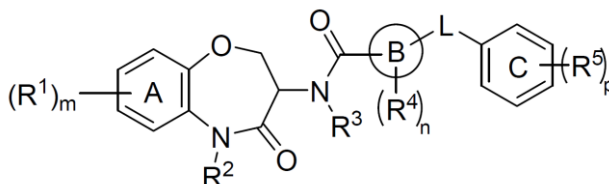


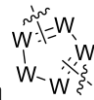
CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto, que tiene una Fórmula



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

el anillo B tiene una estructura que cumple con la Fórmula , en donde al menos una W es nitrógeno y las W restantes se seleccionan independientemente de carbono, CH, oxígeno, azufre, nitrógeno o NH;

L es un conector alifático C₁₋₁₀;

R¹ es R^a o R^b, en donde al menos un R¹ es R^b que es -NR^dR^d en donde los dos grupos R^d junto con el nitrógeno unido a ellos proporcionan un grupo heterocíclico C₃₋₁₀ no aromático que está opcionalmente sustituido con uno o más grupos R^e y/o R^g, en donde R^g es halógeno, alifático C₁₋₁₀-aromático C₅₋₁₀, u =O;

cada uno de R² y R³ son independientemente R^a;

cada R⁴ y cada R⁵ son independientemente R^a o R^b;

R^a es independientemente para cada aparición H, D, alifático C₁₋₁₀ o cicloalifático C₁₋₁₀;

R^b es independientemente para cada aparición, excepto la de dicho al menos un R¹, halógeno o -NR^dR^d, en donde (i) cada R^d es independientemente R^a o R^e; o (ii) dos grupos R^d, junto con el nitrógeno enlazado a los mismos, proporcionan un grupo heterocíclico C₃₋₁₀;

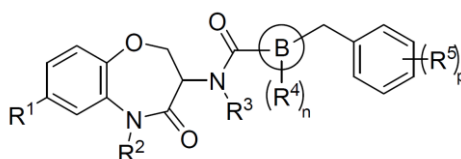
R^e es independientemente para cada aparición -OR^a, -NR^a, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, heteroalquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, o dos grupos R^e se unen entre sí para proporcionar un grupo heterocíclico C₃₋₁₀ con el grupo R^b al que están enlazados los dos grupos R^e;

m es de 1 a 4;

n es 0, 1 o 2; y

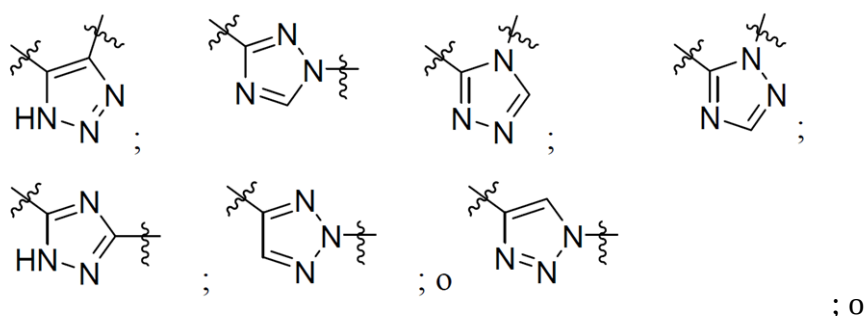
p es 0, 1, 2, 3, 4 o 5.

2. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto tiene una estructura que cumple una Fórmula

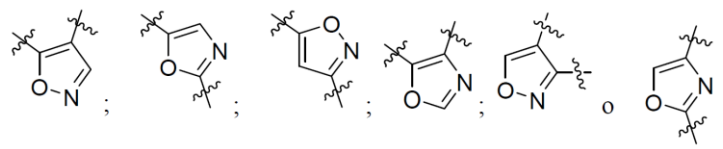


3. El compuesto de la Reivindicación 1 o la Reivindicación 2, en donde el anillo B es

(a) un triazol seleccionado de



(b) un oxazol seleccionado de



4. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, en donde R^5 es R^a , en donde R^a es alifático C_1 - C_4 , o R^5 es R^b , en donde R^b es halógeno; y/o en donde R^2 es R^a , en donde R^a es alifático C_1 - C_4 , y R^3 es R^a , en donde R^a es hidrógeno.

5. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, en donde R^1 es R^b , en donde R^b es $-NR^dR^d$, en donde los dos grupos R^d , junto con el nitrógeno enlazado a los mismos, proporcionan un grupo heterocíclico C_{3-10} no aromático sustituido, cuyos sustituyentes comprenden al menos dos grupos R^e que se unen entre sí para proporcionar un segundo grupo heterocíclico C_{3-10} .

6. El compuesto de la Reivindicación 5, en donde el segundo heterocíclico C_{3-10} formado por los dos grupos R^e y el heterocíclico C_{3-10} formado por los dos grupos R^d de R^b proporcionan un grupo espirocíclico o un grupo bicíclico.

7. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 6, en donde el segundo heterocíclico C_{3-10} formado por los dos grupos R^e y el heterocíclico C_{3-10} formado por los dos grupos R^d de R^b proporcionan un grupo espirocíclico y en donde el grupo espirocíclico tiene una, dos, tres o cuatro de las características (a), (b), (c) y (d):

(a) el grupo espirocíclico comprende al menos dos anillos, en donde un primer anillo y un segundo anillo del grupo espirocíclico tienen un número diferente de átomos de carbono, un número diferente de heteroátomos o ambos y en donde cada anillo del grupo espirocíclico comprende un heteroátomo en el anillo;

(b) el grupo espirocíclico comprende al menos un átomo de oxígeno y al menos un átomo de nitrógeno;

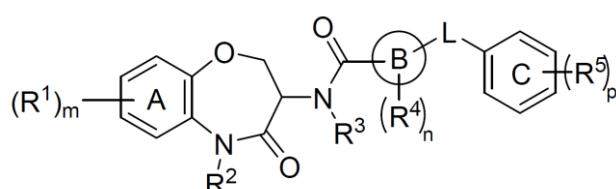
(c) el grupo espirocíclico comprende un primer anillo acoplado a un átomo de carbono del compuesto, en donde el primer anillo tiene de 3 a 7 átomos y en donde un segundo anillo tiene 3 a 7 átomos; y

(d) el grupo espirocíclico comprende más de 7 átomos en total en el sistema espirocíclico.

8. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 5 a 7, en donde el heterocíclico C₃₋₁₀ formado por los dos grupos R^e y el heterocíclico C₃₋₁₀ formado por los dos grupos R^d de R^b proporcionan un grupo bicíclico y el grupo bicíclico comprende dos o más heteroátomos en el grupo bicíclico; y opcionalmente

en donde el grupo bicíclico es un grupo bicíclico condensado o un grupo bicíclico puenteado y en donde el grupo bicíclico está unido al grupo fenilo del anillo A de Fórmula I a través de un átomo de nitrógeno del grupo bicíclico.

