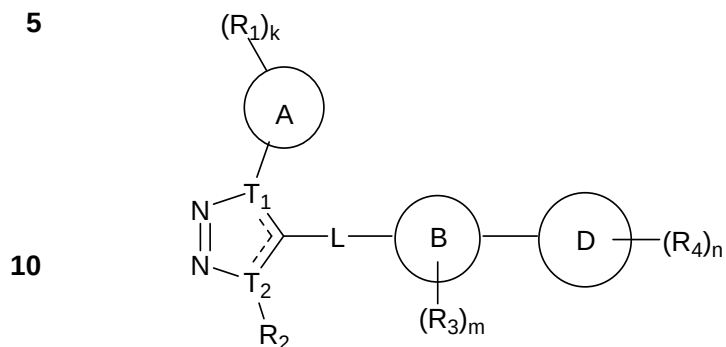


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I, un isómero *cis-trans* del mismo, un enantiómero del mismo, un diastereómero del mismo, un racemato del mismo, un solvato del mismo, un hidrato del mismo, una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o un profármaco del mismo,



(I)

en donde

15 el anillo A se selecciona de un anillo de benceno o un anillo de heteroarilo de 5 a 6 miembros;

20 cada R_1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} y/o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituyen opcionalmente por 1 a 3 R' ;

25 cada R' se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, metilo, ciclopropilo o metoxi;

k es 0, 1, 2, o 3;

30 T_1 y T_2 se seleccionan cada uno independientemente de un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno;

35 R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

L se selecciona de $-CH_2-O-$, $-CH=CH-$, o $-CH_2-NH-$;

40 el anillo B se selecciona de un anillo de benceno o un anillo de heteroarilo de 5 a 10 miembros;

45 cada R_3 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

m es 0, 1, 2, o 3;

50 el anillo D se selecciona de un anillo de heterocicloalquilo de 4 a 14 miembros;

2

cada R_4 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, =O, $-R_5$, $-OR_6$, $-COOR_6$, $-C(O)R_5$, $-NR_6R_7$, $-NR_6COR_5$, $-NR_6SO_2R_5$, $-CH_2-C(O)NR_6R_7$, $-C(O)NR_6R_7$, $-SO_2R_6$ o $-SO_2NR_6R_7$;

5 R_5 se selecciona de alquilo de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, arilo de 6 a 10 miembros, aril(C_{1-3})alquilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

10 R_6 y R_7 se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, ciano, alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, arilo de 6 a 10 miembros, aril(C_{1-6})alquilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-6})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

15 cuando R_4 se selecciona de $-NR_6R_7$, $-C(O)NR_6R_7$ o $-SO_2NR_6R_7$, R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

20 cada R se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, $-COOH$, alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

n es 0, 1, 2, 3, 4, 5, o 6.

25 2. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el anillo A se selecciona de un anillo de benceno o un anillo de heteroarilo de 5 a 6 miembros;

30 cada R_1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} y/o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituyen opcionalmente por 1 a 3 R' ;

cada R' se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, metilo, ciclopropilo o metoxi;

k es 0, 1, 2, o 3;

35 T_1 y/o T_2 se seleccionan cada uno independientemente de un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno;

R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} ,

3

alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R';

L se selecciona de -CH₂-O-, -CH=CH-, o -CH₂-NH-;

5 el anillo B se selecciona de un anillo de benceno o un anillo de heteroarilo de 5 a 10 miembros;

cada R₃ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R';

m es 0, 1, 2, o 3;

10 el anillo D se selecciona de un anillo de heterocicloalquilo de 4 a 14 miembros;

el anillo D se puede sustituir por uno o más de un R₄ independiente, y cada R₄ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, =O, -R₅, -OR₆, -COOR₆, -C(O)R₅, -NR₆R₇, -NR₆COR₅, -NR₆SO₂R₅, -C(O)NR₆R₇, -SO₂R₆ o -SO₂NR₆R₇;

15 R₅ se selecciona de alquilo de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, arilo de 6 a 10 miembros, aril(C₁₋₃)alquilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C₁₋₃)alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

20 R₆ y/o R₇ se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, hidroxilo, amino, ciano, alquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, arilo de 6 a 10 miembros, aril(C₁₋₆)alquilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C₁₋₆)alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

25 cuando R₄ se selecciona de -NR₆R₇, -C(O)NR₆R₇ o -SO₂NR₆R₇, R₆ y R₇ junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

cada R se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R';

30 n es 0, 1, 2, 3, 4, 5, o 6.

35 3. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

(1) R₂ es heteroarilo de 5 a 6 miembros;

(2) cada R_4 es independientemente $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_6\text{R}_7$; y

(3) cada R es independientemente COOH .

5 4. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

(1) en el anillo A y R_2 , el heteroátomo en el heteroarilo de 5 a 6 miembros se selecciona de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S, y el número del heteroátomo es 1, 2 o 3;

10 (2) en el anillo B, R_5 , R_6 y R_7 , el heteroátomo en el heteroarilo de 5 a 10 miembros se selecciona de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S, y el número del heteroátomo es 1, 2 o 3;

(3) en R_1 , R' , R_2 , R_3 , R_4 y R, el halógeno es independientemente flúor, cloro, bromo o yodo;

15 (4) en R_1 , R_3 , R_5 , R_6 , R_7 y R, el alquilo de C_{1-6} es independientemente metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, isobutilo, *sec*-butilo o *terc*-butilo;

(5) en R_2 , el alquilo de C_{1-3} es independientemente metilo, etilo, *n*-propilo o isopropilo;

(6) en R_1 , R_3 , R_6 , R_7 y R, el alcoxi de C_{1-6} es independientemente metoxi, etoxi, *n*-propoxi, isopropoxi, *n*-butoxi, isobutoxi, *sec*-butoxi o *terc*-butoxi; preferentemente metoxi;

(7) en R_2 , el alcoxi de C_{1-3} es independientemente metoxi, etoxi, *n*-propoxi o isopropoxi;

20 (8) en R_1 , R_2 , R_3 , R_6 , R_7 y R, el alquilamino de C_{1-6} es independientemente $-\text{NHCH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$ o $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, preferentemente $-\text{NMe}_2$;

(9) en R_1 , R_2 , R_3 , R_6 , R_7 y R, el cicloalquilo de C_{3-6} es independientemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo;

25 (10) en R_1 , R_2 , R_3 , R_6 , R_7 y R, el heteroátomo en el heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se selecciona de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S, y el número del heteroátomo es 1, 2 o 3;

(11) en el anillo D, el heterocicloalquilo de 4 a 14 miembros es un grupo monocíclico, bicíclico o tricíclico saturado o semi-saturado que tiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S, en donde el anillo unido directamente al anillo B no es aromático; preferentemente, en el anillo D, el heterocicloalquilo de 4 a 14 miembros es un grupo monocíclico, bicíclico o tricíclico saturado que tiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S;

30 (12) cuando R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, el heterociclo de 4 a 7 miembros es un grupo monocíclico o bicíclico saturado que tiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de 1, 2 o 3 tipos de N, O y S;

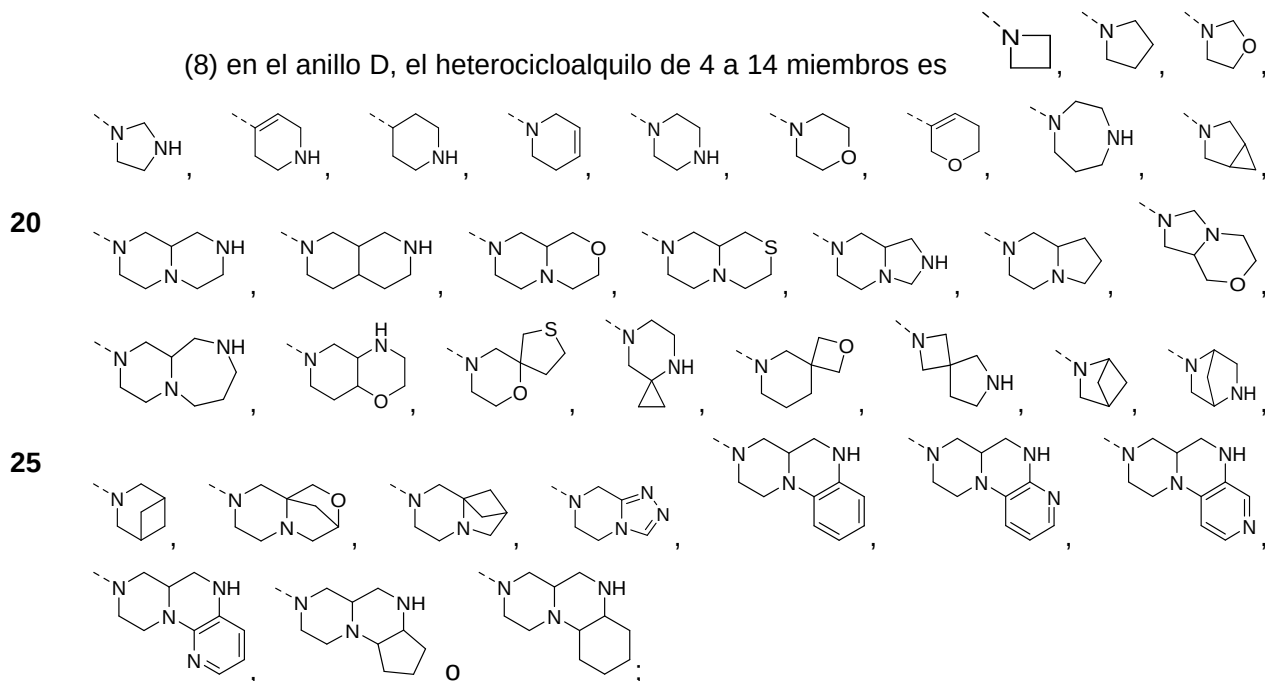
35 y

(13) en R₅, R₆ y R₇, el arilo de 6 a 10 miembros es independientemente fenilo o naftilo.

5. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

- (1) en el anillo A y R₂, el heteroarilo de 5 a 6 miembros es piridilo o isoxazolido;
- (2) en el anillo B, R₅, R₆ y R₇, el heteroarilo de 5 a 10 miembros es piridilo, piridazinilo, pirazinilo o piridopiridazinilo;
- 10 (3) en R₁, R', R₂, R₃, R₄ y R, el halógeno es independientemente flúor o cloro;
- (4) en R₂, el alquilo de C₁₋₃ es independientemente metilo;
- (5) en R₁, R₂, R₃, R₆, R₇ y R, el alquilamino de C₁₋₆ es independientemente -NMe₂;
- (6) en R₁, R₂, R₃, R₆, R₇ y R, el cicloalquilo de C₃₋₆ es independientemente ciclopropilo;
- (7) en R₁, R₂, R₃, R₆, R₇ y R, el heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros es oxetanol, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, morfolinilo, tetrahidropiranilo o piperidinilo;
- 15

(8) en el anillo D, el heterocicloalquilo de 4 a 14 miembros es



(9) cuando R₆ y R₇ junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo

de 4 a 7 miembros, el heterociclo de 4 a 7 miembros es

; y

(10) en R₅, R₆ y R₇, el arilo de 6 a 10 miembros es independientemente fenilo.

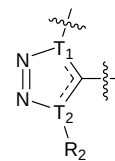
35 6. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del

mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

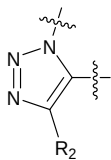
5 (1) cada R_1 es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} o cicloalquilo de C_{3-6} , y el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} o cicloalquilo de C_{3-6} se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

(2) k es 0, 1 o 2;

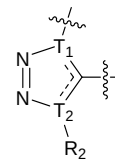
10 (3) R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} o heteroarilo de 5 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;



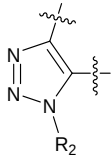
15 (4) cuando T_1 es un átomo de nitrógeno, T_2 es un átomo de carbono, es



20 , R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heteroarilo de 5 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;



25 (5) cuando T_1 es un átomo de carbono, T_2 es un átomo de nitrógeno, es



30 ; R_2 se selecciona de alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} o heteroarilo de 5 a 6 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

(6) cada R_3 es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} o alcoxi de C_{1-3} , cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

(7) m es 0 o 1;

35 (8) cada R_4 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, =O, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heteroaril(C_{1-3})alquilo de

5 a 10 miembros, $-\text{COOH}$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{NR}_6\text{R}_7$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_6\text{R}_7$, $-\text{SO}_2\text{R}_6$ o $-\text{SO}_2\text{NR}_6\text{R}_7$; el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R; cuando R_4 se selecciona de $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_6\text{R}_7$ o $-\text{SO}_2\text{NR}_6\text{R}_7$, R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

(9) R_6 y R_7 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

(10) cada R se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, $-\text{COOH}$, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

(11) n es 0, 1, 2, 3, o 4;

(12) el anillo A es un anillo de benceno, un anillo de piridina o un anillo de pirimidina;

(13) L es $-\text{CH}_2-\text{O}-$;

(14) el anillo B es un anillo de benceno, un anillo de piridina, un anillo de piridazina, un anillo de pirazina o un anillo de piridopiridazina; y

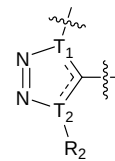
(15) cada R_3 es independientemente H, F, Cl, CN, Me u $-\text{OCH}_3$.

7. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

(1) cada R_1 es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} o alcoxi de C_{1-3} , y el alquilo de C_{1-3} y/o alcoxi de C_{1-3} se sustituyen opcionalmente por 1 a 3 R' ; cada R' es independientemente hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano o metoxi; por ejemplo, cada R' es independientemente hidrógeno, halógeno o hidroxilo;

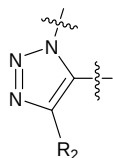
(2) k es 1;

(3) R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} o cicloalquilo de C_{3-6} , cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;



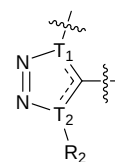
(4) cuando T_1 es un átomo de nitrógeno, T_2 es un átomo de carbono, es

5



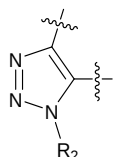
, R_2 se selecciona de hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , alquilo de C_{1-3} sustituido por ciclopropilo o hidroxilo, o heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido por alquilo de C_{1-3} ;

10



(5) cuando T_1 es un átomo de carbono, T_2 es un átomo de nitrógeno, es

15



, R_2 se selecciona de Me o CHF_2 ; preferentemente, R_2 es Me;

(6) m es 0;

(7) cada R_4 se selecciona independientemente de los siguientes sustituyentes:

20 hidrógeno, ciano, =O, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, $-COOH$, $-C(O)NR_6R_7$, $-SO_2R_6$ o $-SO_2NR_6R_7$; el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R; cuando R_4 se selecciona de $-C(O)NR_6R_7$ o $-SO_2NR_6R_7$, R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

25

(8) cada R se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R';

30

(9) n es 1 o 2;

(10) el anillo A es un anillo de benceno o un anillo de piridina;

(11) el anillo B es un anillo de piridina, un anillo de piridazina, un anillo de pirazina o un

35 anillo de piridopiridazina; por ejemplo, el anillo B es un anillo de piridina, un anillo de piridazina

o un anillo de piridopiridazina; y

(12) cada R_3 es independientemente H, CN, Me u $-OCH_3$.

8. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

(1) cuando T_1 es un átomo de nitrógeno, T_2 es un átomo de carbono y R_2 se selecciona

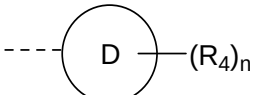
de H, F, Cl, CN, Me, CHF_2 , CF_3 , $-CH_2OH$, $-CH_2OCH_3$, ; preferentemente, R_2

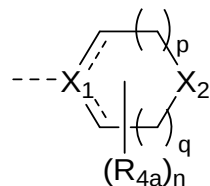
se selecciona de H, Cl, Me, CH_2OH , CN, CHF_2 , CF_3 , ; y

(2) cada R_1 es independientemente H, F, Cl, Me, CN, $-CH_2F$, $-CF_2H$, CF_3 , $-OCF_2H$, -

$CH(CN)_2$, $-CH_2OH$, $-CH_2OCH_3$, o ; preferiblemente, cada R_1 es independientemente F, Cl, Me, $-CH_2F$, $-CF_2H$, CF_3 , CN, $-CH(CN)_2$, $-CH_2OH$, $-CH_2OCH_3$, o $-OCF_2H$.

9. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

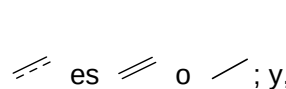
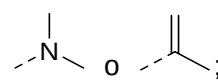
(1) la porción estructural  es la porción estructural (II)



(II)

en donde

X_1 se selecciona de N o C;

; y,  se selecciona de ;

X_2 es un átomo de carbono, $-NR_{4c}$, $-O-$ o $-S(O)_w-$, el átomo de carbono se sustituye por

uno o dos R_{4b} independientes, y cada R_{4b} se selecciona independientemente de hidrógeno, -OR₆, -NR₆R₇, -NR₆COR₅, -C(O)NR₆R₇ o -SO₂NR₆R₇;

R_5 es alquilo de C₁₋₃, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3

5 R';

R_6 y R_7 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₃, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C₁₋₃)alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C₁₋₃)alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

10 cuando R_{4b} es -NR₆R₇, -C(O)NR₆R₇ o -SO₂NR₆R₇, R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, el heterociclo puede contener 1 a 3 heteroátomos como átomos de anillo, los heteroátomos se pueden seleccionar independientemente de átomos de N, O y S, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

15 cada R_{4c} es independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₃, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C₁₋₃)alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C₁₋₃)alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

20 cada R es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C₁₋₃, alcoxi de C₁₋₃, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C₁₋₃, alcoxi de C₁₋₃, alquilamino de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆ o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R';

25 cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, oxo, ciano, alquilo de C₁₋₃, -COOR₆, -CH₂-C(O)NR₆R₇, -C(O)NR₆R₇, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros; el alquilo de C₁₋₃, cicloalquilo de C₃₋₆, heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R', y el R' es como se define de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5 y 7;

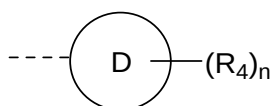
30 o dos R_{4a} unidos al mismo átomo de carbono forman conjuntamente un heterociclo saturado de 3 a 6 miembros, el heterociclo puede contener 1 a 3 heteroátomos como átomos de anillo, los heteroátomos se pueden seleccionar independientemente de átomos de N, O y S, y el heterociclo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R;

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

p y q son cada uno independientemente 0, 1 o 2, y p y q no son ambos 2;

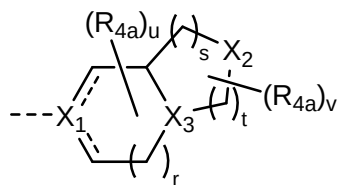
w es 0, 1, o 2;

(2) la porción estructural



es la porción estructural (III)

5

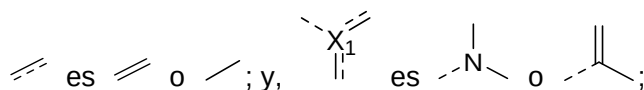


(III)

en donde

10

X_1 es N o C;



X_2 es un átomo de carbono sustituido por uno o dos R_{4b} , $-NR_{4c}$, $-O-$ o $-S(O)_w$ independientes, y el R_{4b} es hidrógeno, $-OR_6$, $-NR_6R_7$, $-NR_6COR_5$, $-NR_6SO_2R_5$, $-C(O)NR_6R_7$, $-SO_2R_5$ o $-SO_2NR_6R_7$;

15

R_5 es alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

20

R_6 y R_7 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R ;

25

cuando R_{4b} es $-NR_6R_7$, $-C(O)NR_6R_7$ o $-SO_2NR_6R_7$, R_6 y R_7 junto con el átomo de N al cual se unen pueden formar un heterociclo de 4 a 7 miembros, el heterociclo puede contener 1 a 3 heteroátomos como átomos de anillo, los heteroátomos se pueden seleccionar independientemente de átomos de N, O y S, y el heterociclo de 4 a 7 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R ;

30

el R_{4c} es hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R ;

35

cada R es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

X_3 es CR_{4a} o N;

cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, oxo, ciano, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo o heteroarilo de 5 a 6 miembros; el alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo o heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' , y el R' es como se define de conformidad

5 con al menos una de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5 y 7;

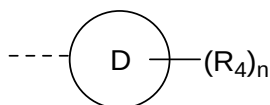
u y v son cada uno independientemente 0, 1, 2, 3, o 4;

r, s, y t son cada uno independientemente 0, 1, o 2;

w es 0, 1, o 2;

10

(3) la porción estructural



es la porción estructural (IV)

15

(IV)

en donde

R_{4c} es hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, fenilo, fenil(C_{1-3})alquilo, heteroarilo de 5 a 10 miembros o heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R ;

20

cada R es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros, y el alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' ;

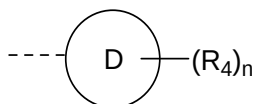
25

cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, ciano, oxo, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros; el alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' , y el R' es como se define de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5 y 7;

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, o 4;

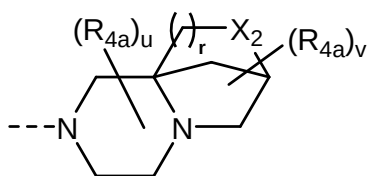
30

(4) la porción estructural



es la porción estructural (V)

35



5

(V)

en donde

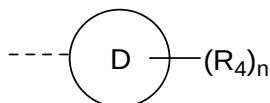
X_2 es un átomo de carbono sustituido por uno o dos R_{4a} u -O- independientes,

cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} ,

10 heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros, o dos R_{4a} unidos al mismo átomo de carbono forman conjuntamente un grupo oxo($C=O$); el alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' , y el R' es como se define de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5 y 7;

15 u y v se seleccionan cada uno independientemente de 0, 1, 2, 3, o 4;

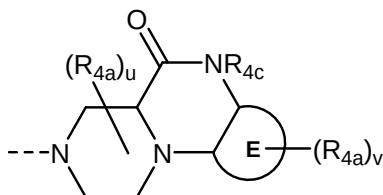
r se selecciona de 0 o 1; y



(5) la porción estructural

es la porción estructural (VI)

20



(VI)

25

en donde

el anillo E es un anillo de cicloalquilo saturado de 5 a 6 miembros, un anillo de benceno o un anillo de heteroarilo de 5 a 6 miembros;

cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, oxo, halógeno, ciano, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros; el alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 R' , y el R' es como se define de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 2, 4 a 5 y 7;

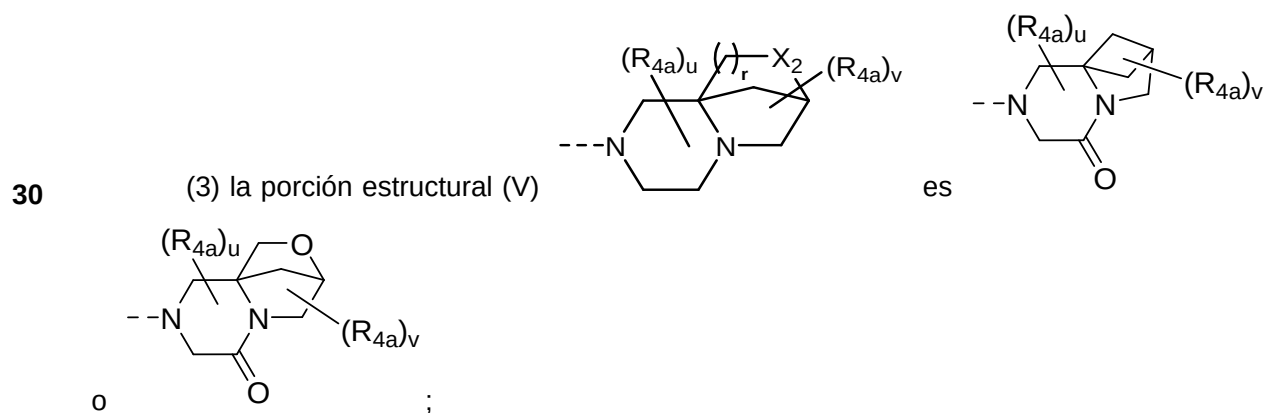
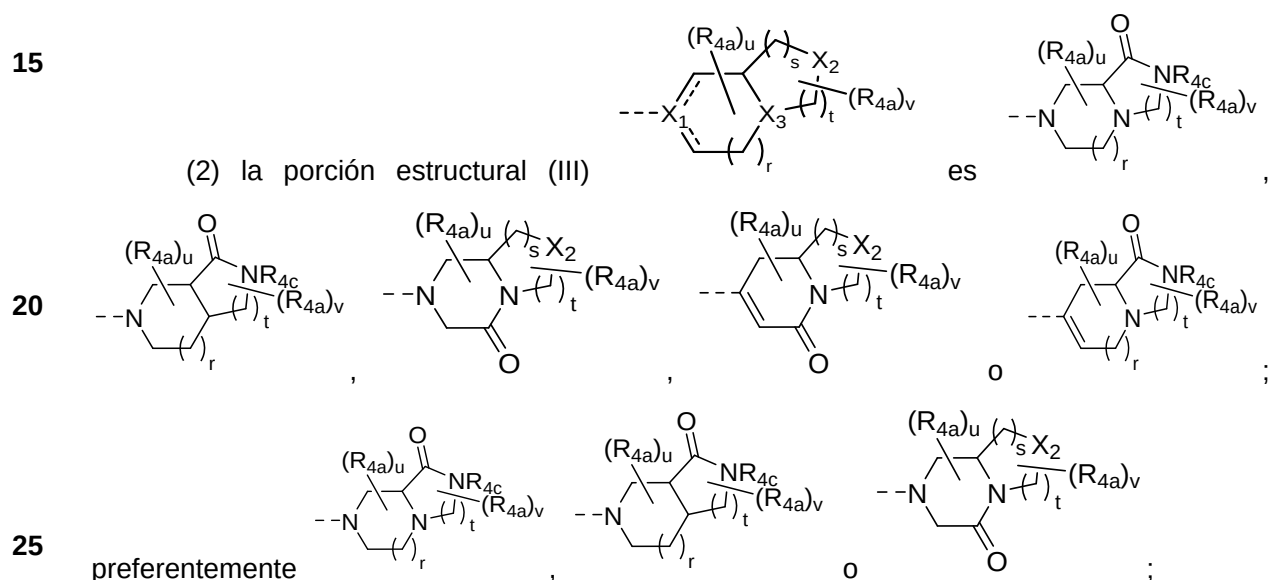
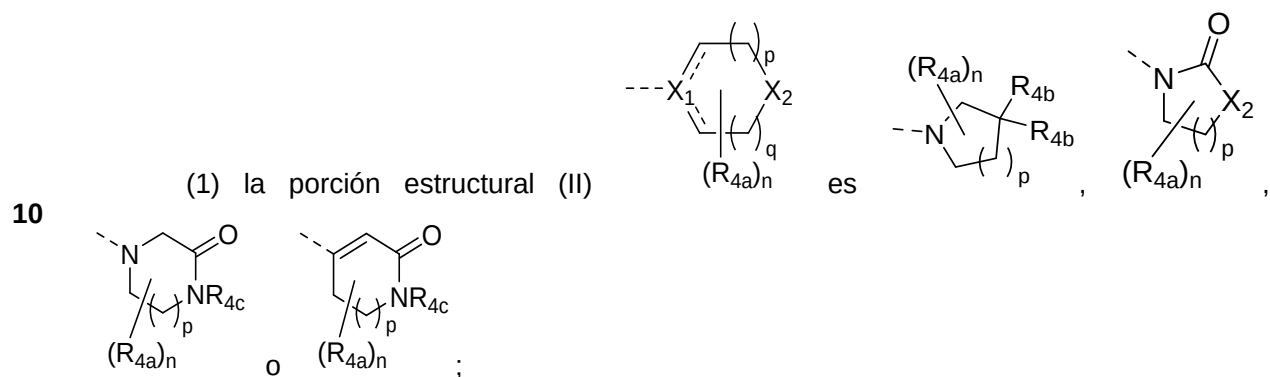
30 R_{4c} es hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros; preferentemente, R_{4c} es hidrógeno;

35

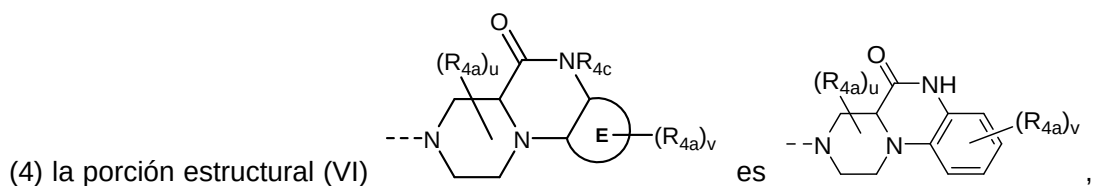
u y v son cada uno independientemente 0, 1, 2, 3, o 4.

10. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque satisface una o más de una de las

5 siguientes condiciones:

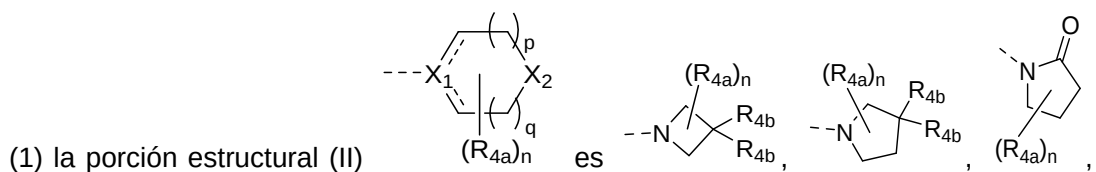


5

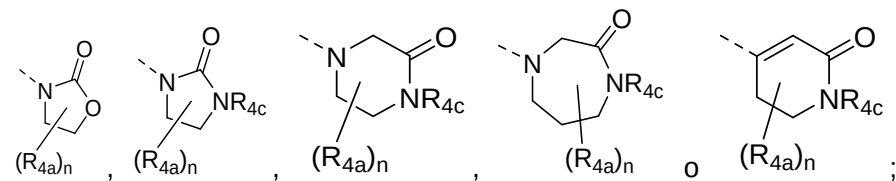


[illegible]

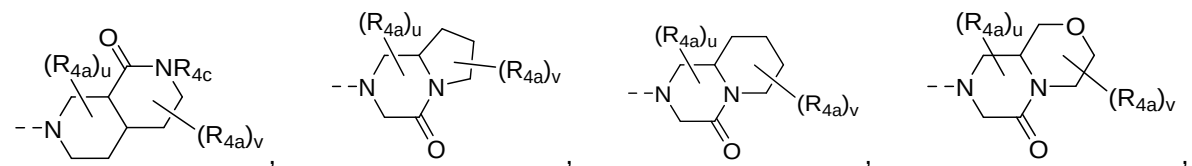
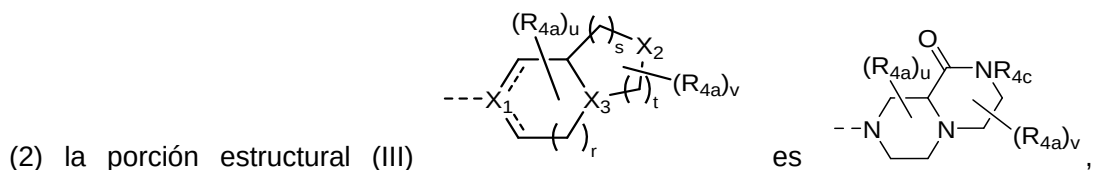
20

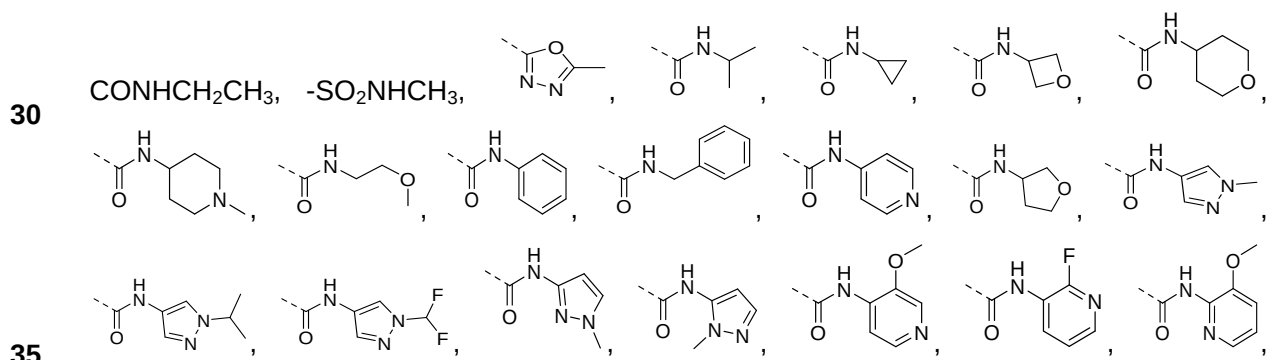
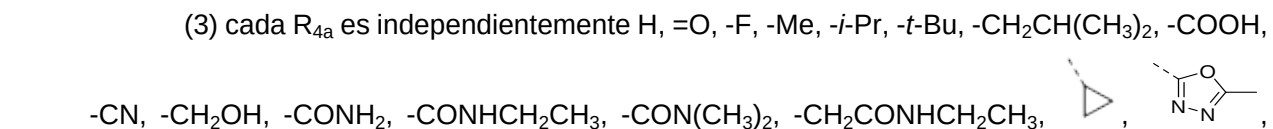
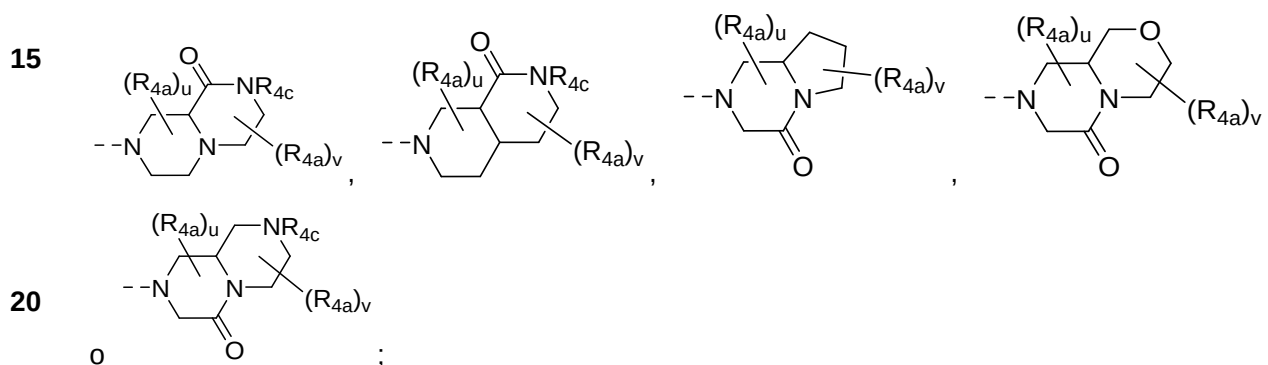
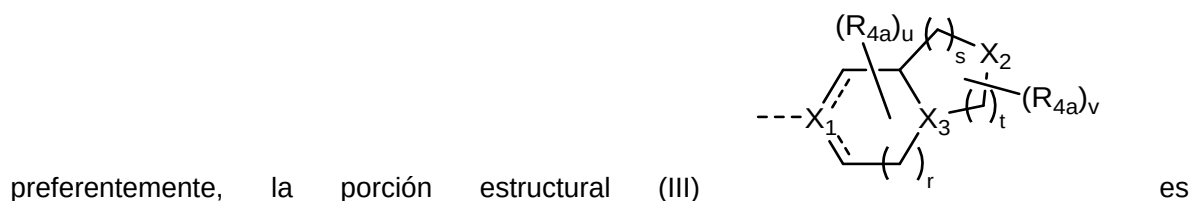
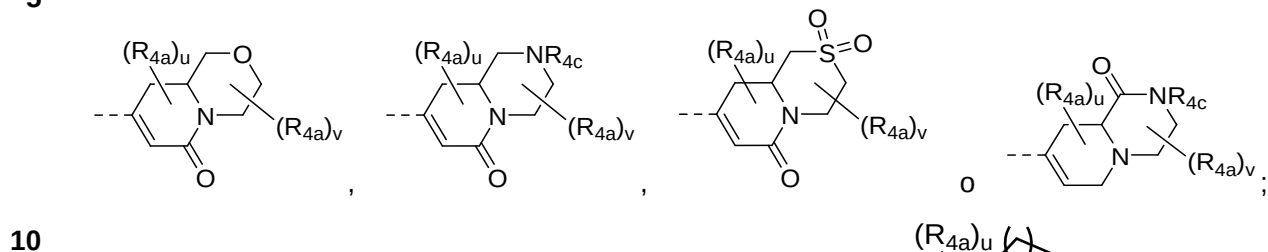
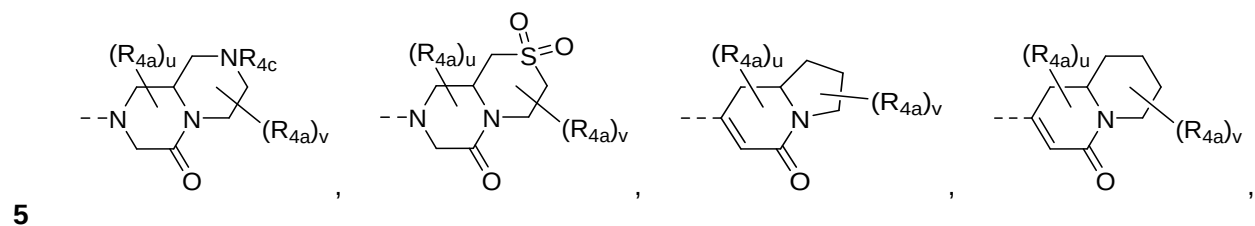


