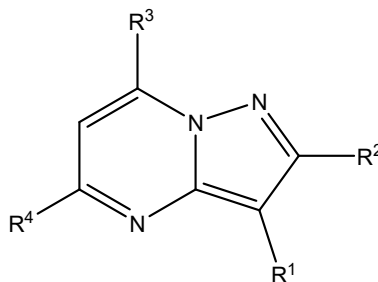


REIVINDICACIONES MODIFICADAS

1. Un compuesto de fórmula I:



Fórmula I

en donde,

R¹ y R² se seleccionan cada uno independientemente de arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido y heteroarilo C₅₋₁₀ opcionalmente sustituido;

R³ se selecciona de alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilamino o dialquilamino opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido y heteroarilo C₅₋₁₀ opcionalmente sustituido, -X¹-cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, -X¹-heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, -X¹-arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido y -X¹-heteroarilo C₅₋₁₀ opcionalmente sustituido;

R⁴ se selecciona de NH₂, alcoxi C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilamino o dialquilamino opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, -X²-cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido y -X²-heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido;

X¹ se selecciona de O y NR⁵, en donde R⁵ es H o un alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; y X² se selecciona de O y NR⁶, en donde R⁶ es H o un alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; o un isómero y/o un tautómero de este, o una sal farmacéuticamente aceptable de este.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R⁴ se selecciona de alcoxi C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilamino o dialquilamino opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido, -X²-cicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente sustituido y -X²-heterocicloalquilo C₃₋₁₀ opcionalmente

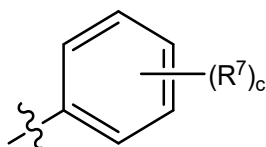
sustituido; preferentemente R^4 es un alcoxi C_{1-12} opcionalmente sustituido, preferentemente alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido, con mayor preferencia alcoxi C_{1-4} opcionalmente sustituido.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde dicho alquilo o alcoxi se sustituye con al menos un grupo seleccionado de OH, CO_2H , CO_2NH_2 , $CO_2NHalquilo$ C_{1-6} , $CO_2N(alquilo\ C_{1-6})_2$, $P(O)(alquilo\ C_{1-6})_2$, $NHC(O)alquilo\ C_{1-6}$, $N(alquilo\ C_{1-6})C(O)alquilo\ C_{1-6}$, cada uno opcionalmente sustituido, y en donde dicho grupo se une opcionalmente al cicloalquilo o heterocicloalquilo a través de un alquilo C_{1-6} , preferentemente OH o OH unido a través de un alquilo C_{1-6} o un alquilo C_{1-3} .

4. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^3 es un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido, o un alquilamino C_{1-6} o dialquilamino C_{1-6} opcionalmente sustituido.

5. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde R^3 es un grupo arilo C_6 , heteroarilo C_{5-6} , cicloalquilo C_{4-7} o heterocicloalquilo C_{4-7} opcionalmente sustituido, o un arilo C_6 , heteroarilo C_{5-6} , cicloalquilo C_{4-7} o heterocicloalquilo C_{4-7} unido al núcleo de pirazolopirimidina a través de X^1 .

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, en donde el grupo arilo es de la fórmula:



en donde,

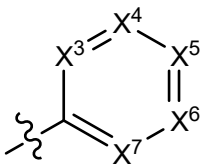
R^7 se selecciona, independientemente en cada aparición, de halógeno, OH, OR^9 , CN, NO_2 , $C(O)R^9$, $C(O)N(R^8)_2$, $C(R^{10})=NR^{10}$, SO_2R^9 , $SO_2N(R^8)_2$, $N(R^{10})C(O)R^9$, $N(R^{10})SO_2R^9$, $N(R^{10})C(O)N(R^8)_2$, $N(R^{10})SO_2N(R^8)_2$, $N(R^8)_2$, $P(O)(R^8)_2$, $P(O)(OR^8)_2$, $B(OR^8)_2$, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{5-10} , cicloalquilo C_{3-10} y heterocicloalquilo C_{4-10} ;

R⁸ se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₁₀, heterocicloalquilo C₄₋₁₀, arilo C₆, y heteroarilo C₅₋₁₀, o dos R⁸ se toman junto con su(s) átomo(s) adyacente(s) para formar un grupo heterocicloalquilo C₄₋₁₀; R⁹ se selecciona, independientemente en cada aparición, de alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, heterocicloalquilo C₃₋₇, arilo C₆ y heteroarilo C₅₋₆; R¹⁰ se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, heterocicloalquilo C₃₋₇, arilo C₆ y heteroarilo C₅₋₆; y c es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

en donde dicho grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera adicional.