9. Un compuesto, que tiene una Fórmula



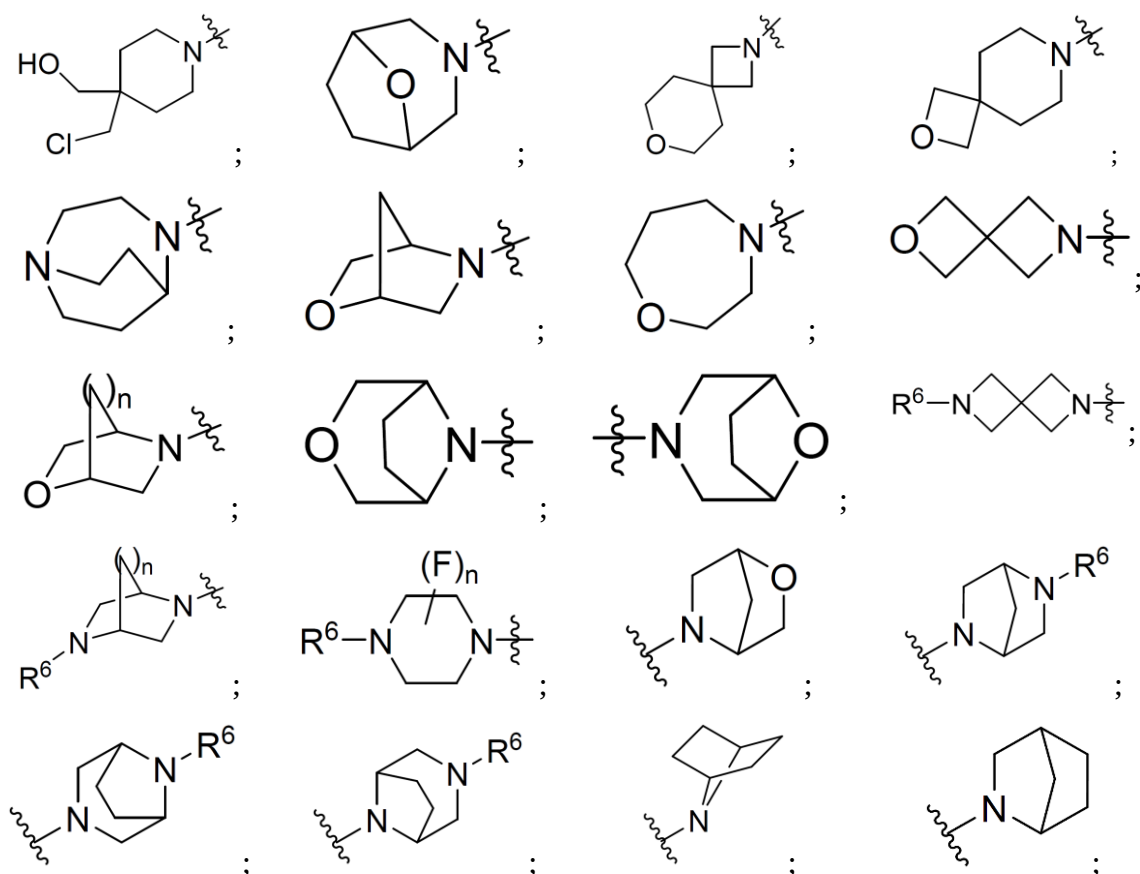
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