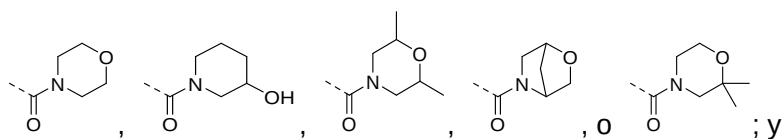
25



30

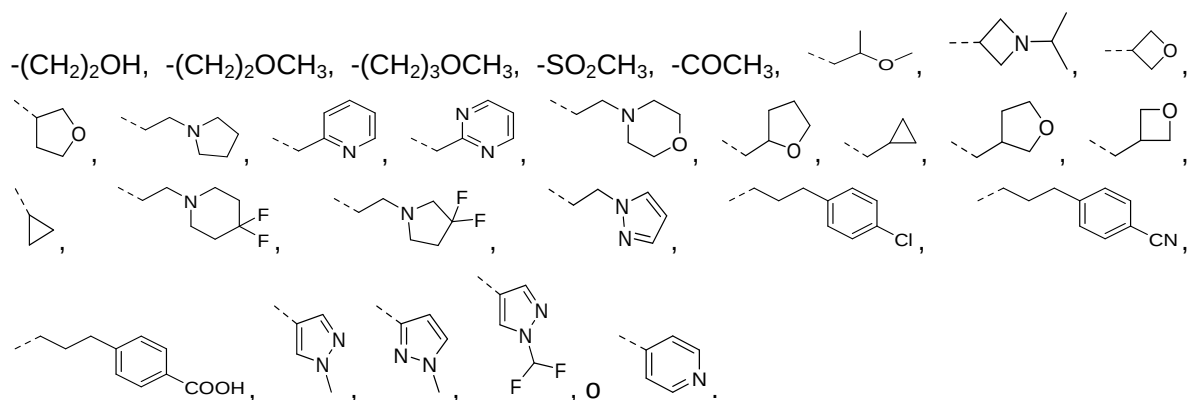






(5) cada R_{4c} es independientemente H, -Me, -CH₂CF₃, -CH₂CN, -(CH₂)₃CN, -(CH₂)₂NH₂,

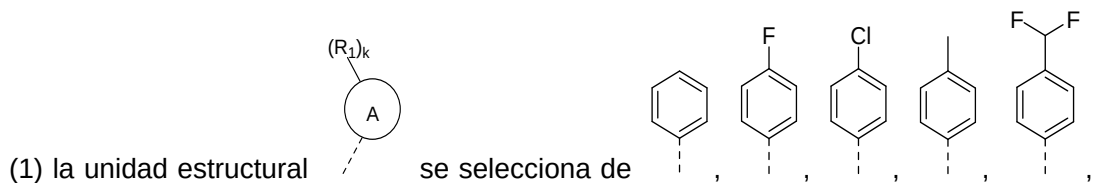
5



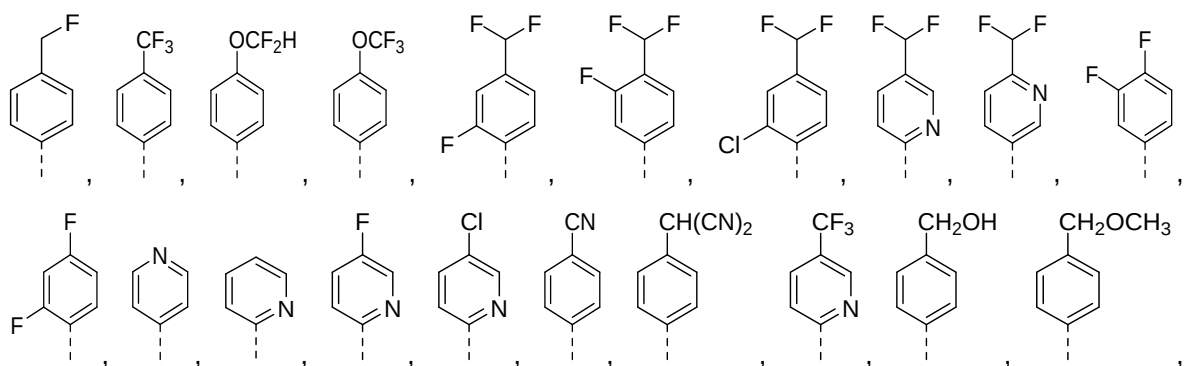
10

12. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

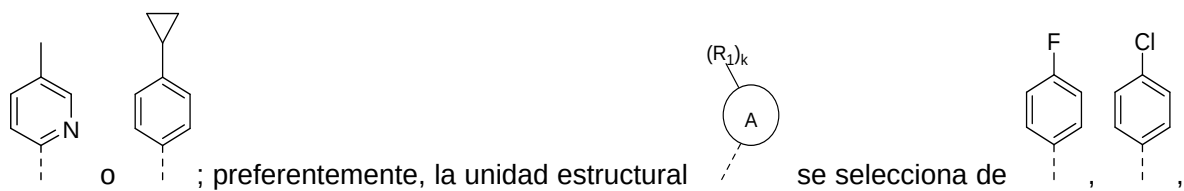
20



25

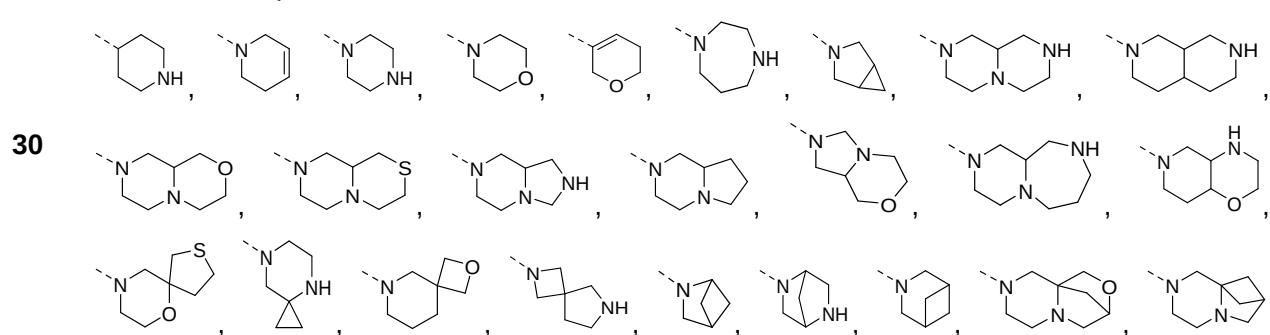
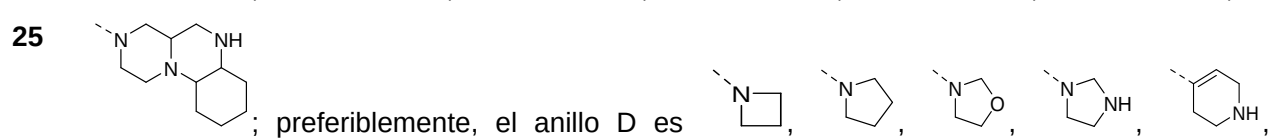
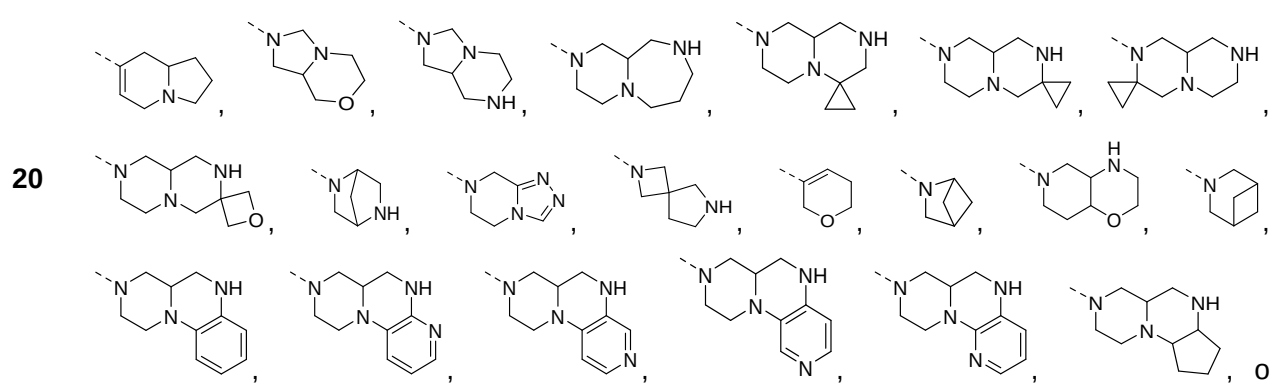
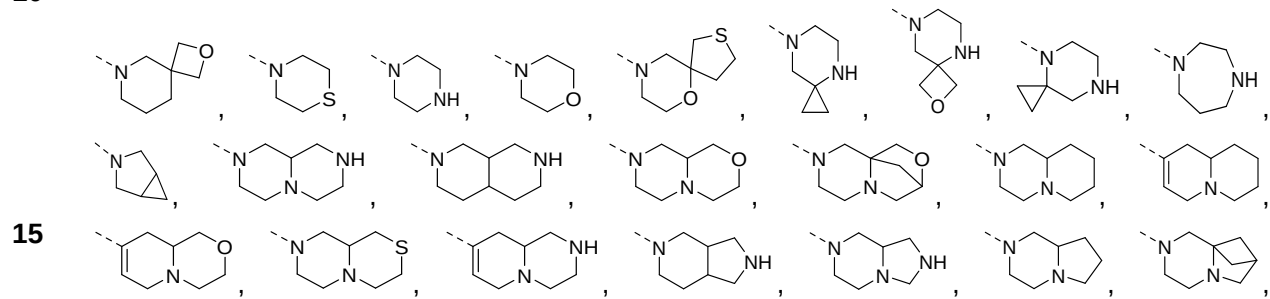
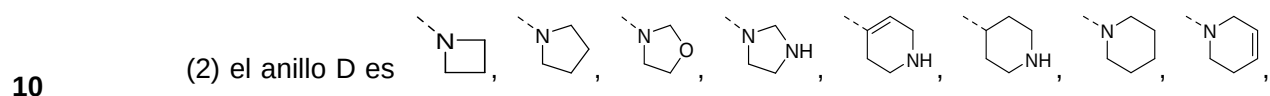
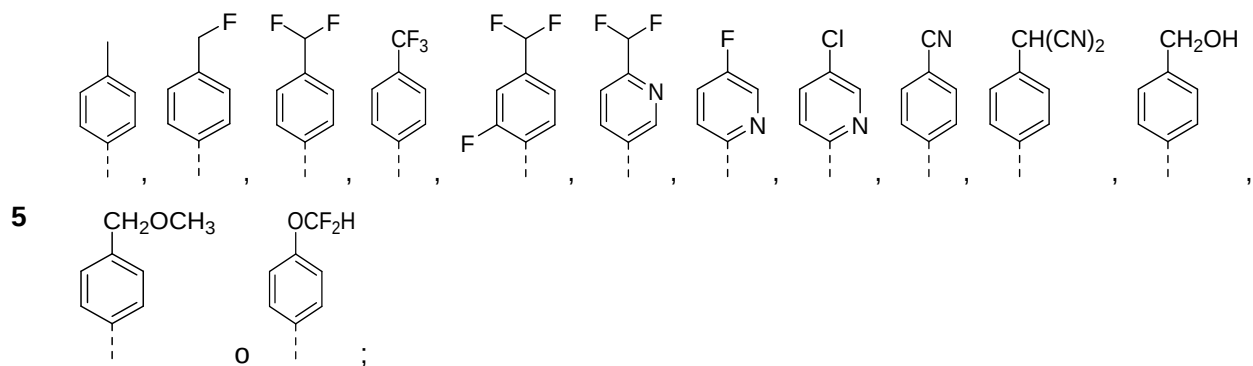


30

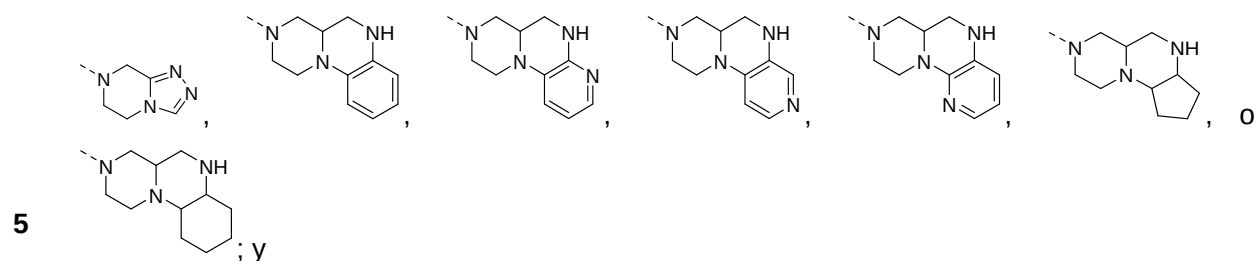


35

19



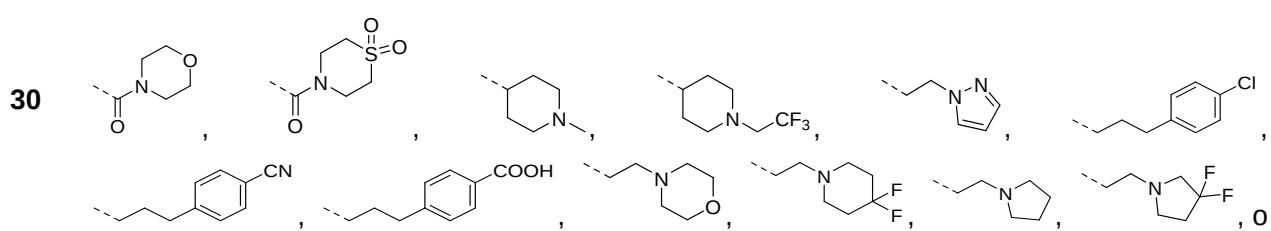
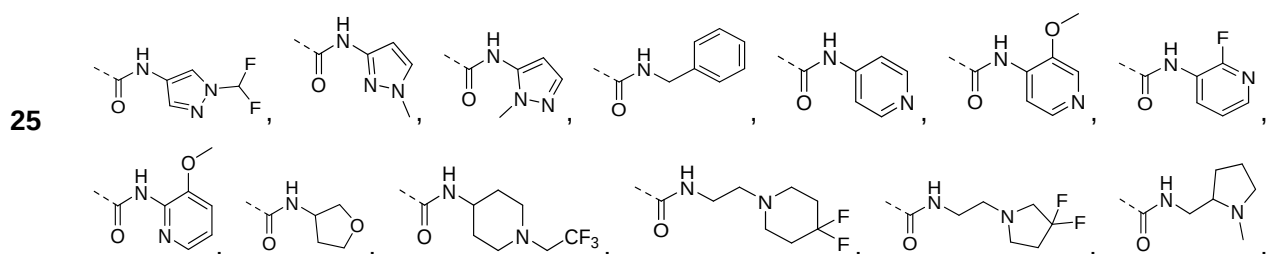
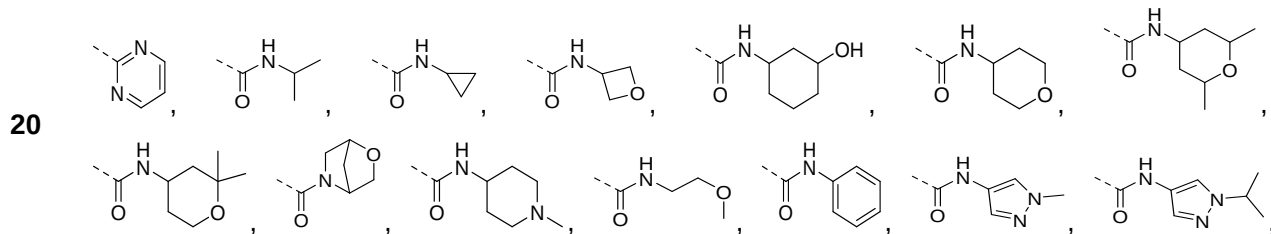
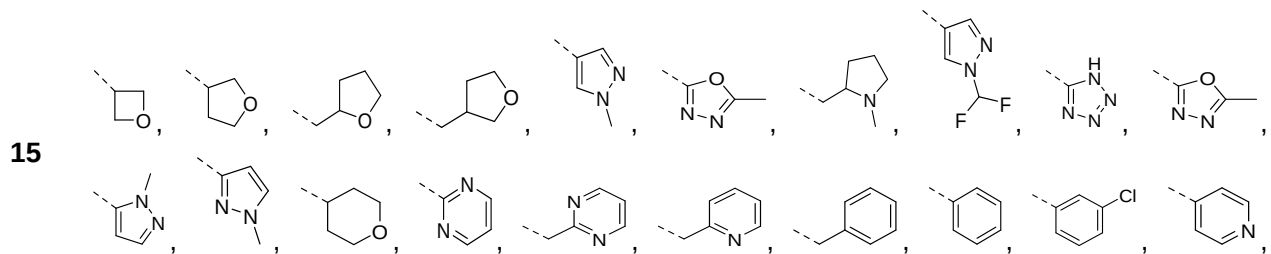
20



(3) cada R_4 es independientemente H, F, Cl, =O, -Me, -COOH, -Et, -*i*-Pr, -*t*-Bu, -CH₂CH(CH₃)₂, -CF₃, -CHF₂, -CH₂CF₃, -CH₂CF₂, -CN, -CH₂CN, -(CH₂)₂CN, -(CH₂)₃CN, -CH₂OH, -(CH₂)₂OH, -CH₂OCH₃, -OCH₃, -NMe₂, -NHCOCH₃, -NHCO₂CH₃, -SO₂Me, -CONH₂, -CONHCH₃, -CON(CH₃)₂, -CONHCH₂CH₃, -SO₂NHCH₃, -COCH(CH₃)₂, -CONHCH₂CH₃, -CH₂CONHCH₂CH₃, -