o

en donde el grupo arilo o heteroarilo es de la fórmula:



en donde,

X³, X⁴, X⁵, X⁶ y X⁷ se seleccionan cada uno independientemente de N y CR¹¹, en donde a lo máximo tres de X³, X⁴, X⁵, X⁶ y X⁷ son N, o en donde uno de dos X³, X⁴, X⁵, X⁶ y X⁷ adyacentes está ausente y el otro es O, S o NR¹⁰;

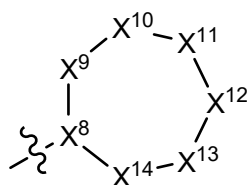
R¹⁰ se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, heterocicloalquilo C₃₋₇, arilo C₆ y heteroarilo C₅₋₆;

R¹¹ se selecciona, independientemente en cada aparición, de hidrógeno, halógeno, OH, OR⁹, CN, NO₂, C(O)R⁹, C(O)N(R⁸)₂, C(R¹⁰)=NR¹⁰, SO₂R⁹, SO₂N(R⁸)₂, N(R¹⁰)C(O)R⁹, N(R¹⁰)SO₂R⁹, N(R¹⁰)C(O)N(R⁸)₂, N(R¹⁰)SO₂N(R⁸)₂, N(R⁸)₂, P(O)(R⁸)₂, P(O)(OR⁸)₂, B(OR⁸)₂, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₅₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₁₀ y heterocicloalquilo C₄₋₁₀;

en donde dicho grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera adicional;

o

en donde el grupo cicloalquilo o heterocicloalquilo es de la fórmula:



- 5 en donde,
 X^8 se selecciona de N y CR^{11} ;
 X^9 , X^{10} , X^{11} , X^{12} , X^{13} y X^{14} se seleccionan cada uno independientemente de O, NR^{12} , SO_2 y $C(R^{13})_2$, en donde a lo máximo dos de X^8 , X^9 , X^{10} , X^{11} , X^{12} , X^{13} y X^{14} son o comprenden O, N o S, y/o en donde hasta 3 de X^9 , X^{10} , X^{11} , X^{12} , X^{13} y X^{14} están ausentes para formar un anillo
10 de 4, 5 o 6 miembros, y/o dos o tres de X^8 , X^9 , X^{10} , X^{11} , X^{12} , X^{13} y X^{14} se toman juntos para formar un puente a través de uno a tres átomos de puente adicionales, por ejemplo, átomos de carbono;
 R^8 se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-10} , heterocicloalquilo C_{4-10} , arilo C_6 , y heteroarilo C_{5-10} , o dos R^8
15 se toman junto con su(s) átomo(s) adyacente(s) para formar un grupo heterocicloalquilo C_{4-10} ;
 R^8 se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-10} , heterocicloalquilo C_{4-10} , arilo C_6 , y heteroarilo C_{5-10} , o dos R^8 se toman junto con su(s) átomo(s) adyacente(s) para formar un grupo heterocicloalquilo C_{4-10} ;
 R^9 se selecciona, independientemente en cada aparición, de alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-7} , heterocicloalquilo C_{3-7} , arilo C_6 y heteroarilo C_{5-6} ;
20 R^{10} se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-7} , heterocicloalquilo C_{3-7} , arilo C_6 y heteroarilo C_{5-6} ;
 R^{11} se selecciona, independientemente en cada aparición, de hidrógeno, halógeno, OH, OR^9 , CN, NO_2 , $C(O)R^9$, $C(O)N(R^8)_2$, $C(R^{10})=NR^{10}$, SO_2R^9 , $SO_2N(R^8)_2$, $N(R^{10})C(O)R^9$,
25 $N(R^{10})SO_2R^9$, $N(R^{10})C(O)N(R^8)_2$, $N(R^{10})SO_2N(R^8)_2$, $N(R^8)_2$, $P(O)(R^8)_2$, $P(O)(OR^8)_2$, $B(OR^8)_2$, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{5-10} , cicloalquilo C_{3-10} y heterocicloalquilo C_{4-10} ;
 R^{12} se selecciona de se selecciona, independientemente en cada aparición, de hidrógeno, $C(O)R^9$, $C(O)N(R^8)_2$, SO_2R^9 , $SO_2N(R^8)_2$, $P(O)(R^8)_2$, $P(O)(OR^8)_2$, $B(OR^8)_2$, alquilo C_{1-6} ,
30 alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{5-10} , cicloalquilo C_{3-10} y heterocicloalquilo C_{4-10} ; y

R^{13} se selecciona, independientemente en cada aparición, de hidrógeno, halógeno, OH, OR^9 , CN, NO_2 , $C(O)R^9$, $C(O)N(R^8)_2$, $C(R^{10})=NR^{10}$, SO_2R^9 , $SO_2N(R^8)_2$, $N(R^{10})C(O)R^9$, $N(R^{10})SO_2R^9$, $N(R^{10})C(O)N(R^8)_2$, $N(R^{10})SO_2N(R^8)_2$, $N(R^8)_2$, $P(O)(R^8)_2$, $P(O)(OR^8)_2$, $B(OR^8)_2$, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{5-10} , cicloalquilo C_{3-10} , y heterocicloalquilo C_{4-10} o dos R^{13} se toman junto con su(s) átomo(s) adyacente(s) para formar un grupo cicloalquilo C_{4-10} o heterocicloalquilo C_{4-10} ; en donde dicho grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera adicional.