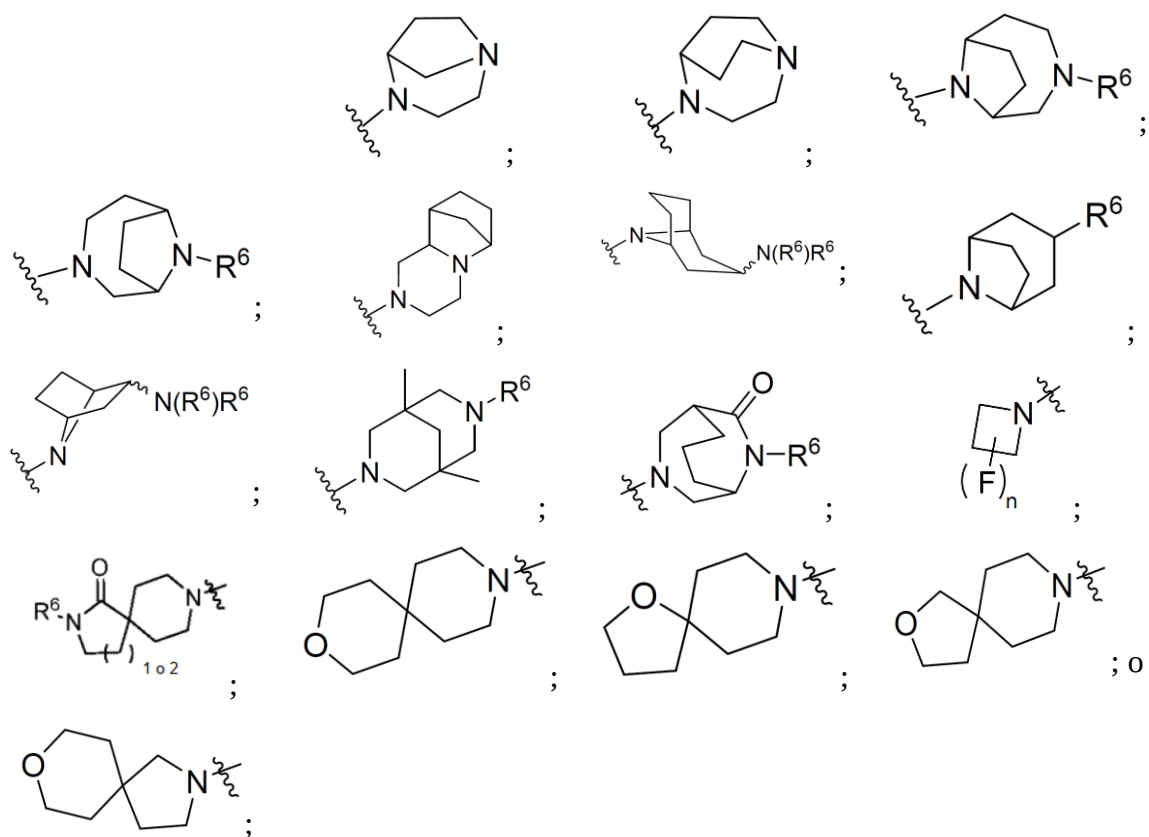
los anillos B, L, R², R³, R^e, m, n y p son como se definen en la Reivindicación 1;

cada R⁴ y cada R⁵ son independientemente R^a o R^b, en donde R^a es como se define en la Reivindicación 1;

R^b es independientemente para cada aparición halógeno o -NR^dR^d, en donde (i) cada R^d es independientemente R^a o R^e; o (ii) dos grupos R^d, junto con el nitrógeno enlazado a los mismos, proporcionan un grupo heterocíclico C₃₋₁₀; y

