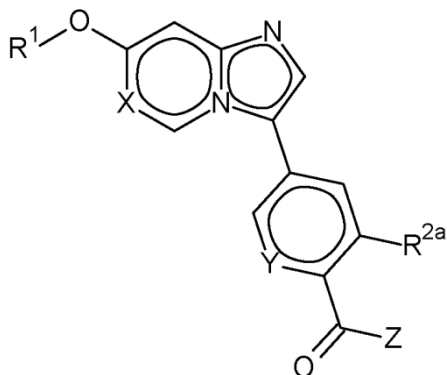


REIVINDICACIONES MODIFICADAS

1. Un compuesto de acuerdo con la Fórmula I:



I

- 5
- 10 caracterizado porque,
 X es N o CH;
 Y es N o CR^{2b};
 Z es
- -NHR^{3a},
 - heterocicloalquilo de 4–7 miembros N–ligado que además comprende cero,
- 15 uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de manera independiente de N, O y S, opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de manera independiente R¹⁵, o
- -NR^{3b}–, donde el átomo de N y R^{2a} junto con los átomos con los que están unidos forman un heterocicloalqueno de 5–6 miembros fusionado que comprende uno o dos enlaces dobles;
- R¹ es
- 20 - alquilo de C₁₋₈ opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R⁴,
 - fenilo,
 - cicloalquilo de C₃₋₈ monocíclico o policíclico puenteado opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R⁵,
 - heterocicloalquilo monocíclico, espirocíclico o puenteado policíclico de 4–8
- 25 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido con

uno o más grupos independientemente seleccionados alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de manera independiente $-CN$ o $-C(=O)-$ alcoxi de C_{1-4} , o

- heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S;

R^{2a} y R^{2b} son seleccionados de manera independiente de

5

- halo,
- alquilo de C_{1-4} ,
- alcoxi de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo o alcoxi de C_{1-4} , y
- $-NR^{6a}R^{6b}$;

R^{3a} es

10

- C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo o $-CN$, o
- cicloalquilo de C_{3-7} opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de manera independiente halo o $-OH$;

R^{3b} se selecciona de H, cicloalquilo de C_{3-7} y C_{1-6} alquilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo o $-CN$;

cada R^4 es seleccionado de manera independiente de

15

- halo,
- $-OH$,
- $-CN$,
- fenilo,
- $-C(=O)OH$,
- $-O-C(=O)-$ alquilo de C_{1-4} ,
- $-O-S(=O)_2-$ alquilo de C_{1-4} ,

20

- alcoxi de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados

- $-OH$,
- alcoxi de C_{1-4} ,
- heterocicloalquilo de 4–8 miembros monocíclico que comprende uno, dos o

tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de

25

manera independiente alquilo de C_{1-4} , o

- $\text{--NR}^{7a}\text{R}^{7b}$, donde cada R^{7a} y R^{7b} es seleccionado de manera independiente de H y alquilo de C_{1-4} ,
- cicloalquilo de C_{3-7} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo, --C(=O)--alcoxi de C_{1-4} , $\text{--NR}^{8a}\text{R}^{8b}$, o alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados $\text{--NR}^{9a}\text{R}^{9b}$,
- 5 - heterocicloalquilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno o dos átomos N fusionados a un heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de manera independiente alquilo de C_{1-4} ,
- 10 - heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados alquilo de C_{1-4} o cicloalquilo de C_{3-7} ,
- heterocicloalquilo monocíclico, espirocíclico o puenteado policíclico de 4–11 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R^{10} ,
- 15 - $\text{--NR}^{11a}\text{R}^{11b}$,
- --C(=O)--alcoxi de C_{1-4} , y
- $\text{--C(=O)--NR}^{12a}\text{R}^{12b}$;
- cada R^5 se selecciona de
- halo,
- --CN , y
- $\text{--NR}^{13a}\text{R}^{13b}$;
- 20 cada R^{6a} y R^{6b} es seleccionado de manera independiente de H y alquilo de C_{1-4} ;
- cada R^{10} se selecciona de
- --OH ,
- fenilo,
- =NH ,
- halo,
- 25 - oxo,