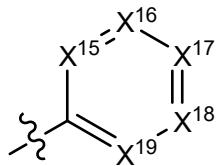
7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, en donde uno de X^3 , X^4 , X^5 , X^6 y X^7 es N, preferentemente uno de X^4 y X^6 .

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, en donde X^4 es N y X^3 , X^6 y X^7 son cada uno CH.

9. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 6 a 8, en donde X^5 es CR^{11} y R^{11} se selecciona de CN, un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido (por ejemplo, CH_3 , CF_3 , etc.) y OR^9 , en donde R^9 es un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido.

10. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en donde R^2 es un arilo C_6 opcionalmente sustituido o heteroarilo C_{5-6} opcionalmente sustituido.

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 10, en donde R^2 es de la fórmula:



en donde,

X^{15} , X^{16} , X^{17} , X^{18} y X^{19} se seleccionan cada uno independientemente de N y CR^{11} , en donde lo máximo tres de X^{15} , X^{16} , X^{17} , X^{18} y X^{19} son N, o en donde uno de dos X^{15} , X^{16} , X^{17} , X^{18} y X^{19} adyacentes está ausente y el otro es O, S o NR^{10} ;

R¹⁰ se selecciona, independientemente en cada aparición, de H, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, heterocicloalquilo C₃₋₇, arilo C₆ y heteroarilo C₅₋₆; y

R¹¹ se selecciona, independientemente en cada aparición, de hidrógeno, halógeno, OH, OR⁹, CN, NO₂, C(O)R⁹, C(O)N(R⁸)₂, C(R¹⁰)=NR¹⁰, SO₂R⁹, SO₂N(R⁸)₂, N(R¹⁰)C(O)R⁹,
5 N(R¹⁰)SO₂R⁹, N(R¹⁰)C(O)N(R⁸)₂, N(R¹⁰)SO₂N(R⁸)₂, N(R⁸)₂, P(O)(R⁸)₂, P(O)(OR⁸)₂, B(OR⁸)₂, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₅₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₁₀ y heterocicloalquilo C₄₋₁₀;

y

en donde dicho grupo alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o
10 heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera adicional.

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 11, en donde X¹⁵, X¹⁶, X¹⁷, X¹⁸ y X¹⁹ son cada uno CR¹¹.

15 13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 11 o 12, en donde X¹⁵ es CR¹¹, en donde R¹¹ se selecciona de halógeno y OR⁹.

14. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 11 a 13, en donde X¹⁶, X¹⁷, X¹⁸ y X¹⁹ son cada uno CR¹¹, en donde R¹¹ es hidrógeno.

20

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13 o 14, en donde R² es un grupo 2-metoxifenilo o 2-clorofenilo.

25 16. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 35, en donde R¹ es un arilo C₆ opcionalmente sustituido, preferentemente R¹ es un grupo 4-clorofenilo.

17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto se selecciona de los Compuestos 1 a 78 como se define en la presente descripción, o un isómero o un tautómero de estos, o una sal farmacéuticamente aceptable de estos.

30

18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el compuesto se selecciona del Compuesto 8, Compuesto 15 o Compuesto 45, como se define en la presente descripción, o un isómero o un tautómero de estos, o una sal farmacéuticamente aceptable de estos.
- 5 19. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, junto con un portador, diluyente o excipiente farmacéuticamente aceptable.
- 10 20. Uso de un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 o una composición farmacéutica como se define en la reivindicación 19 para uso en el tratamiento de un trastorno relacionado con el apetito o una de sus complicaciones, un trastorno relacionado con la regulación de la glucosa o una de sus complicaciones, un trastorno relacionado con la fibrosis o una de sus complicaciones, un trastorno relacionado con el metabolismo o una de sus complicaciones, un trastorno relacionado con el crecimiento y la curación de la piel y el cabello, un trastorno relacionado con el sistema GI, un trastorno relacionado con la obesidad o una de sus complicaciones, o una de sus combinaciones.
- 15 21. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso según la reivindicación 20 en el tratamiento de un trastorno, en donde dicho trastorno se selecciona entre diabetes tipo I, diabetes tipo II, obesidad y enfermedad renal crónica.
- 20

25

30