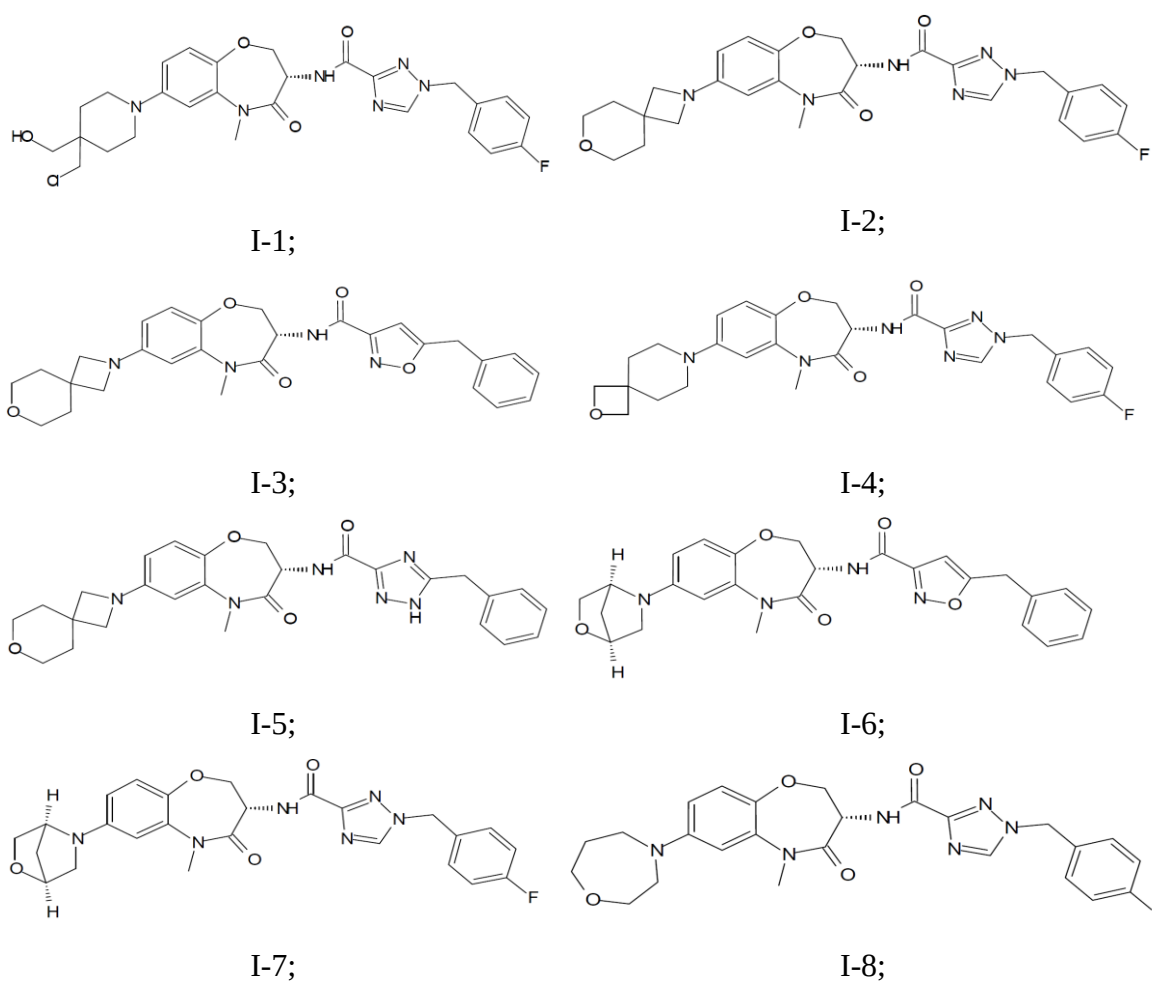
R¹ es independientemente para cada aparición

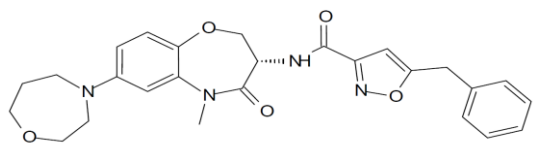




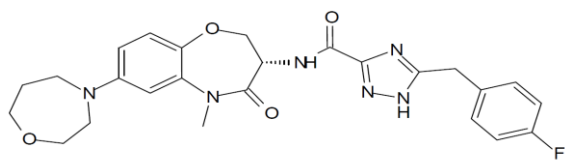
en donde cada n es independientemente un número entero que varía de 0 a 4 y R⁶ se selecciona independientemente de hidrógeno, alifático, aromático o heteroalifático.

10. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, en donde el compuesto se selecciona de

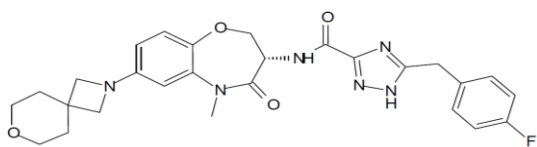




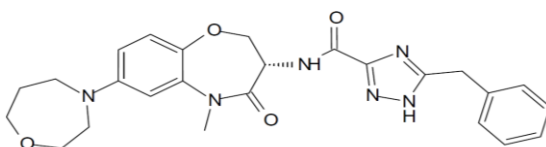
I-9;