10

-(CH₂)₂NH₂, -(CH₂)₂OCH₃, -(CH₂)₃OCH₃, -COCH₃,



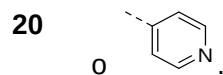
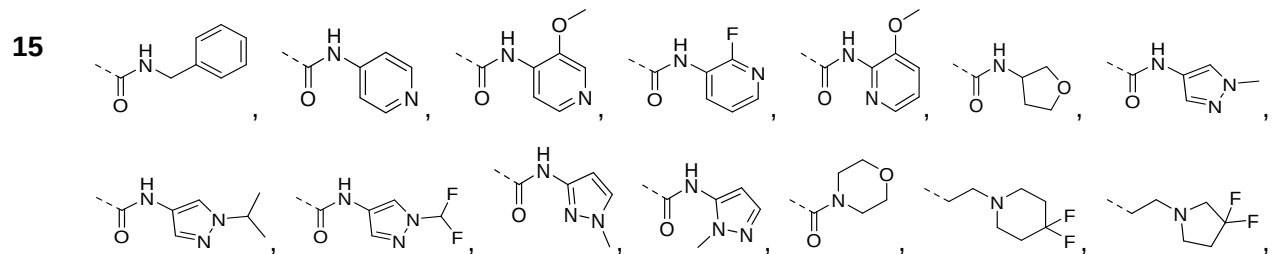
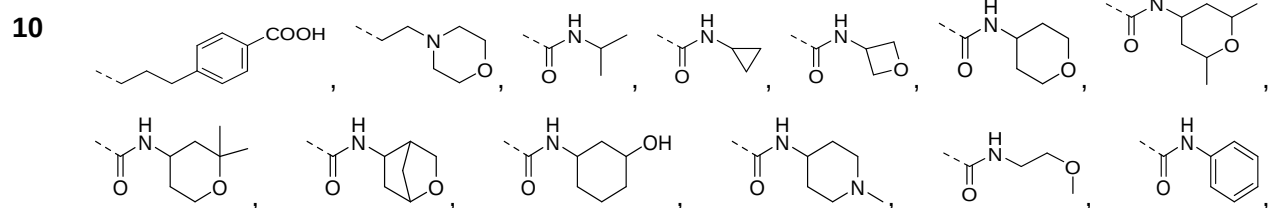
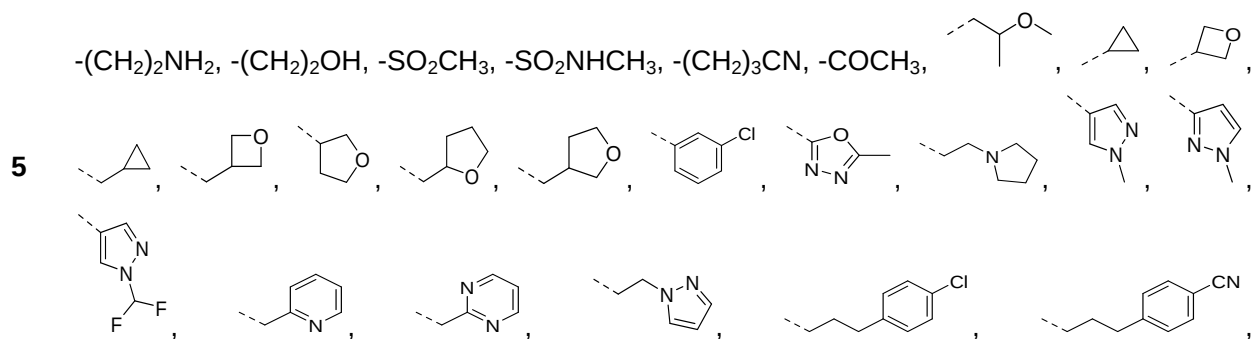
35

; preferiblemente, cada R_4 es independientemente H, F, =O, -Me, -*i*-Pr, -*t*-Bu, -CH₂CH(CH₃)₂, -OCH₃, -(CH₂)₂OCH₃, -(CH₂)₃OCH₃, -NMe₂, -COOH, -CN, -CH₂CN, -CH₂OH, -

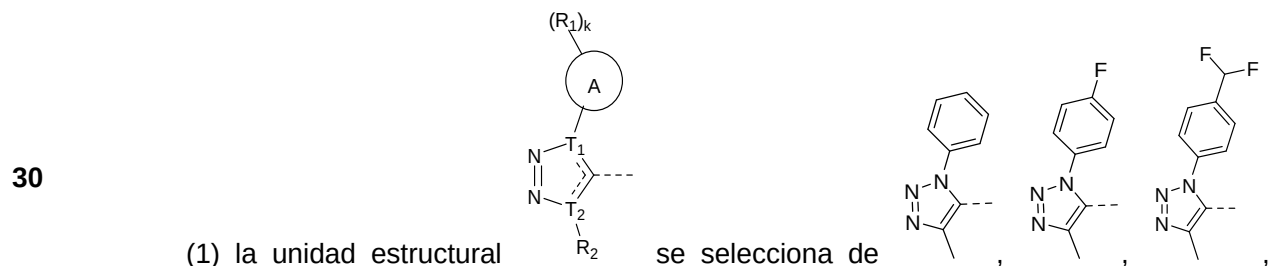
21

CONH₂, -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃, -CON(CH₃)₂, -CH₂CONHCH₂CH₃, -NHCOCH₃, -CH₂CF₃,

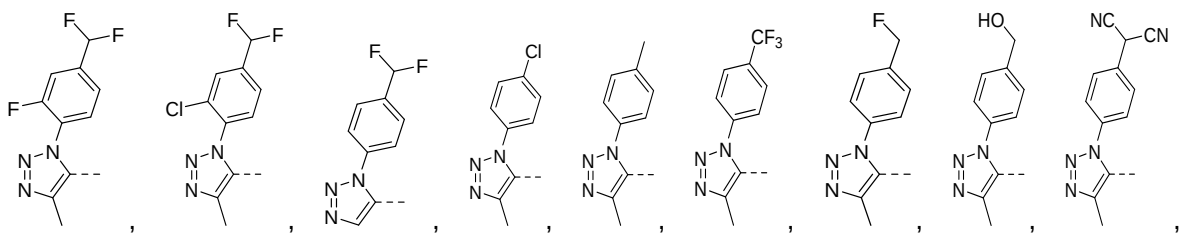
-(CH₂)₂NH₂, -(CH₂)₂OH, -SO₂CH₃, -SO₂NHCH₃, -(CH₂)₃CN, -COCH₃,



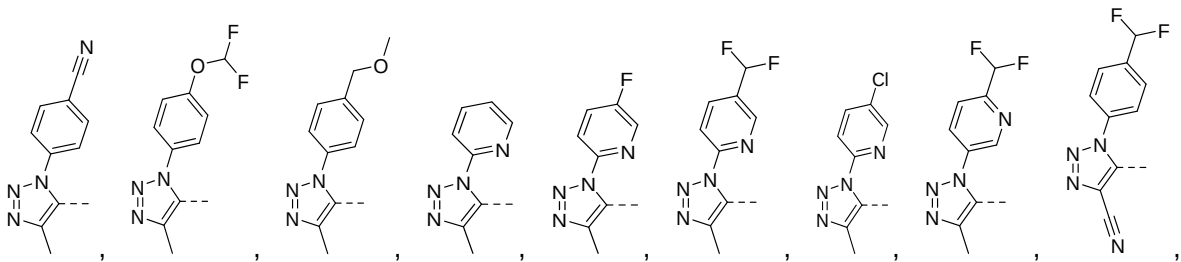
13. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:



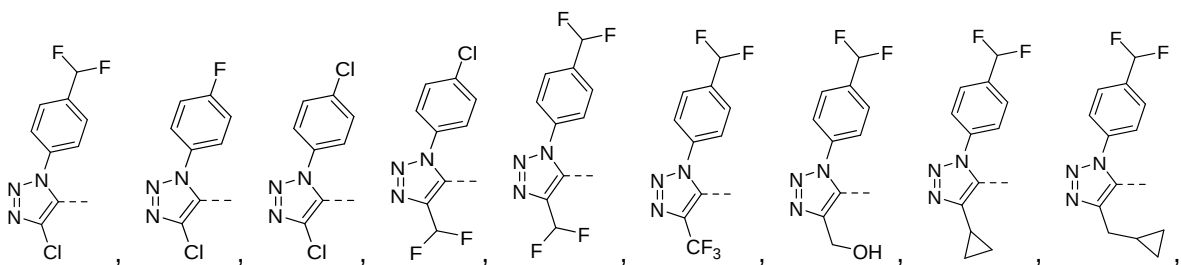
5



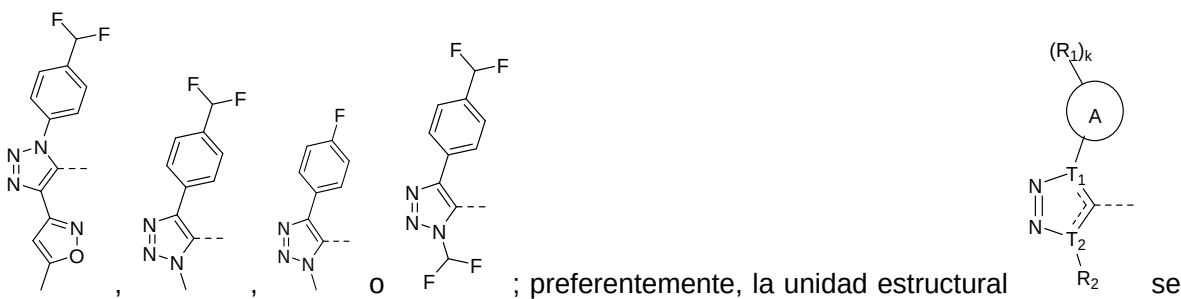
10



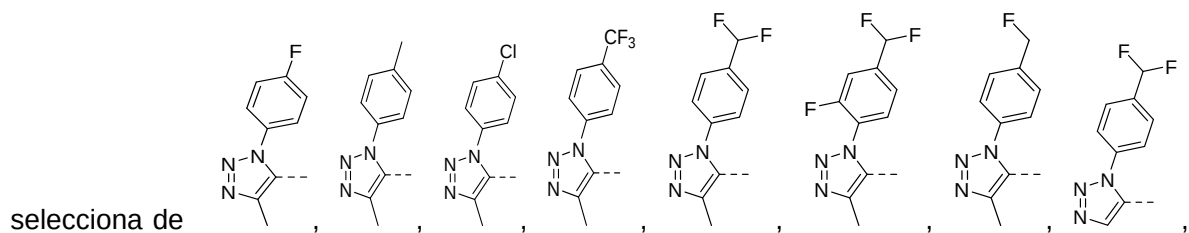
15



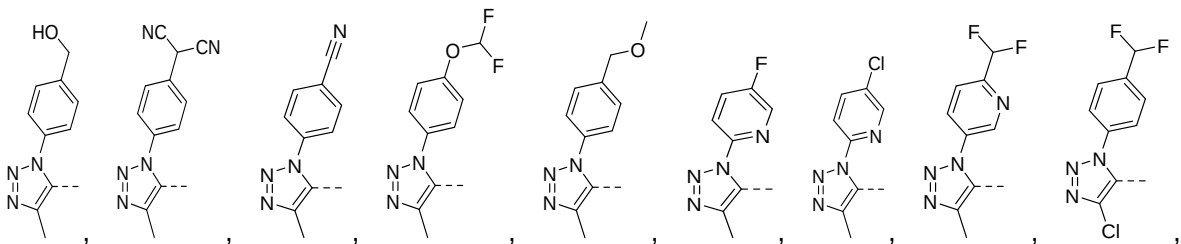
20



25

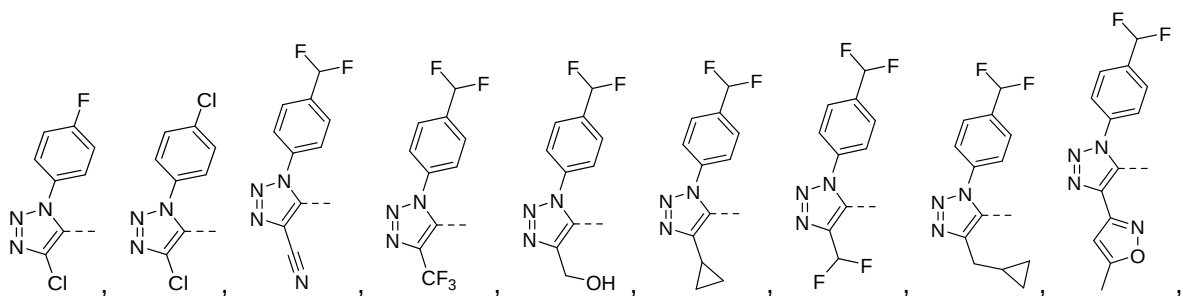


30

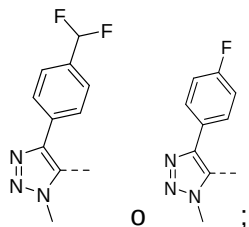


35

5

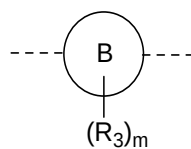


10

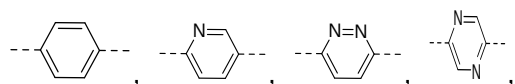


15

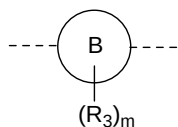
(2) la porción estructural



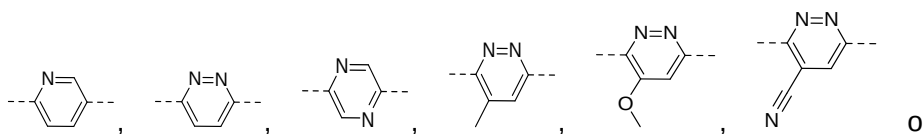
es



20

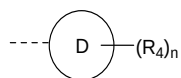


es



25

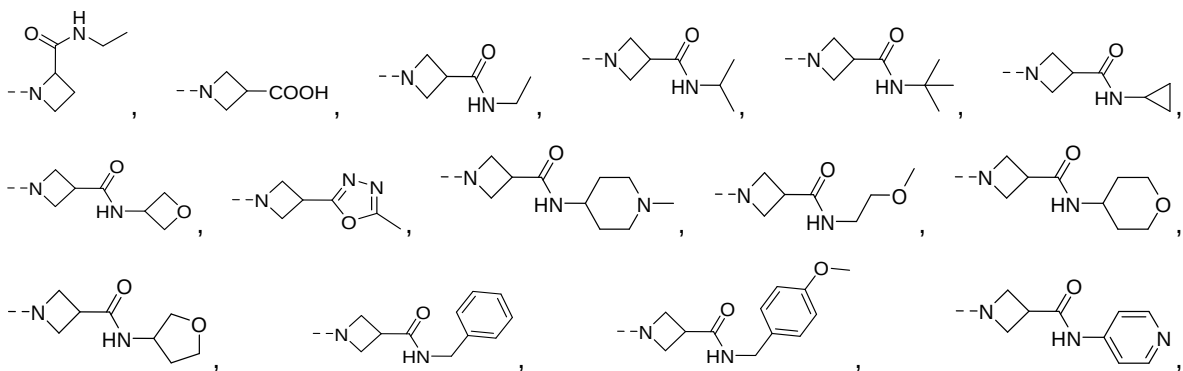
(3) la porción estructural



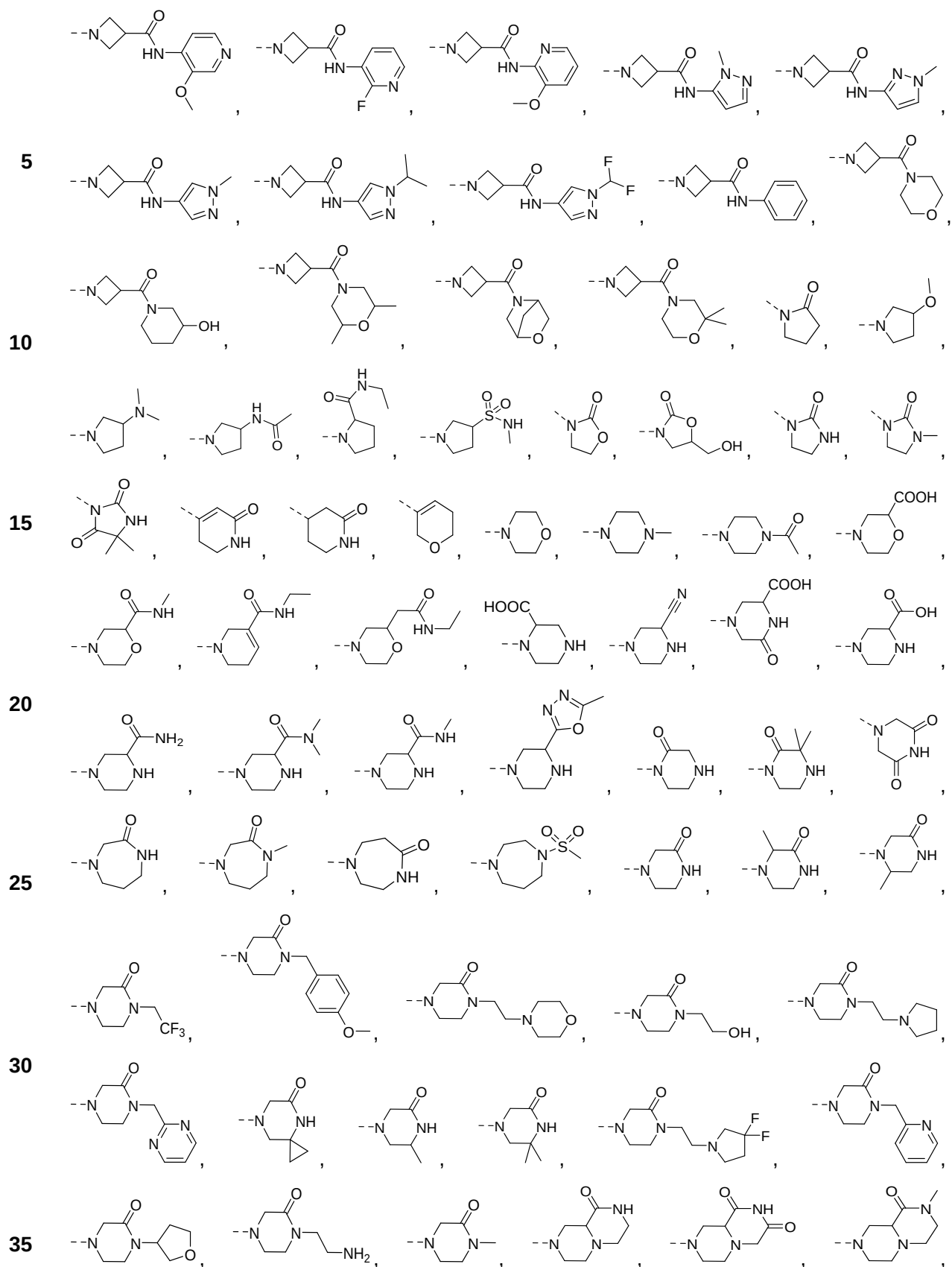
es los siguientes sustituyentes:

