

esquema (21):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es $(CH_2)_m-R^2$;

m es 1, 2, 3 o 4;

R^2 , R^3 y R^4 son independientemente $-CN$, $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$, $-(C=NR^{2-4})R^{2-5}$, $-S(=O)_2R^{2-6}$, $-OR^{2-7}$ o " C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo, C_3-C_{14} heterocicloalquilo o C_1-C_7 heteroarilo" opcionalmente sustituido con uno, dos o tres R^{2-9} ;

R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

R^{2-3} es independiente $-NR^{2-3-1}R^{2-3-2}$, $-OR^{2-3-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-3-1} y R^{2-3-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-3-3} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-4} es independientemente hidrógeno, $-CN$ o $-OR^{2-4-1}$;

R^{2-4-1} es independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-5} es independiente $-NR^{2-5-1}R^{2-5-2}$ o C_1-C_7 cicloalquilo;

R^{2-5-1} y R^{2-5-2} son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-6} es independiente $-NR^{2-6-1}R^{2-6-2}$;

R^{2-6-1} y R^{2-6-2} son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, halógeno, ciano, $-(C=O)R^{2-9-5}$, $-S(=O)_2R^{2-9-8}$, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-5} es independientemente hidrógeno, $-NR^{2-9-5-1}R^{2-9-5-2}$, $-OR^{2-9-5-3}$ o C_1-C_7 alquilo;

$R^{2-9-5-1}$, $R^{2-9-5-2}$ y $R^{2-9-5-3}$ son independientemente hidrógeno o C_1-C_7 alquilo;

R^{2-9-8} es independiente $-NR^{2-9-8-1}R^{2-9-8-2}$;

$R^{2-9-8-1}$ y $R^{2-9-8-2}$ son independientemente hidrógeno, C_1-C_7 alquilo, C_3-C_{14} cicloalquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

esquema (22):

R^1 es hidrógeno o metilo;

n es 1 o 2;

L es $(CH_2)_m-R^2$; m es 1 o 2, y también puede ser 3.

R^2 es independiente $-NR^{2-1}R^{2-2}$, $-(C=O)R^{2-3}$ o " C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} heterocicloalquilo"

opcionalmente sustituido con un R^{2-9} ;

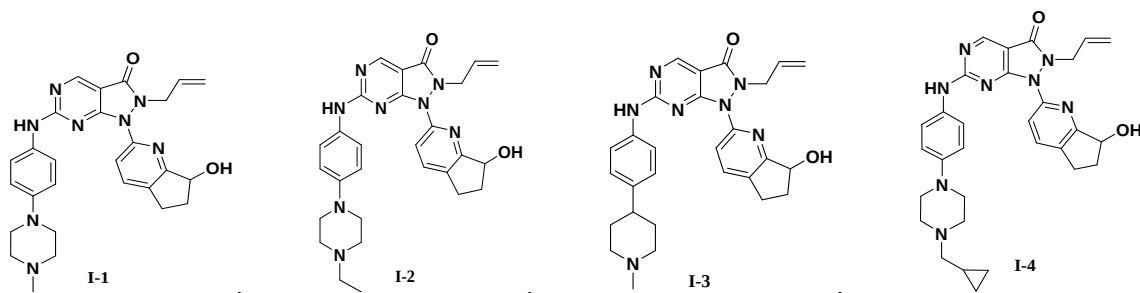
R^{2-1} y R^{2-2} son independientemente C_1-C_7 alquilo;