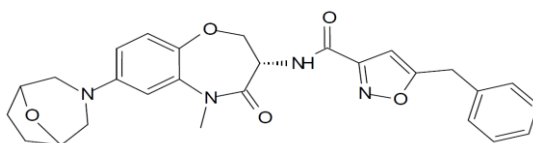
I-10;



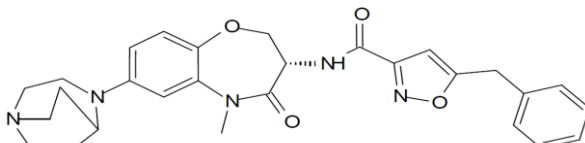
I-11;



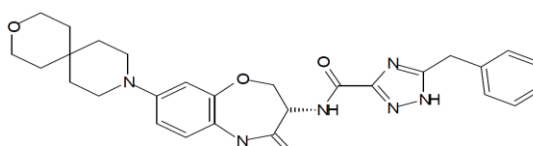
I-12;



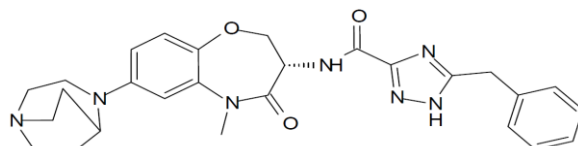
I-13;



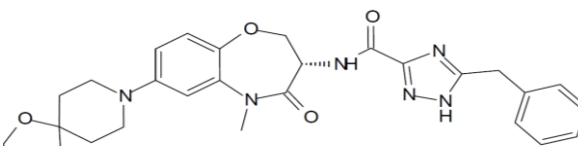
I-14;



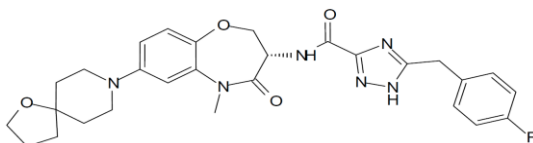
I-15;



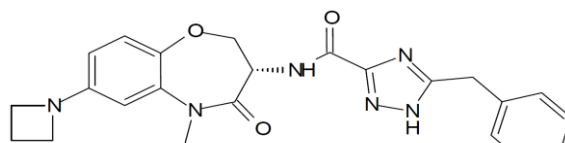
I-16;



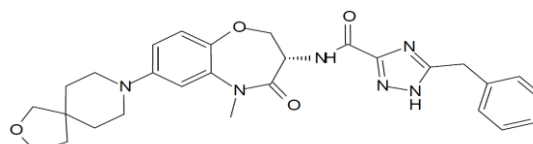
I-18;



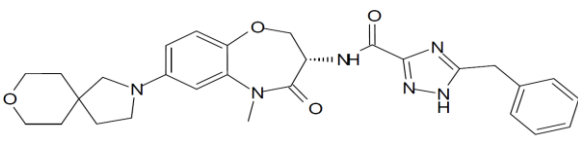
I-19;



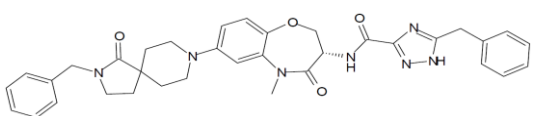
I-20;



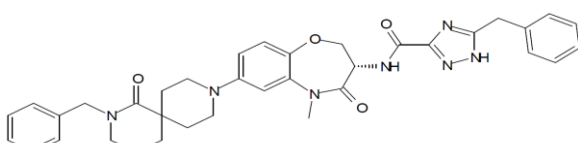
I-21;



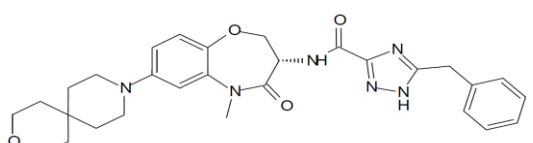
I-22;