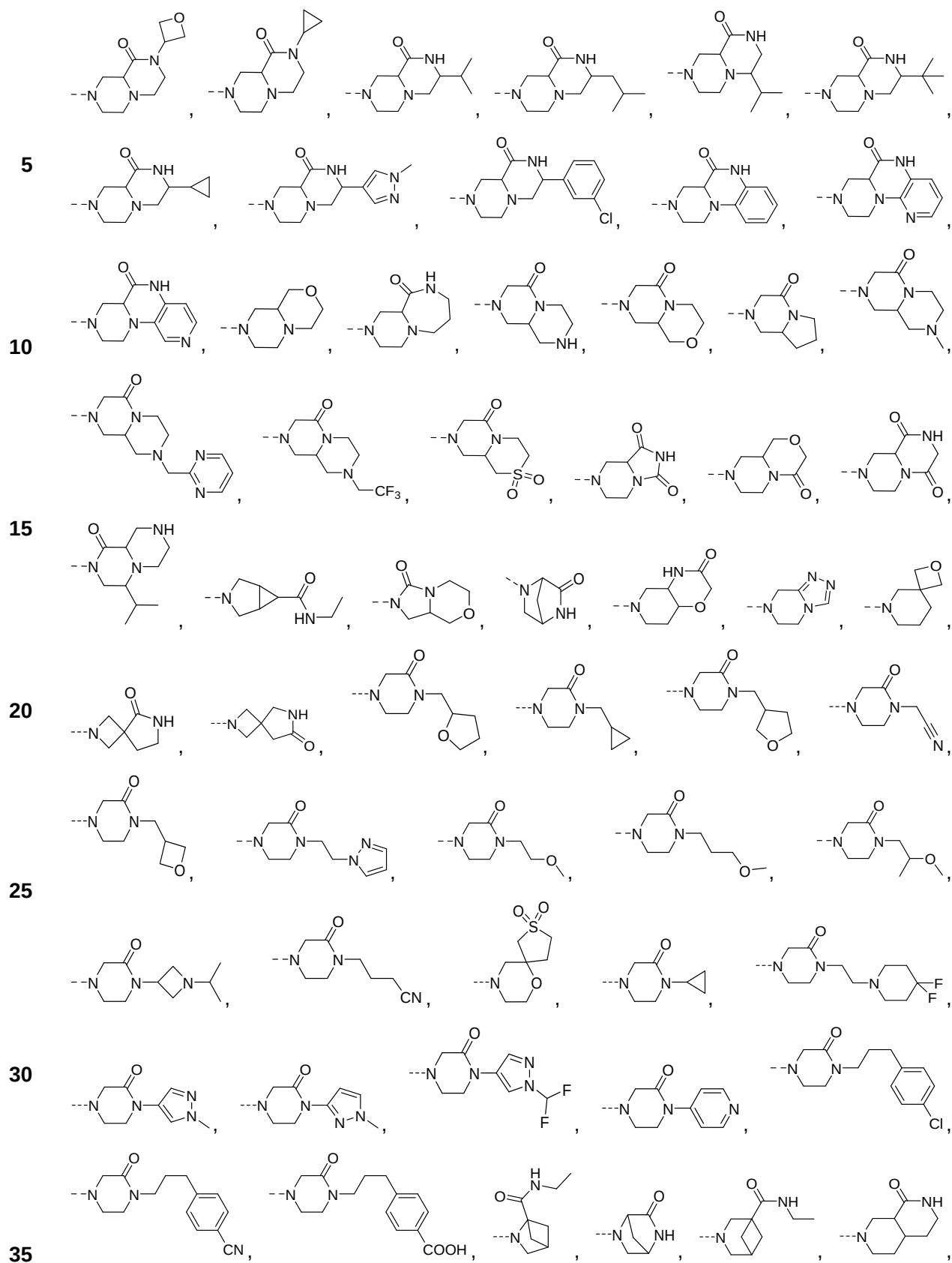


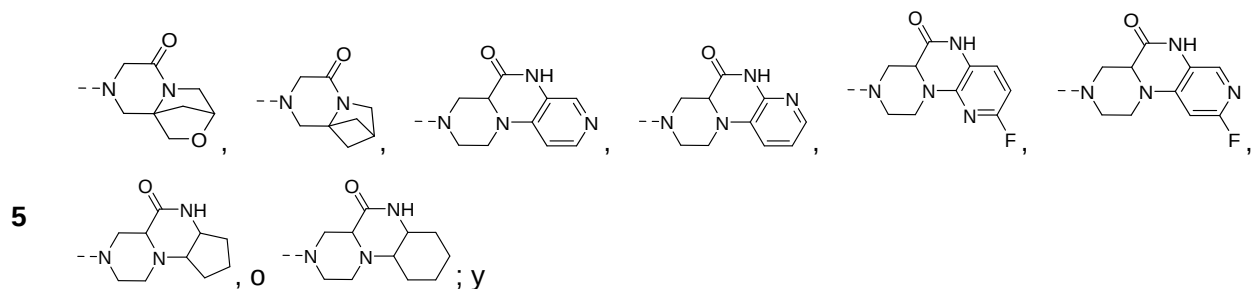
30



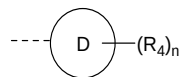
35





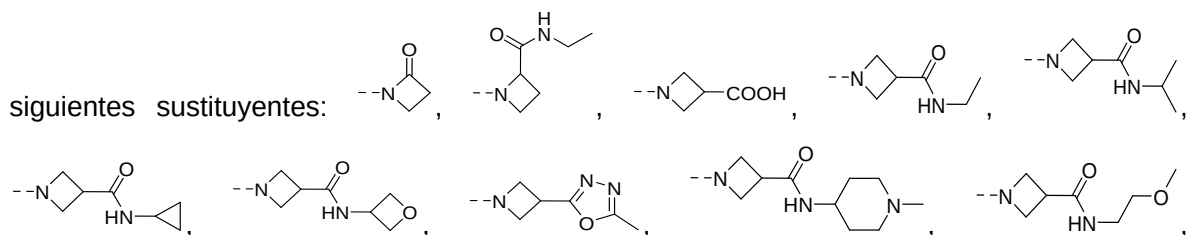


(4) preferentemente, la porción estructural

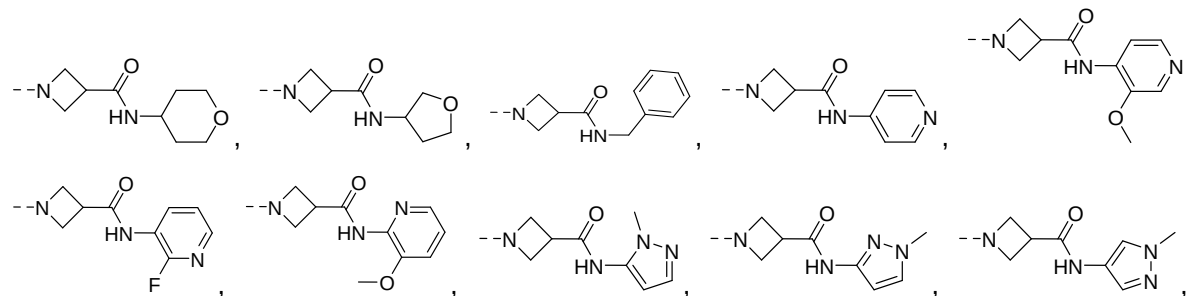


se selecciona de los

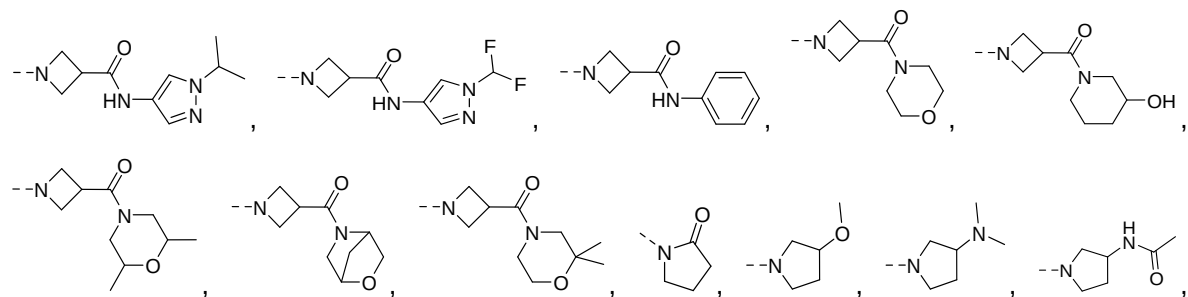
10



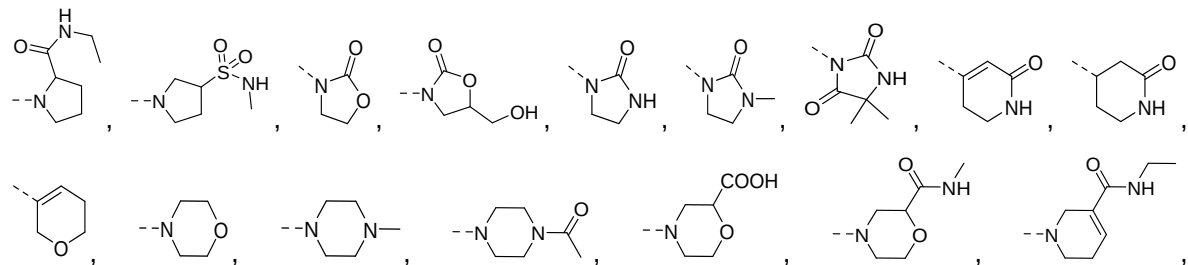
15



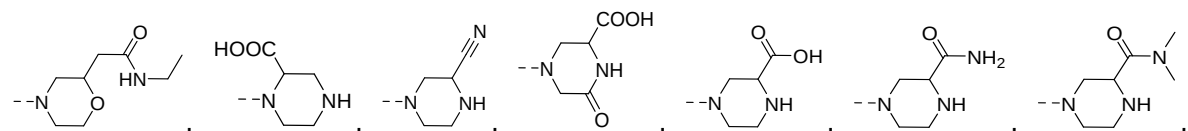
20



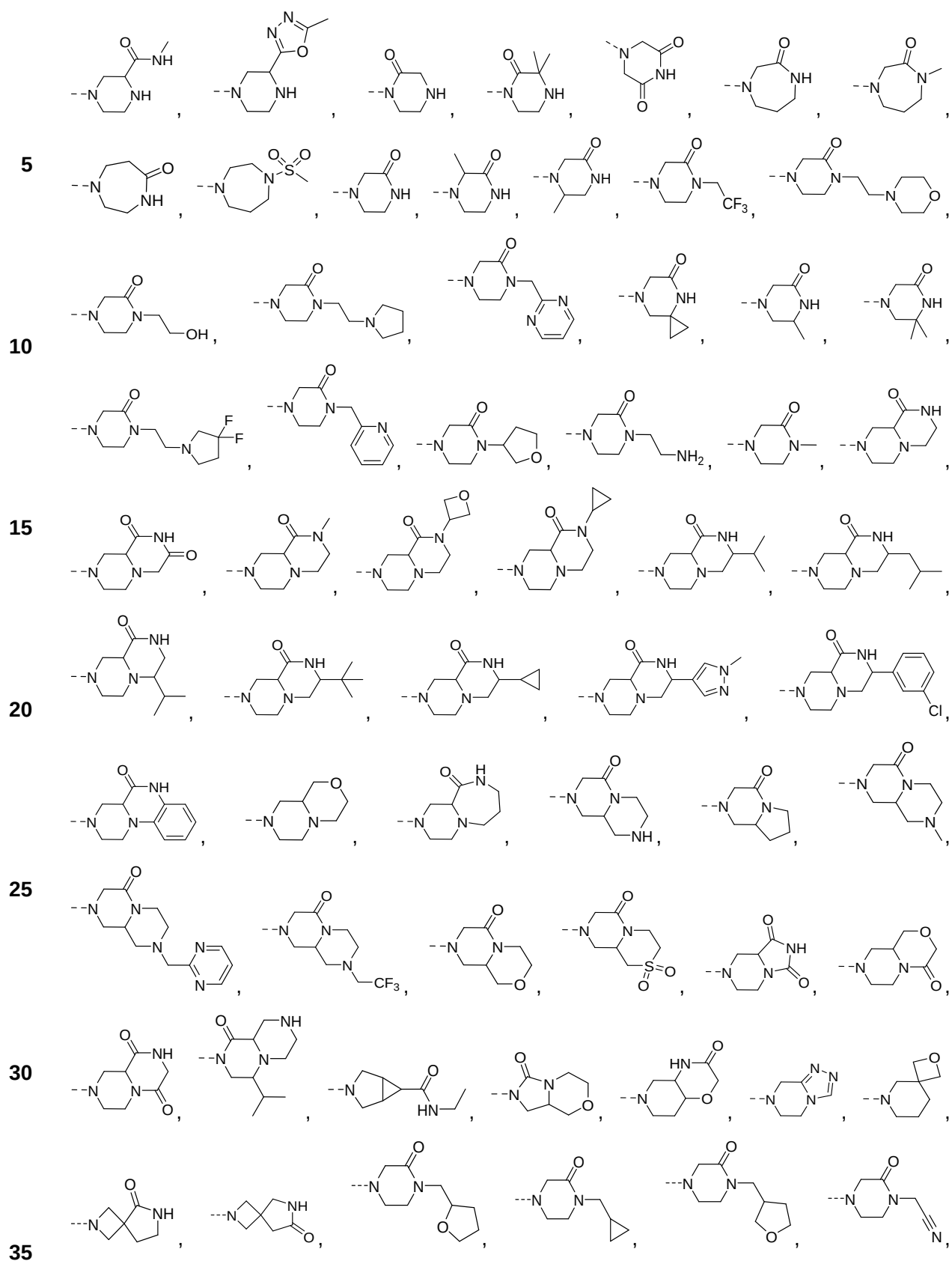
25



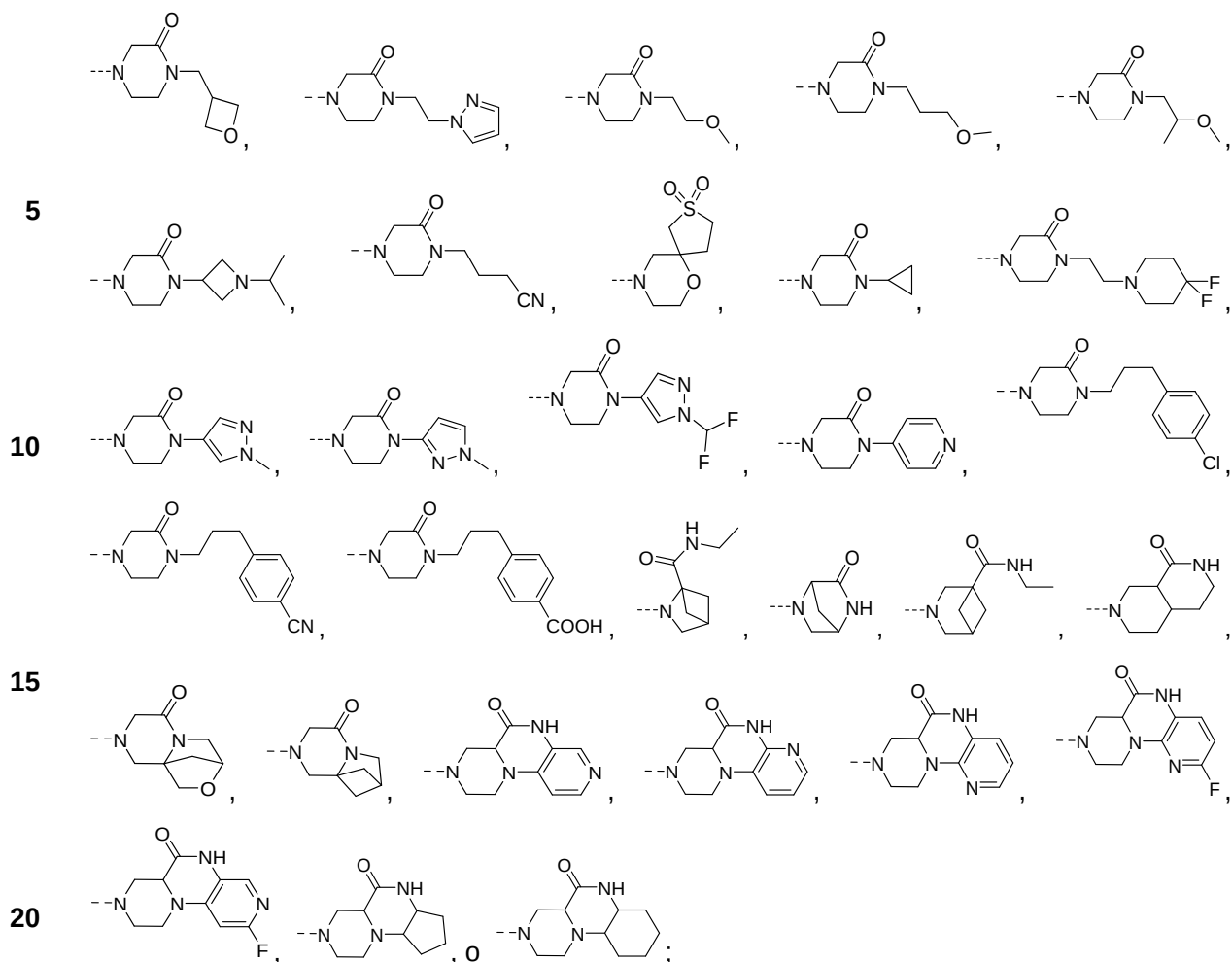
30



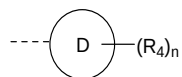
35



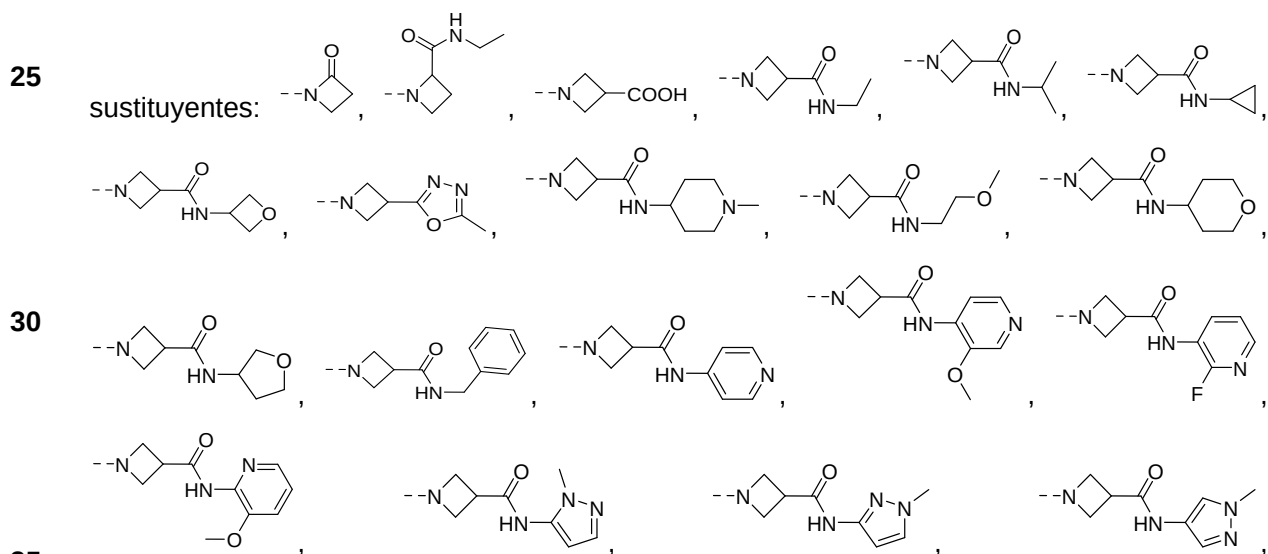
28

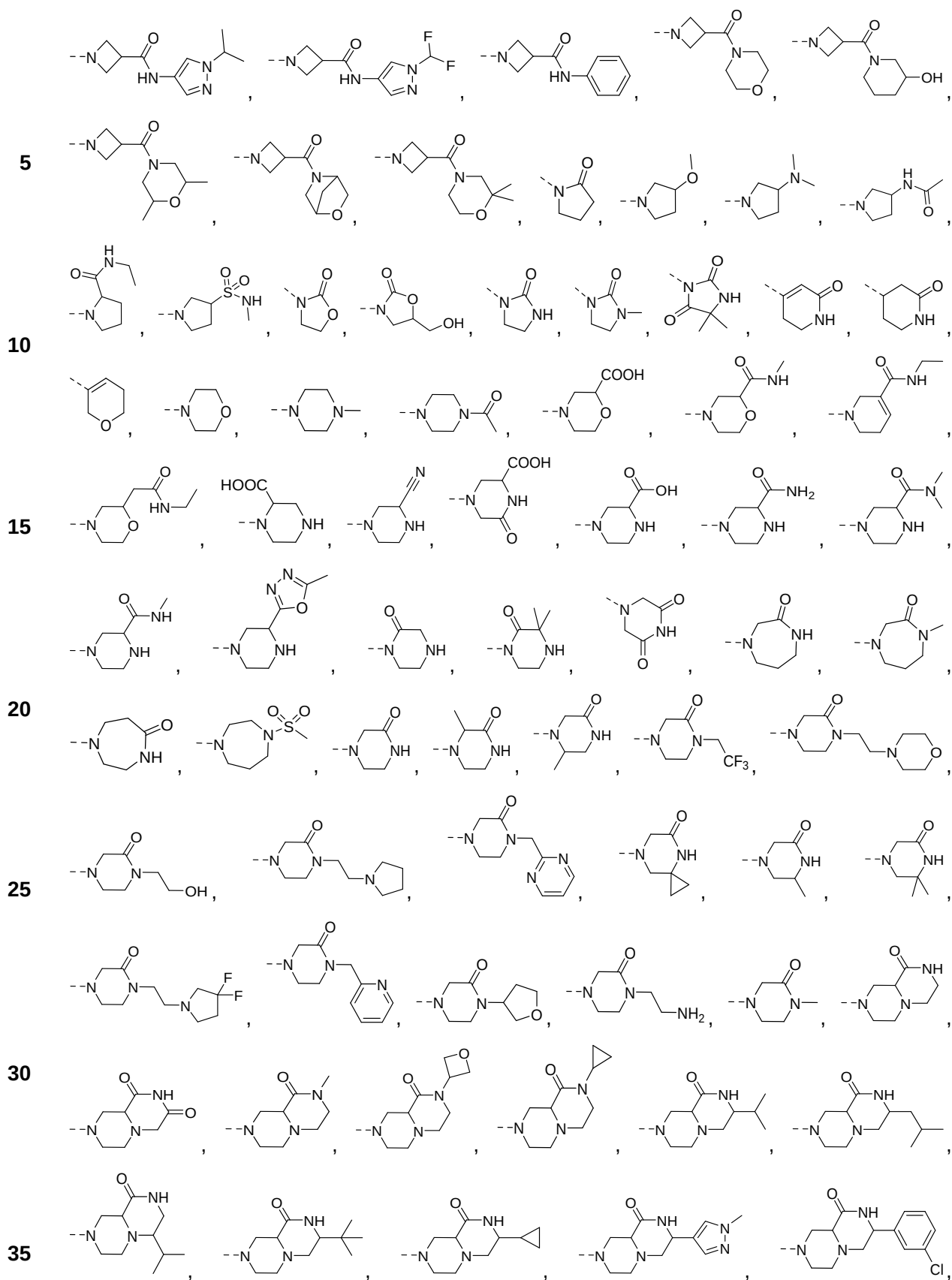


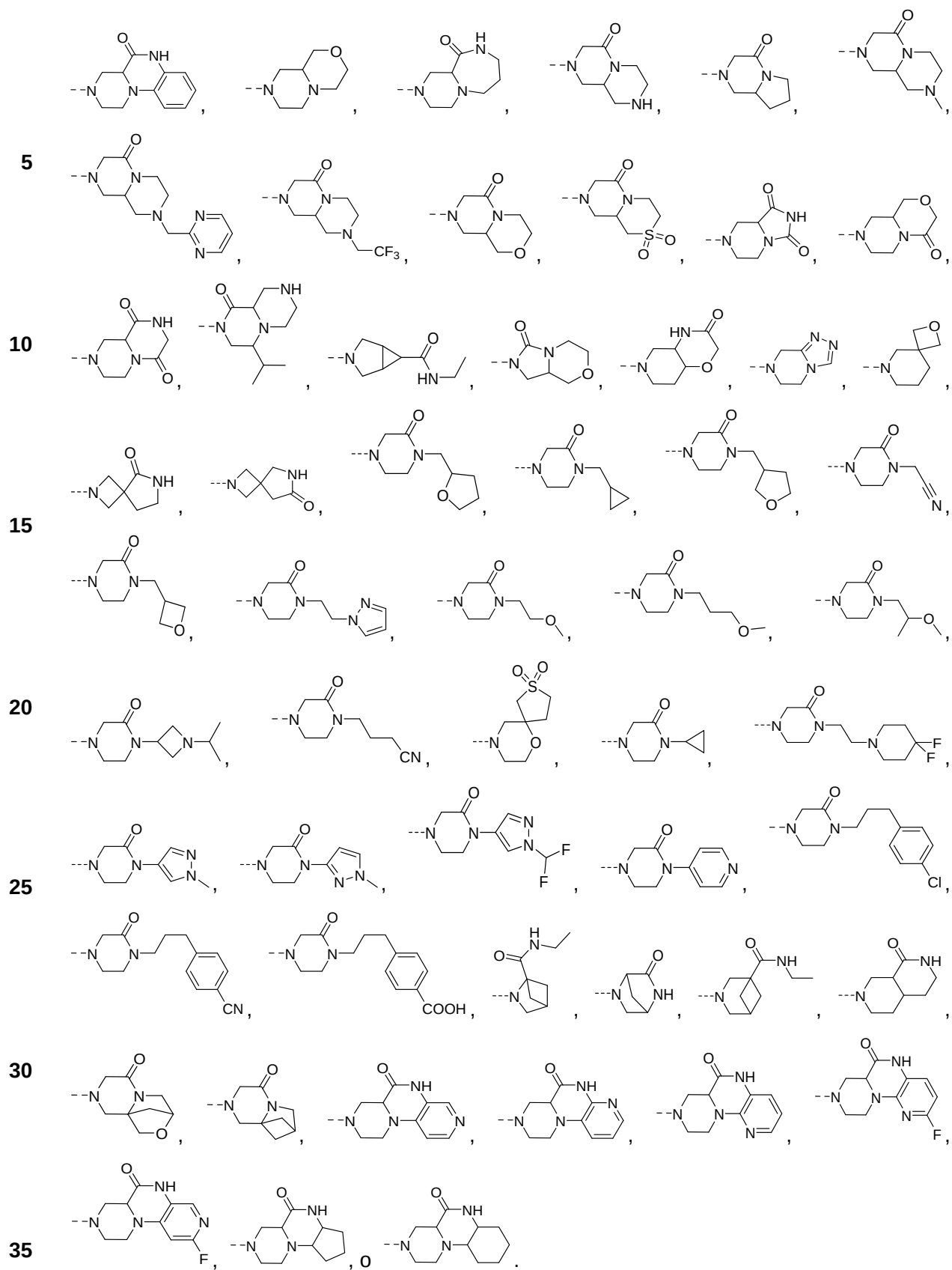
preferentemente, la porción estructural



se selecciona de los siguientes

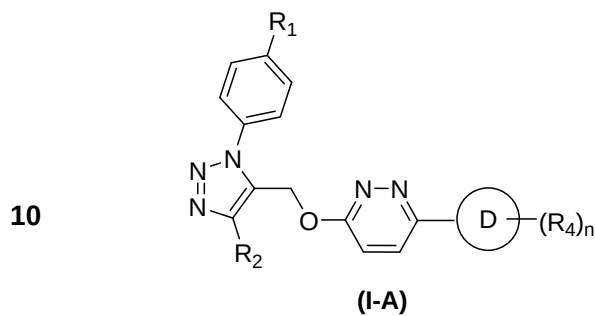


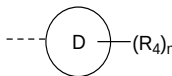
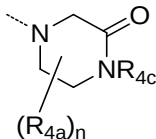
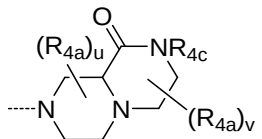


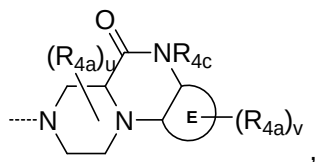


14. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque

5 el compuesto de la fórmula I es un compuesto de la fórmula I-A:

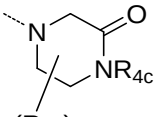


15 en donde  es , , o



20 R_1 , R_2 , R_{4a} , R_{4c} , u , v , n y el anillo E son como se definen de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 9 a 11.

15. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado porque satisface una o más de una de las siguientes condiciones:

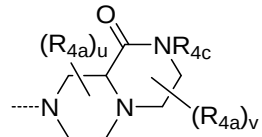
25 (1) en , R_{4c} es hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , heteroarilo de 5 a 10 miembros, heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros;

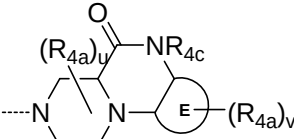
30 en R_{4c} , el alquilo de C_{1-3} se sustituye opcionalmente por 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente: halógeno, ciano, hidroxilo, amino, alquilo de C_{1-3} , alcoxi de C_{1-3} , alquilamino de C_{1-6} , cicloalquilo de C_{3-6} , heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros sustituido por 1 a 3 halógenos;

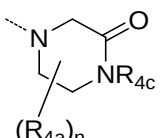
en R_{4c} , el heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 grupos alquilo de C_{1-3} ;