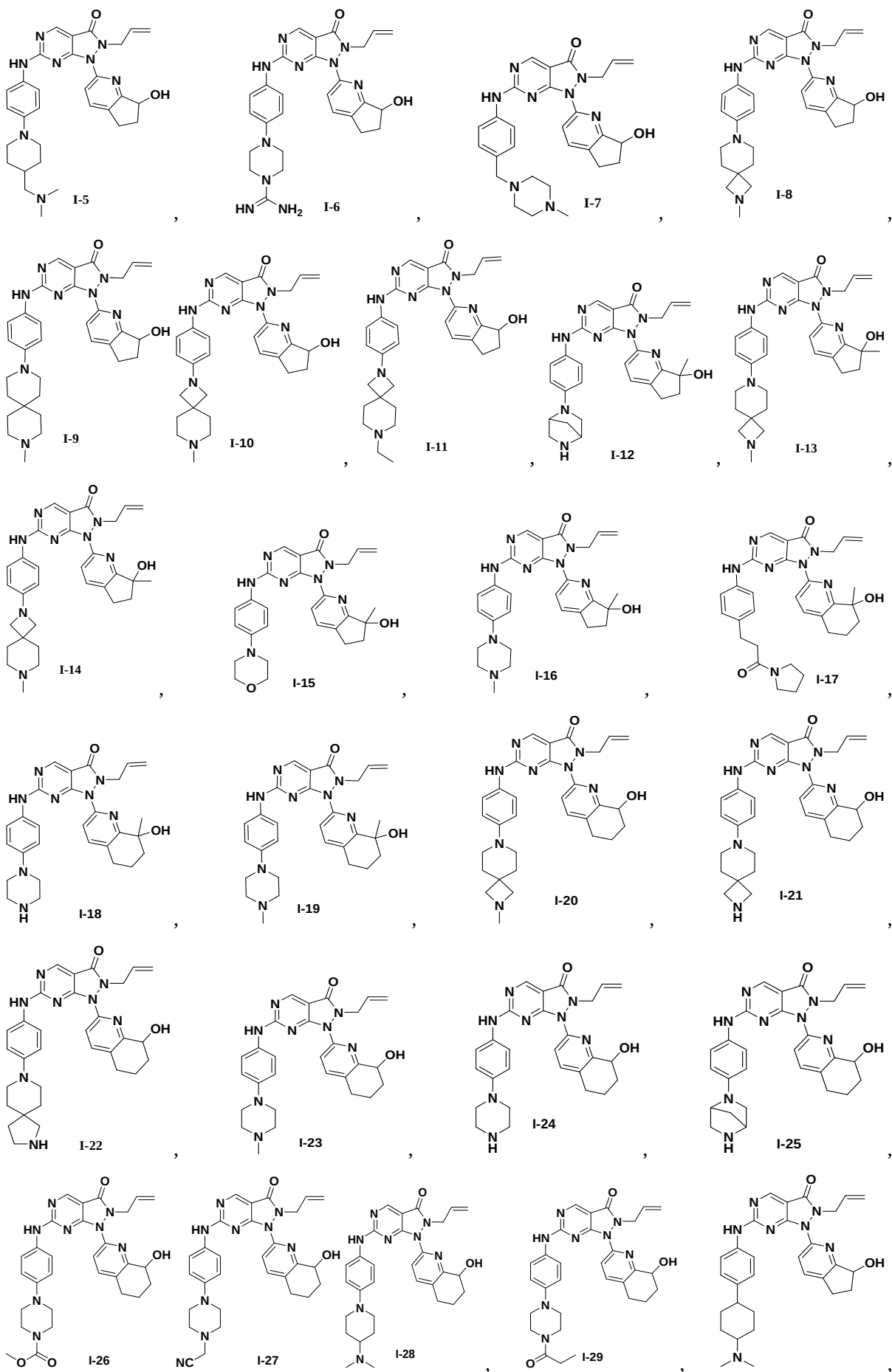
R^{2-3} es independientemente C_3-C_{14} heterocicloalquilo;

R^{2-9} es independiente $-NR^{2-9-2}R^{2-9-3}$, C_1-C_7 alquilo o C_3-C_{14} cicloalquilo;

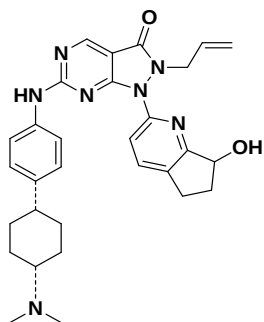
R^{2-9-2} y R^{2-9-3} son independientemente C_1-C_7 alquilo.