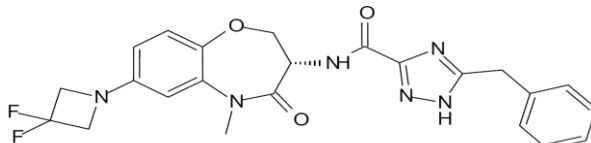
I-23;



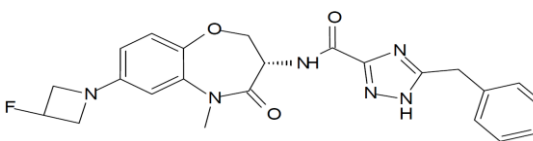
I-24;



I-25;

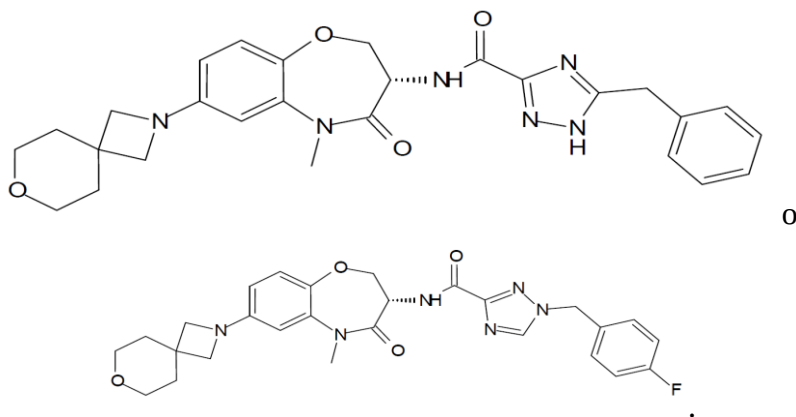


I-26; o



I-27.

11. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, en donde el compuesto es



12. Una composición farmacéutica, que comprende (i) un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 11; y (ii) un excipiente, un agente terapéutico, un adyuvante o combinaciones de los mismos.

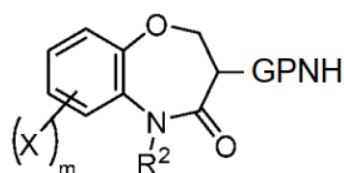
13. Un método para preparar el compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 11, que comprende:

acoplar un material de partida que tiene una Fórmula A con un reactivo que contiene R^1 que tiene una Fórmula R^1-H , combinando el material de partida y el reactivo que contiene R^1 con un catalizador de metal de transición, un componente ligando y un disolvente para formar un producto funcionalizado con R^1 ;

desproteger un grupo amina del producto funcionalizado con R^1 para proporcionar un compuesto de amina; y

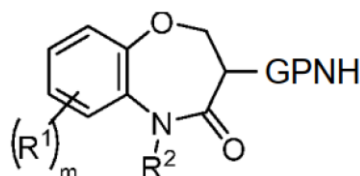
formar un enlace amida entre el compuesto de amina y una pareja de acoplamiento que contiene ácido;

en donde la Fórmula A es



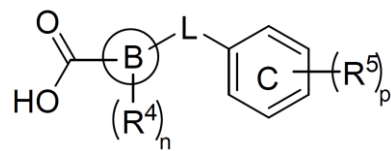
Fórmula A;

el producto funcionalizado con R^1 tiene una estructura que cumple la Fórmula B



Fórmula B;

y la pareja de acoplamiento que contiene ácido tiene una estructura que cumple la Fórmula C



Fórmula C; y en donde

X es un halógeno o un triflato;

PG es un grupo protector amina;

y cada uno del anillo B, L, R¹, R², R⁴, R⁵, m, n y p son como se enumeran en la Reivindicación 1; y opcionalmente

en donde el enlace amida se forma acoplando el compuesto de amina y la pareja de acoplamiento que contiene ácido en presencia de anhídrido propilfosfónico y diisopropiletilamina.