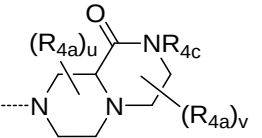
en R_{4c} , el heteroarilo de 5 a 10 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente: alquilo de C_{1-3} o haloalquilo de C_{1-3} ;

5 en R_{4c} , el heteroaril(C_{1-3})alquilo de 5 a 10 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente: halógeno, ciano o alcoxi de C_{1-3} ;

10 (2) en  , R_{4c} es hidrógeno, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} o heterocicloalquilo de 3 a 6 miembros;

15 (3) en  , R_{4c} es hidrógeno;

(4) en  , cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, oxo, alquilo de C_{1-3} o COOH, y n es 0, 1 o 2; preferentemente, n es 0;

20 (5) en  , cada R_{4a} es independientemente hidrógeno, oxo, alquilo de C_{1-3} , cicloalquilo de C_{3-6} , fenilo o heteroarilo de 5 a 6 miembros;

en R_{4a} , el alquilo de C_{1-3} se sustituye opcionalmente por 1 a 3 grupos alquilo de C_{1-3} ;

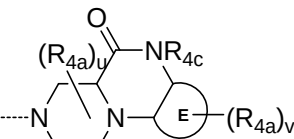
25 en R_{4a} , el heteroarilo de 5 a 6 miembros se sustituye opcionalmente por 1 a 3 grupos alquilo de C_{1-3} ;

en R_{4a} , el fenilo se sustituye opcionalmente por 1 a 3 halógenos;

u es 0;

v es 0 o 1;

30 preferentemente, R_{4a} es hidrógeno o alquilo de C_{1-3} , y el alquilo de C_{1-3} se sustituye opcionalmente por 1 a 3 grupos alquilo de C_{1-3} ; y

35 (6) en  , cada R_{4a} es independientemente hidrógeno o halógeno; u es 0, y v es 0 o 1; preferiblemente, u es 0, y v es 0.

16. El compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque

5 el compuesto de la fórmula I se selecciona de los siguientes compuestos:

10

15

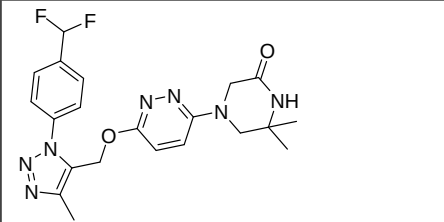
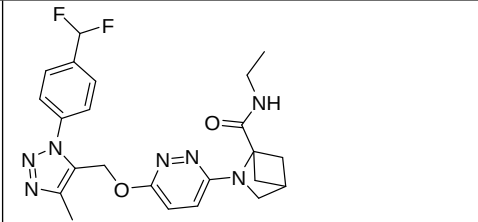
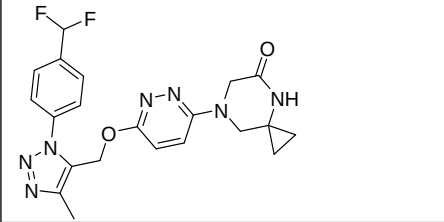
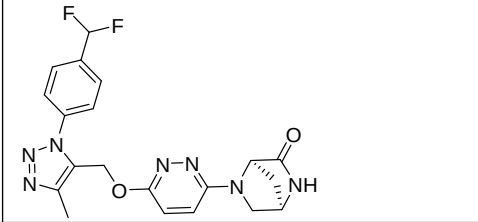
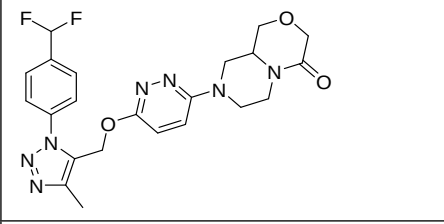
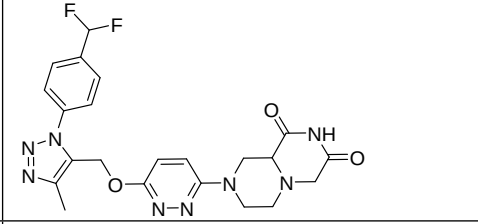
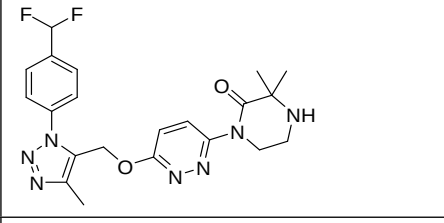
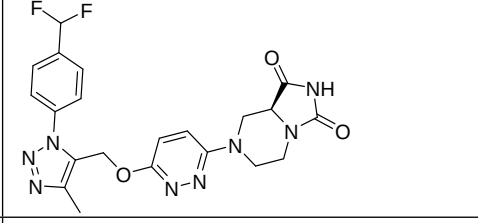
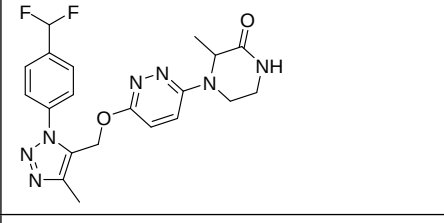
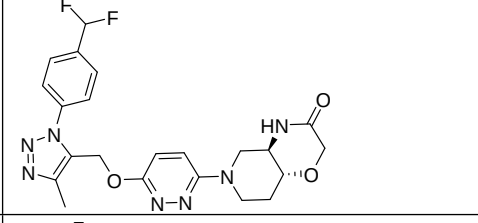
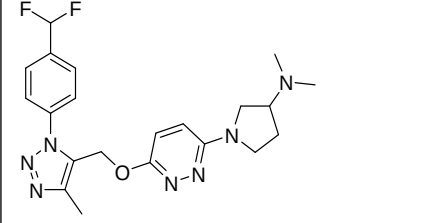
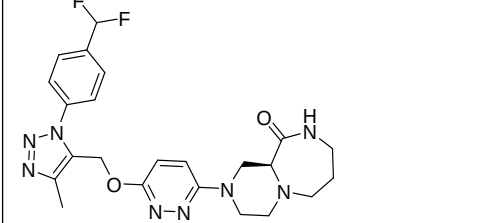
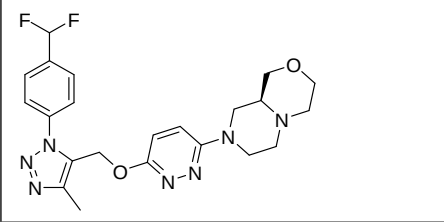
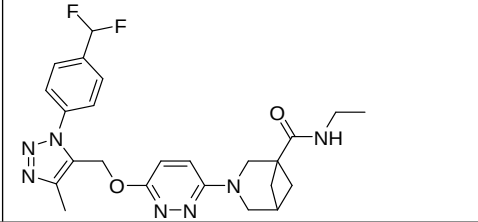
20