11. El compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según la reivindicación 1, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** es cualquiera de las siguientes estructuras:



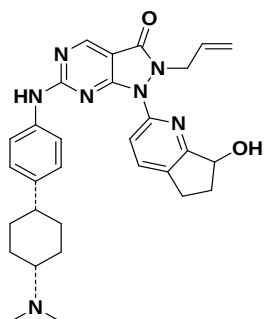


farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** es cualquiera de los siguientes compuestos:



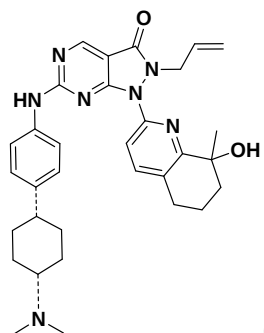
(I-30-1) con un tiempo de retención de 9,66 min en las siguientes condiciones:

Cromatógrafo de líquidos de alto rendimiento Agilent 1260; fase móvil A: agua (ácido fórmico al 0,1%), fase móvil B: acetonitrilo; tiempo de columna: 15 minutos; tipo de columna: Xselect de Waters, 5 μ m, 4,6 $\times$ 250 mm; elución en gradiente, 5% de fase móvil B $\rightarrow$ 50% de fase móvil B;



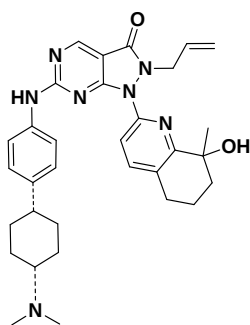
(I-30-2) con un tiempo de retención de 10,04 min en las siguientes condiciones:

Cromatógrafo de líquidos de alto rendimiento Agilent 1260; fase móvil A: agua (ácido fórmico al 0,1%), fase móvil B: acetonitrilo; tiempo de columna: 15 minutos; tipo de columna: Xselect de Waters, 5 μ m, 4,6 $\times$ 250 mm; elución en gradiente, 5% de fase móvil B $\rightarrow$ 50% de fase móvil B;



(I-36-1) con un tiempo de retención de 7,80 min en las siguientes condiciones:

Cromatógrafo de líquidos de alto rendimiento Agilent 1260; fase móvil A: agua (ácido fórmico al 0,1%), fase móvil B: acetonitrilo; tiempo de columna: 15 minutos; tipo de columna: Xselect de Waters, 5 μ m, 4,6 $\times$ 250 mm; elución en gradiente, 5% de fase móvil B $\rightarrow$ 95% de fase móvil B;

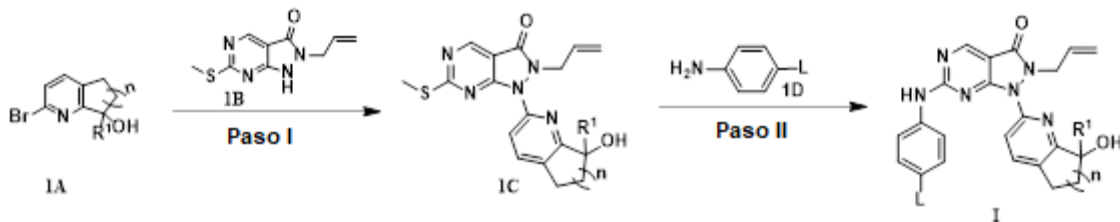


(I-36-2) con un tiempo de retención de 7,97 min en las siguientes condiciones:

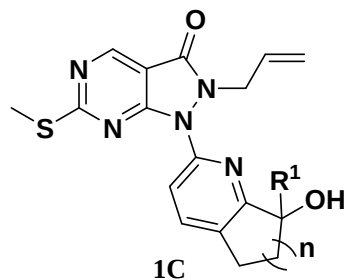
Cromatógrafo de líquidos de alto rendimiento Agilent 1260; fase móvil A: agua (ácido fórmico al 0,1%), fase móvil B: acetonitrilo; tiempo de columna: 15 minutos; tipo de columna: Xselect de Waters, 5 μ m, 4,6 $\times$ 250 mm; elución en gradiente, 5% de fase móvil B $\rightarrow$ 95% de fase móvil B;

en donde,  significa que la conformación *cis-trans* es incierta.