- $-\text{CN}$,
 - $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$,
 - $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$,
 - $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$,
 - $-\text{NR}^{14a}\text{R}^{14b}$,
 - alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos
- 5 independientemente seleccionados halo, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{C}(=\text{O})$ –alcoxi de C_{1-4} , o alcoxi de C_{1-4} ,
- cicloalquilo de C_{3-7} ,
 - heterocicloalquilo monocíclico de 4–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S,
 - $-\text{C}(=\text{O})$ –alquilo de C_{1-4} ,
 - $-\text{S}(=\text{O})_2$ –alquilo de C_{1-4} , y
- 10 - $-\text{C}(=\text{O})$ – C_{1-6} alcoxi;
- cada R^{11a} , R^{11b} es seleccionado de manera independiente de
- H,
 - fenilo,
 - alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos
- independientemente seleccionados halo, $-\text{OH}$, $-\text{CN}$, o alcoxi de C_{1-4} ,
- cicloalquilo de C_{3-7} ,
- 15 - $-\text{C}(=\text{O})$ –alcoxi de C_{1-4} ,
- $-\text{C}(=\text{O})$ –alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos
- seleccionados de manera independiente halo, y
- heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S;
- cada R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} , R^{9b} , R^{12a} , R^{12b} , R^{13a} , y R^{13b} se selecciona de manera independiente
- 20 de H y alquilo de C_{1-4} ;
- cada R^{14a} y R^{14b} se selecciona de manera independiente de H, alquilo de C_{1-4} y $-\text{S}(=\text{O})_2$ –alquilo de C_{1-4} ; y
- cada R^{15} se selecciona de manera independiente de $-\text{OH}$, $-\text{CN}$ y alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de manera independiente halo o $-\text{CN}$.
- 25 2. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la

reivindicación 1, caracterizado porque:

Z es

- --NHR^{3a} , o
- $\text{--NR}^{3b}\text{--}$, donde el átomo N y R^{2a} junto con los átomos a los que están unidos forman un heterocicloalqueno fusionado de 5–6 miembros que comprende uno o dos enlaces dobles;

5 R^1 es

- alquilo de C_{1-8} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R^4 ,
- fenilo,
- cicloalquilo de C_{3-8} monocíclico o policíclico puenteado opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R^5 ,
- 10 - heterocicloalquilo monocíclico o espirocíclico de 4–8 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados alquilo de C_{1-4} ; o
- heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S;

R^{3a} es

- 15 - alquilo de C_{1-6} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo o --CN , o
- cicloalquilo de C_{3-7} ;

cada R^4 es seleccionado de manera independiente de

- halo,
- --OH ,
- --CN ,
- 20 - fenilo,
- alcoxi de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados --OH , alcoxi de C_{1-4} , o $\text{--NR}^{7a}\text{R}^{7b}$, donde cada R^{7a} y R^{7b} es seleccionado de manera independiente de H y alquilo de C_{1-4} ,
- cicloalquilo de C_{3-7} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo, --C(=O)-- alcoxi de C_{1-4} , $\text{--NR}^{8a}\text{R}^{8b}$, o alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados $\text{--NR}^{9a}\text{R}^{9b}$,
- 25 $\text{NR}^{9a}\text{R}^{9b}$,

- heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados alquilo de C_{1-4} o cicloalquilo de C_{3-7} ,

5 - heterocicloalquilo monocíclico o puenteado policíclico de 4–8 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S, donde tal heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados R^{10} ,

- $-NR^{11a}R^{11b}$, y

- $-C(=O)-NR^{12a}R^{12b}$;

cada R^{10} se selecciona de

10 - halo,

- oxo,

- $-CN$,

- $-C(=O)H$,

- $-NR^{14a}R^{14b}$,

- alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo o alcoxi de C_{1-4} ,

- cicloalquilo de C_{3-7} ,

15 - $-C(=O)$ –alquilo de C_{1-4} ,

- $-S(=O)_2$ –alquilo de C_{1-4} , y

- $-C(=O)$ – alcoxi de C_{1-6} ;

cada R^{11a} , R^{11b} es seleccionado de manera independiente de

- H,

- fenilo,

20 - alquilo de C_{1-4} opcionalmente sustituido con uno o más grupos independientemente seleccionados halo, $-OH$, $-CN$, o alcoxi de C_{1-4} ,

- cicloalquilo de C_{3-7} ,

- $-C(=O)$ –alcoxi de C_{1-4} , y

- heteroarilo monocíclico de 5–6 miembros que comprende uno, dos o tres heteroátomos seleccionados de manera independiente de N, O y S; y

cada R^{14a} y R^{14b} se selecciona de manera independiente de H y alquilo de C_{1-4} .

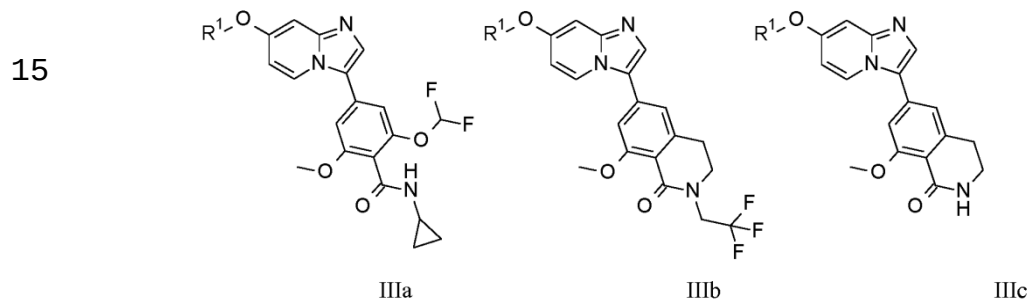
3. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque X es CH.

4. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con las reivindicaciones 1, 2 o 3, caracterizado porque Y es CR^{2b} y R^{2b} es alcoxi de C₁₋₄.

5. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–4, caracterizado porque R^{2a} es –O–CH₃, sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados de manera independiente halo.

6. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–4, caracterizado porque Z es –NR^{3b}–, en donde el átomo de N y R^{2a} junto con los átomos con los que están unidos forman una 1,2,3,6–tetrahidropiridina fusionada.

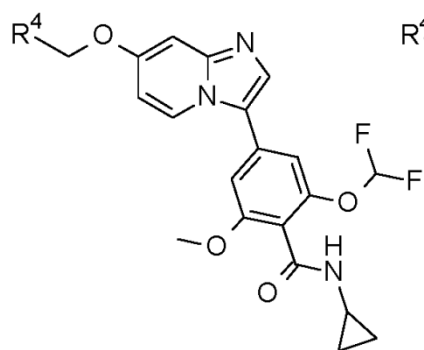
7. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque es de conformidad con cualquiera de las Fórmulas IIIa–IIIc:



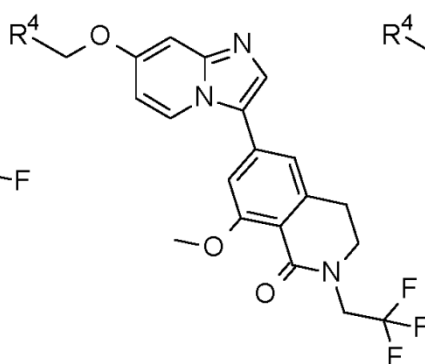
20 8. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–7, caracterizado porque R¹ es –CH₃ o –CH₂CH₃, cada uno de los cuales está sustituido con un grupo R⁴.

9. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque es de conformidad con cualquiera de las Fórmulas IVa–IVf:

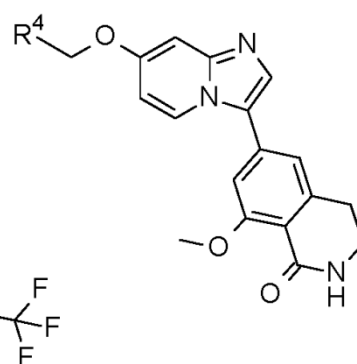
5



IVa

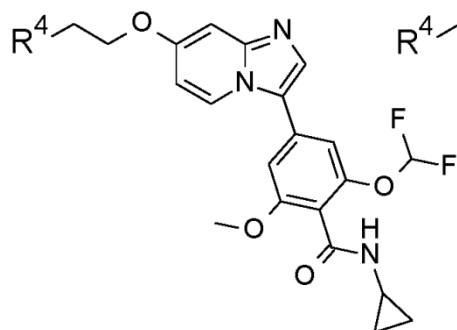


IVb

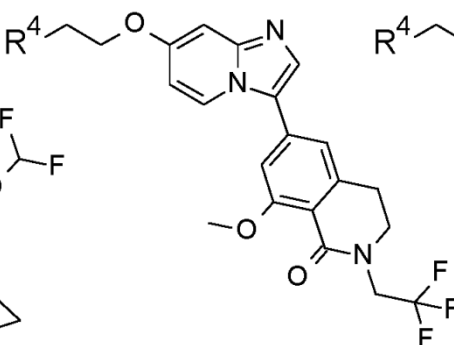


IVc

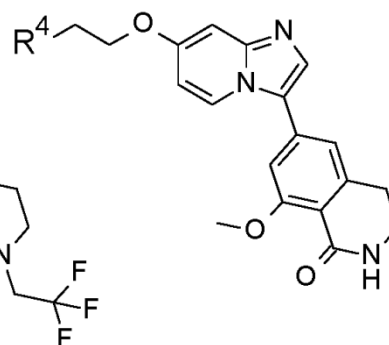
10



IVd



IVe



IVf

15

10. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–9, caracterizado porque R^4 es $-\text{NH}-\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)_2$, o $-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CHF}_2$.

20

11. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–9, caracterizado porque R^4 es azetidinilo, oxetanilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, tetrahidropiranilo, morfolinilo, dioxanilo, 2-oxa-5-azabicyclo[2.2.1]heptanilo, 3-oxa-8-azabicyclo[3.2.1]octanilo, 8-oxa-3-azabicyclo[3.2.1]octanilo.

25

12. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–9 y 11, caracterizado porque R^4 es morfolinilo.

13. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con

cualquiera de las reivindicaciones 1–9 y 11, caracterizado porque R^4 es dioxanilo.

14. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un portador farmacéuticamente aceptable y una cantidad farmacéuticamente eficaz de un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1–13.

5

10

15

20

25