25

30

35

Ejemplo	Estructura	Ejemplo	Estructura
1		109	
2		110	
3		111	
4		112	
5		113	
6		114	

5	7		115	
	8		116	
	9		117	
10	10		118	
	11		119	
	12		120	
30	13		121	

5

10

15

20

25

30

14		122	
15		123	
16		124	
17		125	
18		126	
19		127	
20		128	

35

5

10

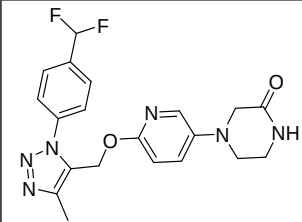
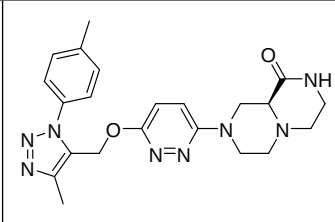
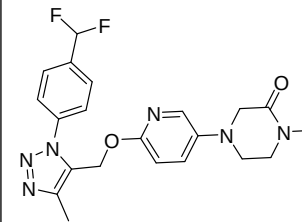
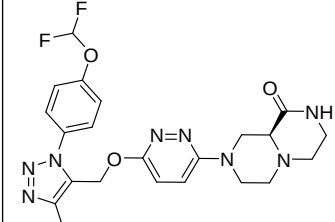
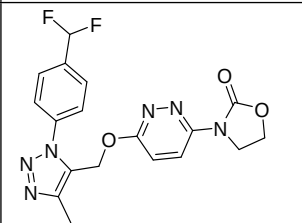
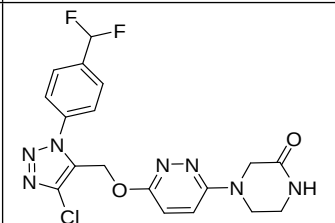
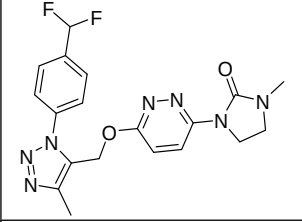
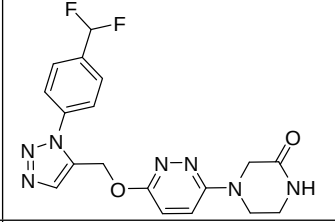
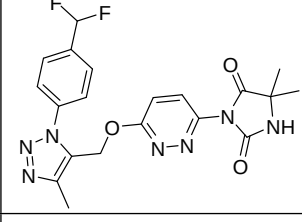
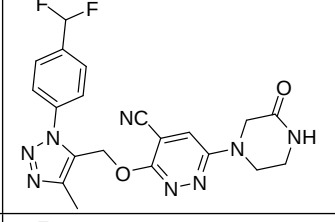
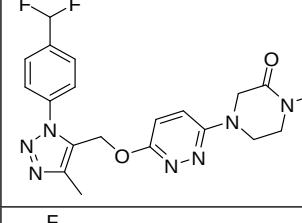
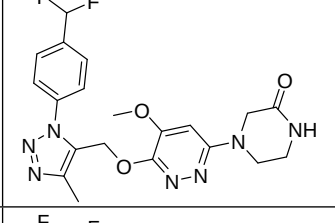
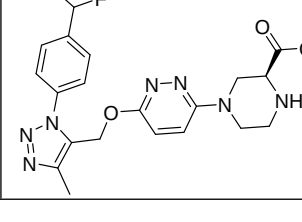
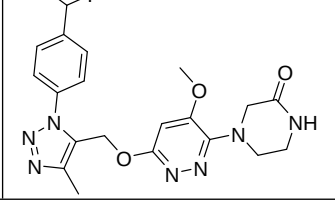
15

20

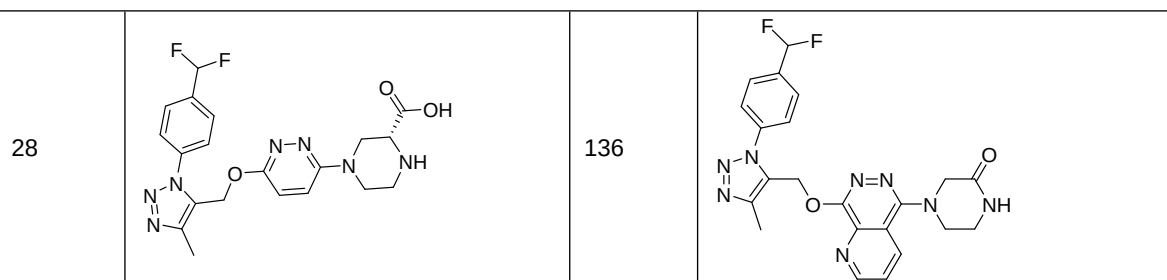
25

30

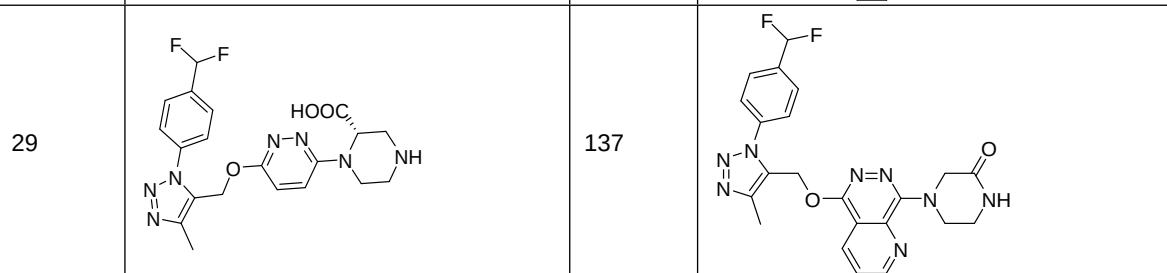
35

21		129	
22		130	
23		131	
24		132	
25		133	
26		134	
27		135	

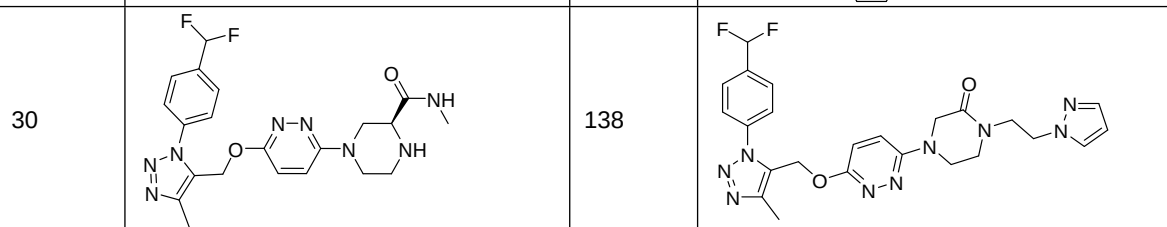
5



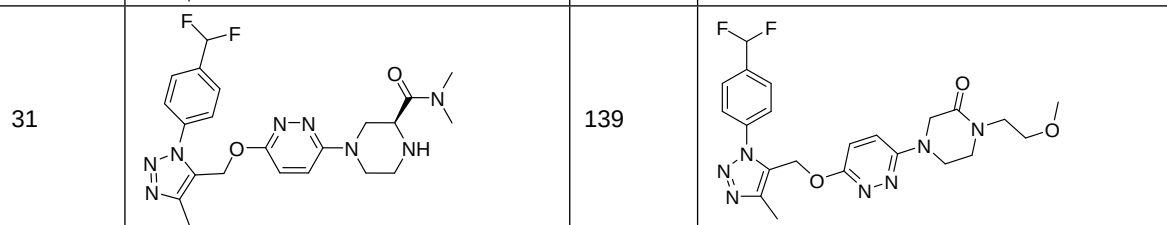
10



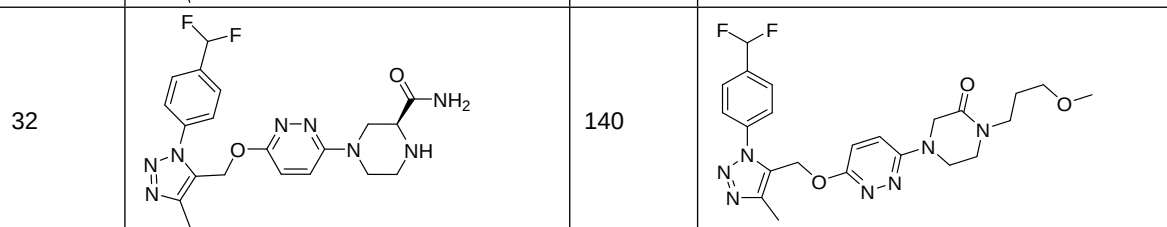
15



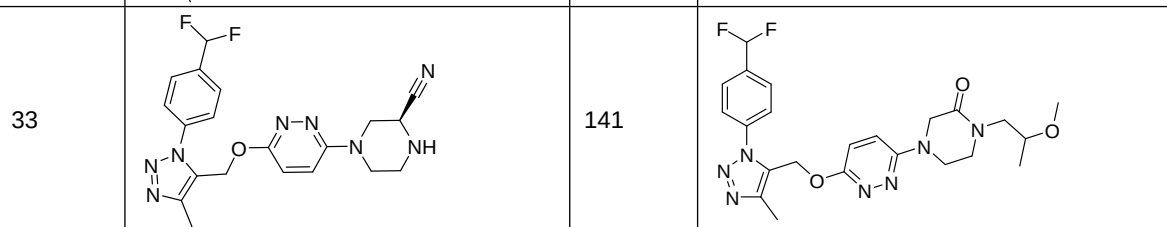
20



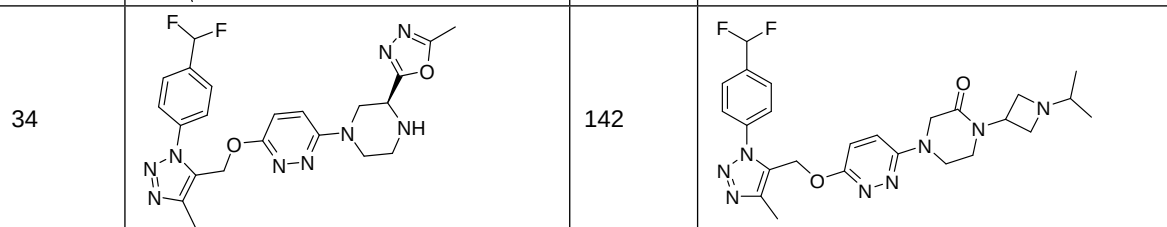
25



30



35



5

10

15

20

25

30

35

35		143	
36		144	
37		145	
38		146	
39		147	
40		148	
41		149	

5

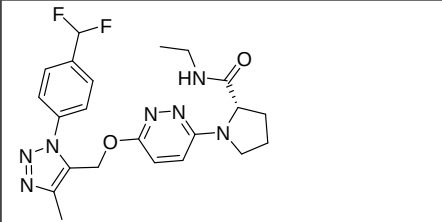
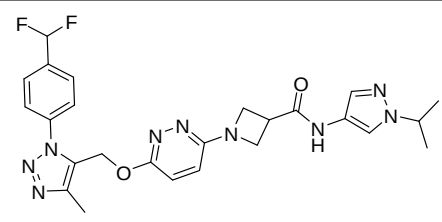
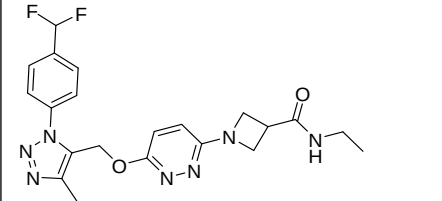
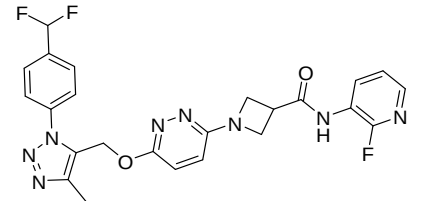
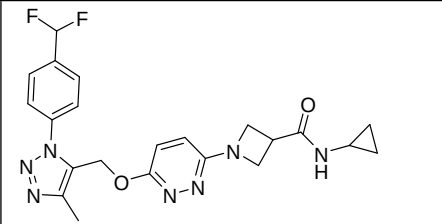
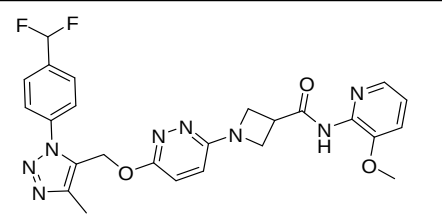
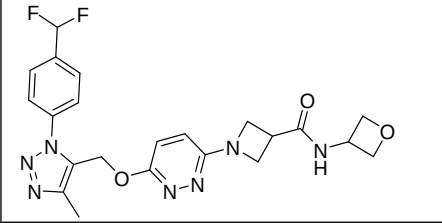
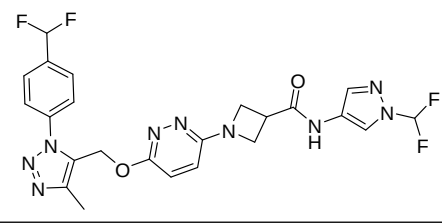
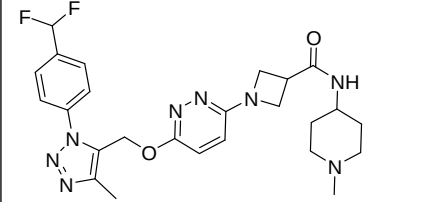
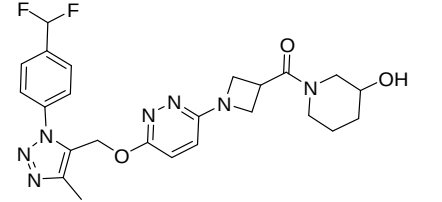
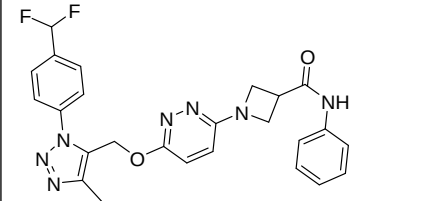
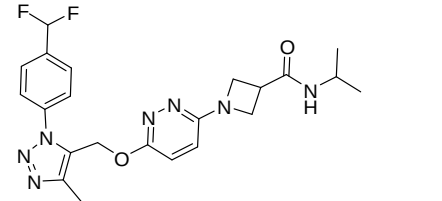
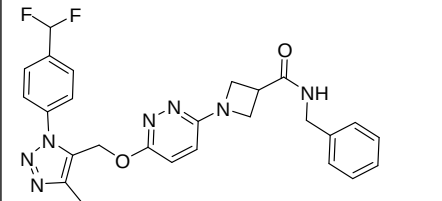
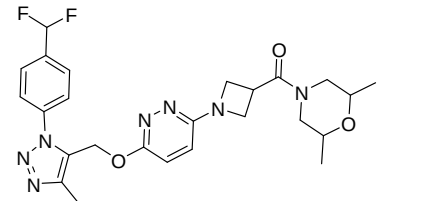
10

15

20

25

30

42		150	
43		151	
44		152	
45		153	
46		154	
47		155	
48		156	

35

5	49		157	
	50		158	
	51		159	
10	52		160	
	53		161	
	54		162	
15	55		163	

5

56		164	
57		165	
58		166	
59		167	
60		168	
61		169	
62		170	

35

5

10

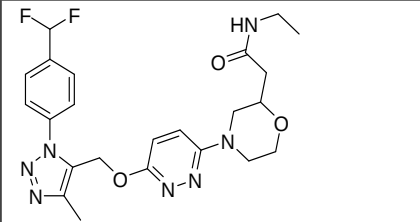
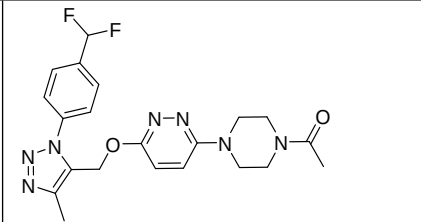
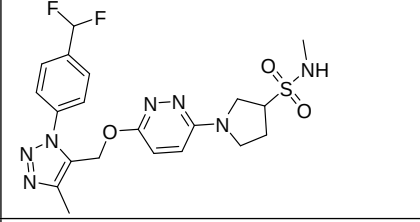
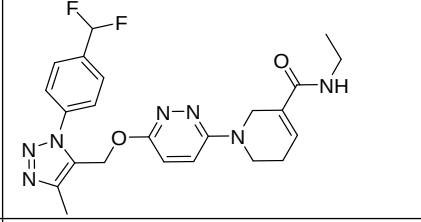
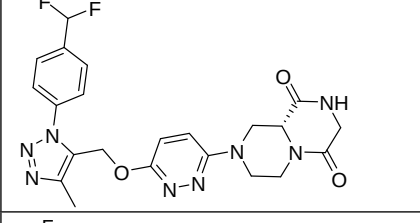
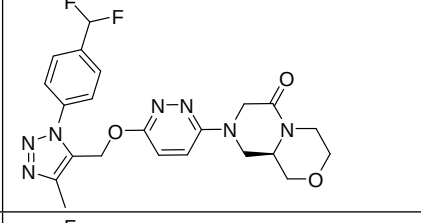
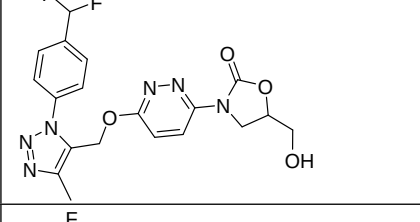
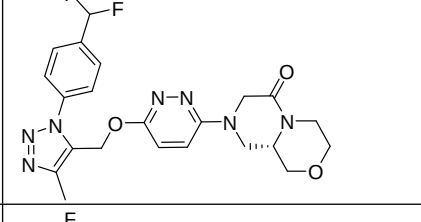
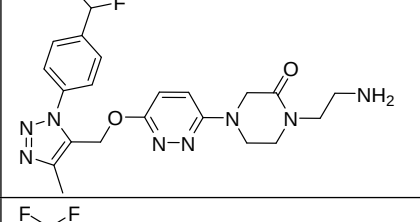
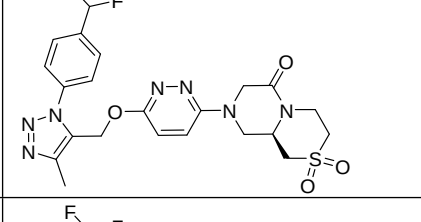
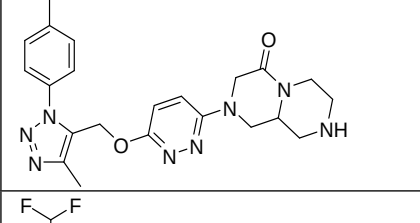
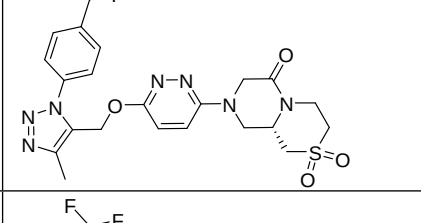
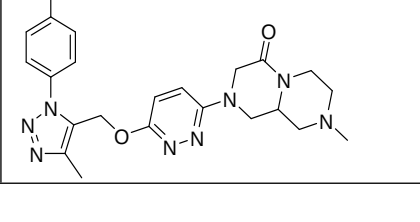
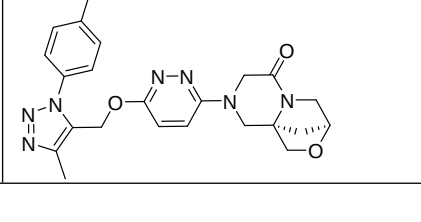
15