13. Un método de preparación del compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, el método comprende los siguientes pasos: paso I, se lleva a cabo una reacción de acoplamiento de C-N entre el compuesto 1A y el compuesto 1B para obtener el compuesto 1C; paso II, se forma un intermediario sulfóxido con mayor actividad por el compuesto 1C bajo la acción de un oxidante, y luego se lleva a cabo una reacción de sustitución entre el intermediario sulfóxido con el compuesto 1D para obtener el compuesto I;

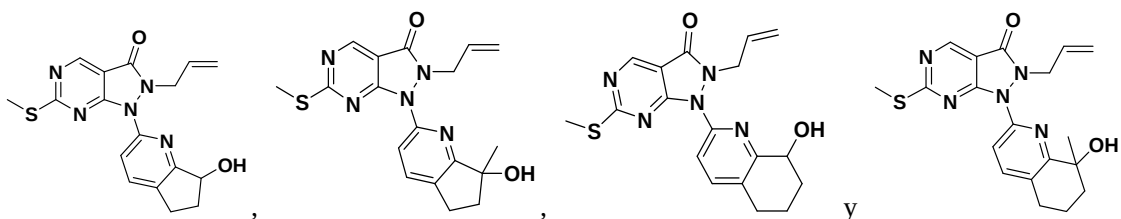


14. Un compuesto representado por la fórmula **1C**:



en donde, R¹ es hidrógeno o metilo; n es 1 o 2;

preferiblemente cualquiera de las siguientes estructuras:



15. Una aplicación de la sustancia. **X** en la preparación de inhibidores de quinasas o medicamentos;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

16. Una aplicación de la sustancia **X** en la preparación de un medicamento; el medicamento se usa para tratar y / o prevenir enfermedades relacionadas con la quinasa WEE1, o el medicamento se usa para tratar y / o prevenir el cáncer;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

17. Una composición farmacéutica que comprende la sustancia **X** y excipientes farmacéuticos;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

18. Una combinación que comprende la sustancia **X** y un medicamento contra el cáncer,

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

19. Una aplicación de la combinación según la reivindicación 18 en la preparación de un medicamento para prevenir y / o tratar el cáncer.

20. Una aplicación de la sustancia **X** en la preparación de un medicamento, el medicamento en combinación con un fármaco contra el cáncer utilizado para prevenir y / o tratar el cáncer;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. Una aplicación de un fármaco contra el cáncer en la preparación de un medicamento, el medicamento en combinación con la sustancia **X** utilizado para prevenir y / o tratar el cáncer;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

22. Una composición farmacéutica que comprende la combinación de acuerdo con la reivindicación 18 y excipientes farmacéuticos.

23. Un kit de combinación de fármacos que comprende una composición farmacéutica A y una composición farmacéutica B;

la composición farmacéutica A comprende la sustancia **X** y excipientes farmacéuticos;

la composición farmacéutica B comprende los fármacos contra el cáncer y los excipientes farmacéuticos;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula **I** según al menos una de las reivindicaciones 1 a 12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo o el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

24. Un método para tratar y / o prevenir enfermedades que comprende administrar una cantidad terapéuticamente eficaz de sustancia **X** a un paciente; la enfermedad es una enfermedad o cáncer relacionado con la quinasa WEE1;

la sustancia **X** es el compuesto de pirimidina fusionada con pirazolona representado por la fórmula I según al menos una de las reivindicaciones 1-12, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el solvato del mismo, el solvato de la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el metabolito del mismo o el profármaco del mismo.

25. Un método para tratar y / o prevenir el cáncer que comprende administrar una cantidad terapéuticamente eficaz de la combinación según la reivindicación 18 a un paciente.