20

25

30

35

63		171	
64		172	
65		173	
66		174	
67		175	
68		176	
69		177	

5

10

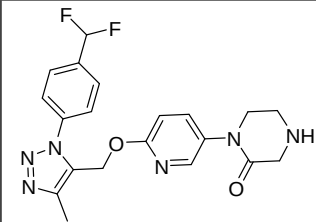
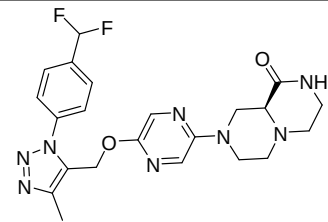
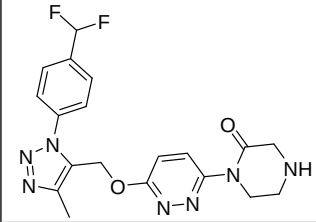
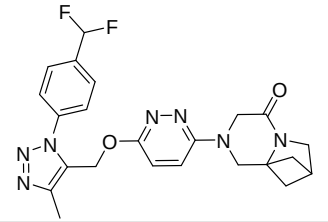
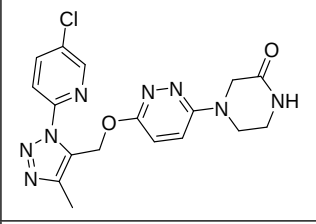
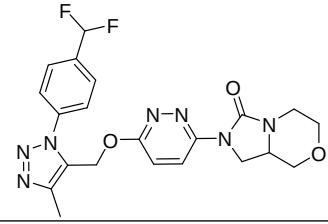
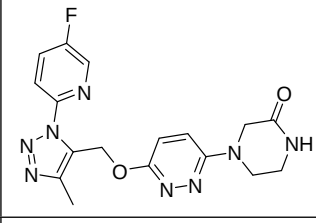
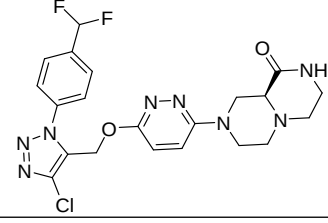
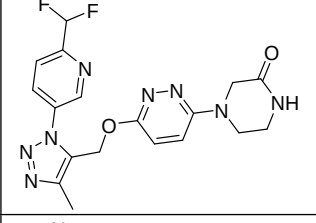
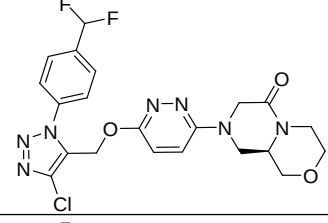
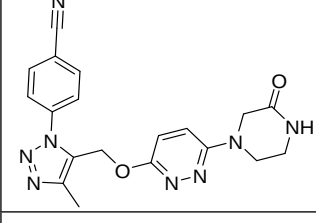
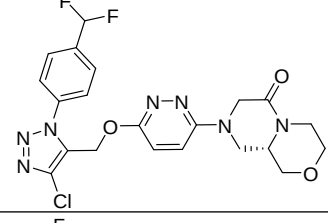
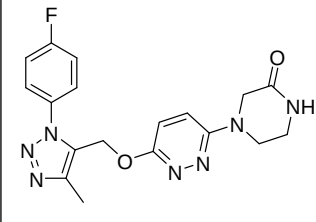
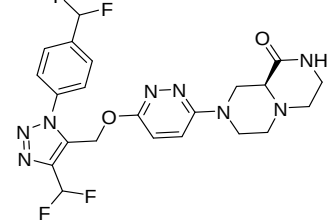
15

20

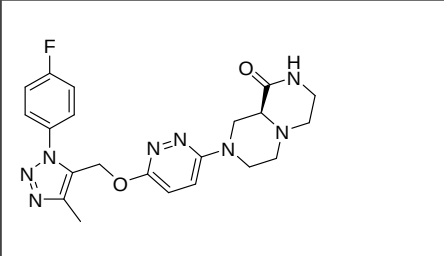
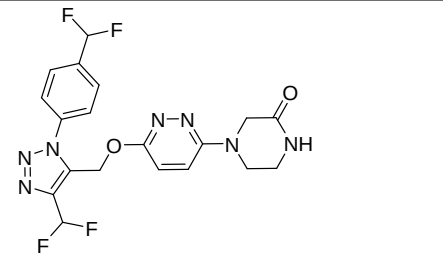
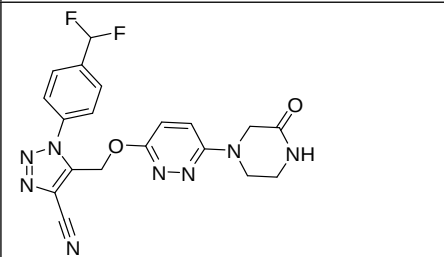
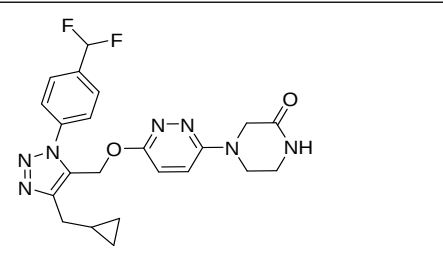
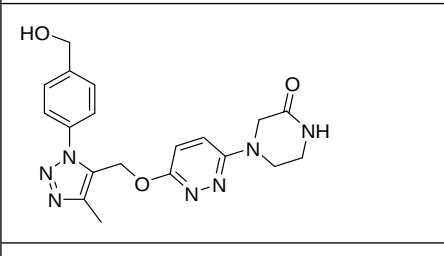
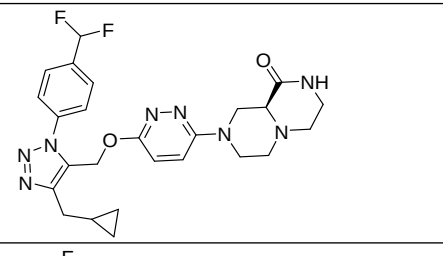
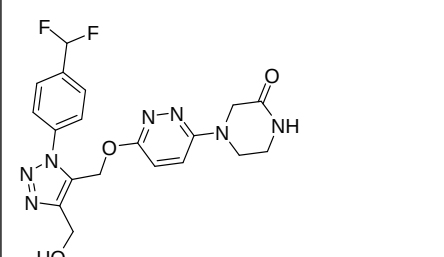
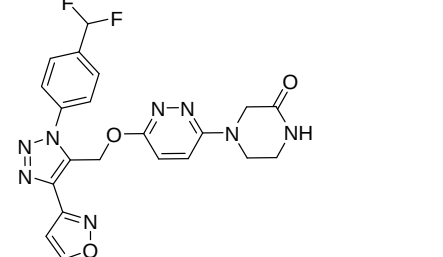
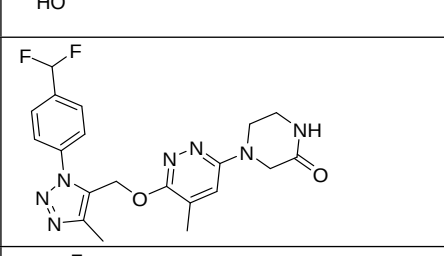
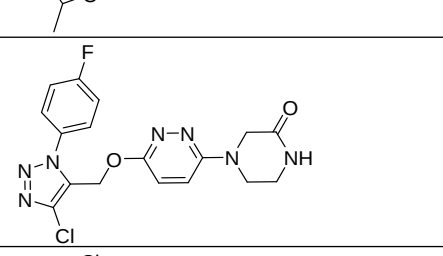
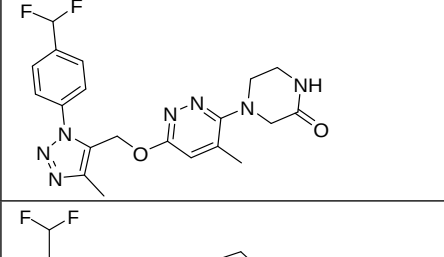
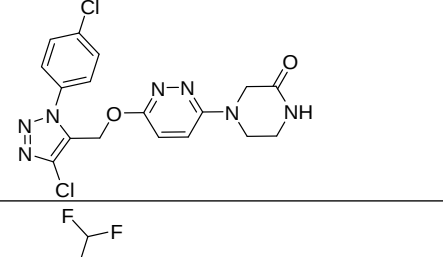
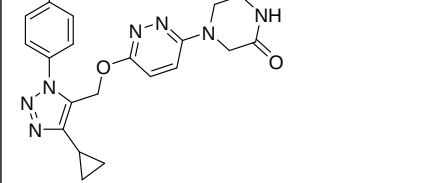
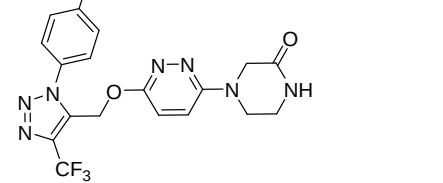
25

30

35

70		178	
71		179	
72		180	
73		181	
74		182	
75		183	
76		184	

5

77		185	
78		186	
79		187	
80		188	
81		189	
82		190	
83		191	

10

15

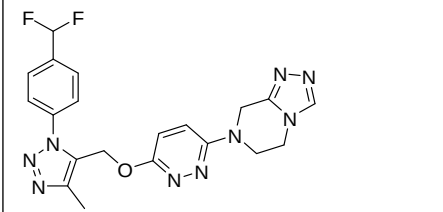
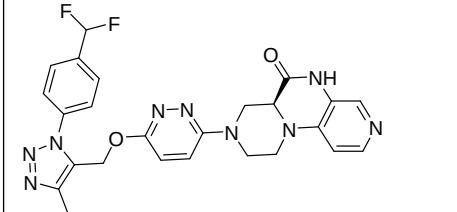
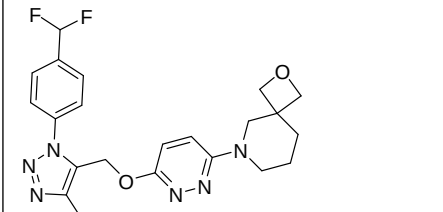
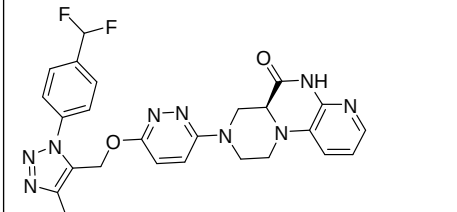
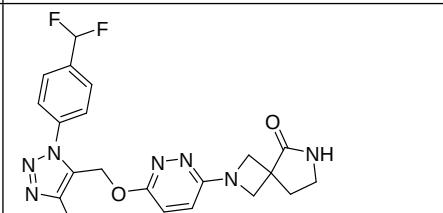
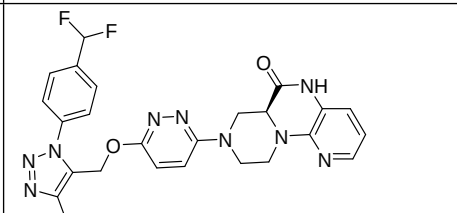
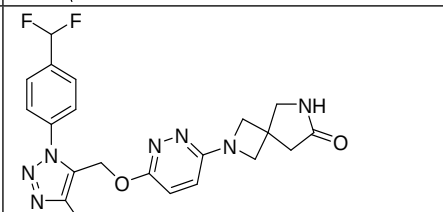
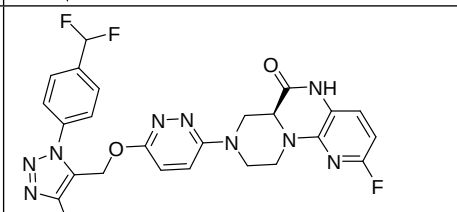
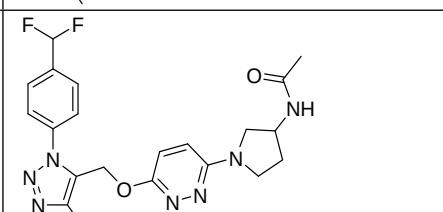
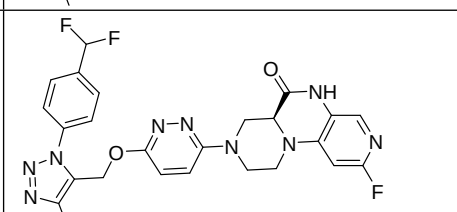
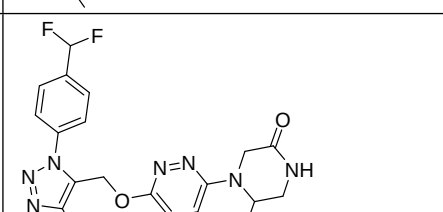
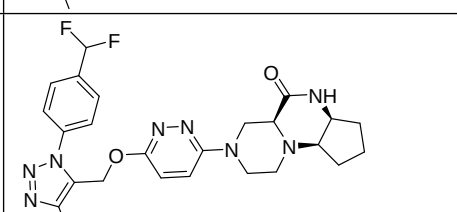
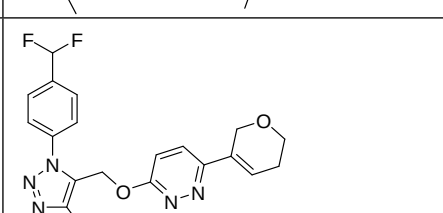
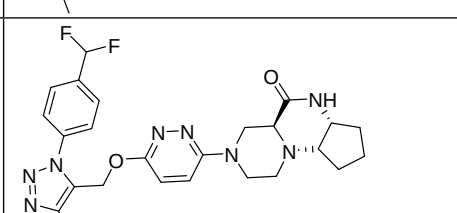
20

25

30

35

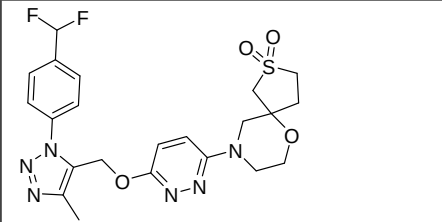
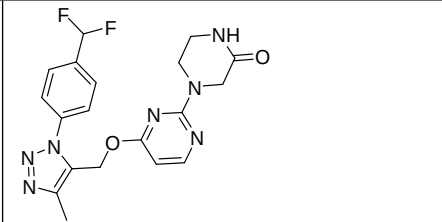
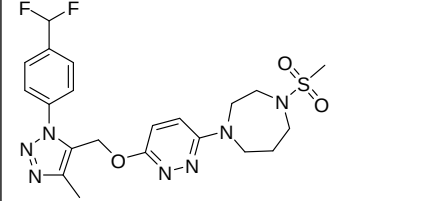
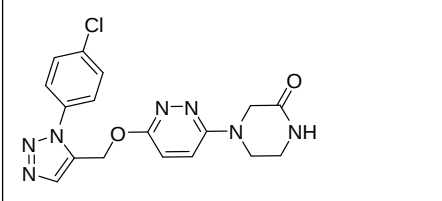
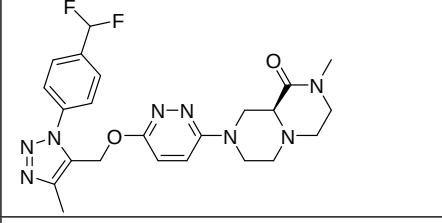
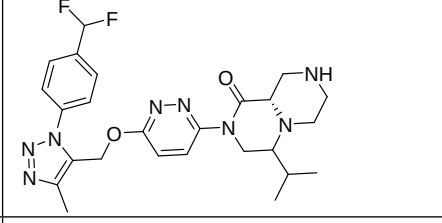
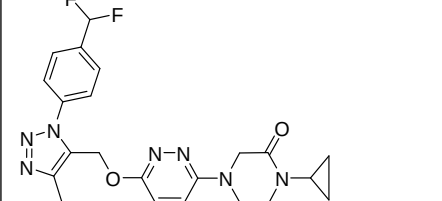
5

84		192	
85		193	
86		194	
87		195	
88		196	
89		197	
90		198	

35

5	91		199	
10	92		200	
15	93		201	
20	94		202	
25	96		204	
30	97		205	

98		206	
99		207	
100		208	
101		209	
102		210	
103		211	
104		212	

5	105		213	
	106		214	
10	107		215	
	108			

20 **17.** Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende el compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 16; preferentemente, la composición farmacéutica

25 comprende además uno o más de un portador, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.

18. Un uso del compuesto de la fórmula I, el isómero *cis-trans* del mismo, el enantiómero del mismo, el diastereómero del mismo, el racemato del mismo, el solvato del mismo, el hidrato del mismo, la sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o el profármaco del mismo de conformidad con al menos una de las reivindicaciones 1 a 16, o la composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 17, el uso se selecciona de:

- (1) fabricación de un modulador de receptor $\alpha 5$ -GABA_A;
- (2) fabricación de un medicamento para tratar o prevenir una enfermedad relacionada con un receptor $\alpha 5$ -GABA_A;
- 35 (3) fabricación de un medicamento para tratar o prevenir las siguientes enfermedades:

dolor, enfermedad de Alzheimer, demencia por infarto múltiple y derrame cerebral.

5

10

15

20

25

30

35