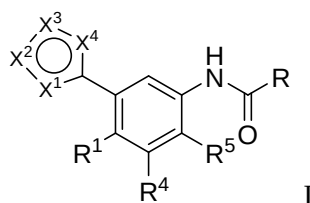


## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula I:



o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, tautómero, estereoisómero, o mezcla de estereoisómeros del mismo, en el que:

$X^1$  es N,  $NR^{8a}$ , O, S, o  $CR^{6a}$ ;

$X^2$  es N,  $NR^{8b}$ , O, S, o  $CR^{6b}$ ;

$X^3$  es N,  $NR^{8c}$ , o  $CR^{6c}$ ;

$X^4$  es N o  $CR^{6d}$ ;

siempre que al menos uno de  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ , y  $X^4$  es N, y el anillo que contiene  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ , y  $X^4$  sea aromático;

R es  $-NR^2R^3$ ,  $-OR^7$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^1$  es halo, ciano, alquilo  $C_{1-3}$ , alquenilo  $C_{2-3}$ , alquinilo  $C_{2-3}$ , o cicloalquilo  $C_{3-6}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^2$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^3$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el  $C_{1-6}$  alquilo,  $C_{2-6}$  alquenilo,  $C_{2-6}$  alquinilo,  $C_{3-10}$  cicloalquilo, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

o  $R^2$  y  $R^3$  juntos forman un heterociclilo, que además puede estar opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>5</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup>, R<sup>6c</sup>, y R<sup>6d</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>7</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>8a</sup>, R<sup>8b</sup>, y R<sup>8c</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo es de manera independiente sustituido opcionalmente con 1 a 5 Z<sup>1</sup>;

o R<sup>8a</sup> y R<sup>6b</sup>, o R<sup>8b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>6b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>8c</sup> y R<sup>6d</sup>, o R<sup>6c</sup> y R<sup>6d</sup>, juntos forman un cicloalquilo de 5 miembros o un heterociclilo de 5 miembros, que además puede estar opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

cada Z<sup>1</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -S(O)R<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -

$\text{NR}^{12}\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ , o  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco  $\text{Z}^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{10}$  es independientemente alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está independientemente sustituido de forma opcional con uno a cinco  $\text{Z}^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{11}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está independientemente sustituido de forma opcional con uno a cinco  $\text{Z}^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{12}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está independientemente sustituido de forma opcional con uno a cinco  $\text{Z}^{1b}$ ;

cada  $\text{Z}^{1a}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{SR}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ , o  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ; donde cada  $\text{C}_{1-6}$  alquilo,  $\text{C}_{2-6}$  alquenilo,  $\text{C}_{2-6}$  alquinilo,  $\text{C}_{1-6}$  haloalquilo,  $\text{C}_{3-10}$  cicloalquilo, heterociclilo, arilo o heteroarilo está independientemente sustituido de forma opcional con uno a cinco  $\text{Z}^{1b}$ ;

cada  $\text{R}^{13}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo está independientemente sustituido de forma opcional con uno a cinco  $\text{Z}^{1b}$ ;

cada  $\text{Z}^{1b}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenilo  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{L}-\text{C}_{1-6}$  alquilo,  $-\text{L}-\text{C}_{2-6}$  alquenilo,  $-\text{L}-\text{C}_{2-6}$  alquinilo,  $-\text{L}-\text{C}_{1-6}$  haloalquilo,  $-\text{L}-\text{C}_{3-10}$  cicloalquilo,  $-\text{L}$ -heterociclilo,  $-\text{L}$ -arilo o  $-\text{L}$ -heteroarilo; y

cada  $\text{L}$  es independientemente  $-\text{O}-$ ,  $-\text{NH}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{S}(\text{O})-$ ,  $\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{N}(\text{alquilo } \text{C}_{1-6})-$ ,  $\text{N}(\text{alquenilo } \text{C}_{2-6})-$ ,  $\text{N}(\text{alquinilo } \text{C}_{2-6})-$ ,  $\text{N}(\text{haloalquilo } \text{C}_{1-6})-$ ,  $\text{N}(\text{cicloalquilo } \text{C}_{3-10})-$ ,  $-\text{N}(\text{heterociclilo})-$ ,  $-\text{N}(\text{arilo})-$ ,  $-$

N(heteroarilo)-, -C(O)-, -C(O)O-, -C(O)NH-, -C(O)N(C<sub>1-6</sub> alquilo)-, -C(O)N(C<sub>2-6</sub> alqueno)-, -C(O)N(C<sub>2-6</sub> alquino)-, -C(O)N(C<sub>1-6</sub> haloalquilo)-, -C(O)N(cicloalquilo C<sub>3-10</sub>)-, -C(O)N(heterociclilo)-, -C(O)N(arilo)-, -C(O)N(heteroarilo)-, -NHC(O)-, -NHC(O)O-, -NHC(O)NH-, -NHS(O)-, o -S(O)<sub>2</sub>NH-;

donde cada C<sub>1-6</sub> alquilo, C<sub>2-6</sub> alqueno, C<sub>2-6</sub> alquino, C<sub>1-6</sub> haloalquilo, C<sub>3-10</sub> cicloalquilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo de Z<sup>1b</sup> y L está además opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados entre halo, ciano, -OH, -SH, NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -SF<sub>5</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub>, alquino C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo y heteroarilo;

con la condición de que ocurra al menos uno de A, B, C, D o E:

- A. X<sup>1</sup> es N y X<sup>2</sup> es NR<sup>8b</sup>; y
- a. cuando R es alquilo C<sub>1-6</sub>; el alquilo C<sub>1-6</sub> está sustituido con halo o cicloalquilo C<sub>3-10</sub> y opcionalmente de uno a cuatro Z<sup>1</sup>; y/o
- b. R<sup>8b</sup> es distinto de hidrógeno; y/o
- c. cuando R es -OR<sup>7</sup>; entonces R<sup>7</sup> no es metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, 2-bromoetilo, 2-metoxietilo, 2-cianoetilo, 2-feniletilo, bencilo o 9H-fluoren-9-ilmetilo;

y el compuesto no es:

- 129628-21-3 éster 2-metil-2-propenílico del ácido [2,4-dicloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il]fenil]-carbámico ,
- 945236-54-4 1-(1,3-benzodioxol-5-il)-N-[4-metil-3-(1-metil-1H-pirazol-3-il)fenil]ciclopropanocarboxamida,
- 142622-93-3 N-[2,4-dicloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,2,2-trifluoroacetamida,
- 142621-98-5 N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]-2,2,2-trifluoroacetamida,
- 2231121-13-2 N-[4-bromo-2-fluoro-5-[2-[[2-(trimetilsilil)etoxi]metil]-2H-tetrazol-5-il]fenil]-1-(3-clorofenil)ciclopropanocarboxamida,
- 2231119-31-4 N-[4-bromo-3-[2-[[2-(trimetilsilil)etoxi]metil]-2H-tetrazol-5-il]fenil]-1-(3-clorofenil)ciclopropanocarboxamida,

159291-92-6 1-bromo-N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]ciclopropanocarboxamida, o

141576-10-5 N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(metilsulfonil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]-2,2,2-trifluoroacetamida;

B.  $X^2$  es N o  $NR^{8b}$ ; y R es  $-NR^2R^3$ ; y

a.  $R^2$  y  $R^3$  no son simultáneamente metilo; y/o

b. cuando  $X^1$  es O; entonces al menos uno de  $R^{8b}$ ,  $R^{8c}$ ,  $R^{6c}$  o  $R^{6d}$  es distinto de hidrógeno; y el compuesto no es:

1150100-88-1 N'-[2,4-difluoro-5-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenil]-N-fenil-N-4-piperidinilurea,

938467-87-9 N'-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-N-(3,3-difenilpropil)-N-[2-(4-morfolinil)etil]-urea,

1808766-39-3 4-(3-clorofenil)-N-[4-fluoro-3-(1H-1,2,4-triazol-5-il)fenil]-1-piperazinacarboxamida,

1071521-28-2 4-(3-fluorobenzoil)-N-[4-fluoro-3-[3-(1-metiletil)-1,2,4-oxadiazol-5-il]fenil]-1-piperazinacarboxamida,

1071521-22-6 4-(3-fluorobenzoil)-N-[4-fluoro-3-(1H-1,2,4-triazol-5-il)fenil]-1-piperazinacarboxamida,

1095716-86-1 N-[4-cloro-3-etil-5-(1-metil-1H-pirazol-4-il)fenil]-7,8-dihidro-4-(2-metilfenil)-2-(3-piridinil)pirido[4,3-d]pirimidina-6(5H)-carboxamida, o

1150100-22-3 N-[4-[[5-[[4-[[[2,4-difluoro-5-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenil]amino]carbonil]fenilamino]-1-piperidinil]metil]-6-metil-2-piridinil]oxi]fenil]metanosulfonamida;

C.  $X^1$  es N o  $CR^{6a}$ ,  $X^2$  es O,  $X^3$  es N o  $CR^{6c}$  y  $X^4$  es N; y

a. donde R es alquilo C1-6, el alquilo C1-6 está sustituido con uno a cinco Z1; y/o

b.  $R^{6c}$  no es 4-amino-2-[(3,4,5-trimetoxifenil)amino]-5-tiazolilo, [[4-(1-pirrolidinilmetil)fenil]amino]-5-tiazolilo o [[6-(4-metil-1-piperazinil)-3-piridinil]amino]-5-tiazolilo; y/o

c. cuando R es -OR<sup>7</sup>; entonces R<sup>7</sup> no es iso-butilo o terc-butilo;

y el compuesto no es:

2024618-95-7 ( $\alpha$ R,5R,8S)-N-[4-cloro-3-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenil]-5,6,7,8-tetrahidro- $\alpha$ ,2,5-trimetil-8-quinolineacetamida;

D. X<sup>1</sup> es O, X<sup>2</sup> es N o CR<sup>6b</sup>, X<sup>3</sup> es CR<sup>6c</sup>, X<sup>4</sup> es N, R<sup>6c</sup> es distinto de hidrógeno; y R es -NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> juntos forman un heterociclilo, que puede además estar opcionalmente sustituido independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>; y ocurre al menos uno de los siguientes a.-d.:

a. X<sup>2</sup> es N; o

b. R<sup>1</sup> es distinto de metilo; o

c. R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> forman un heterociclilo puenteado opcionalmente sustituido, que está opcionalmente fusionado a un anillo arilo o heteroarilo; o

d. R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> forman un heterociclilo monocíclico de 7 miembros opcionalmente sustituido, que está opcionalmente fusionado a un anillo arilo o heteroarilo;

y el compuesto no es:

2433600-20-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-7-azabicyclo[2.2.1]heptano-7-carboxamida,

1950533-91-1 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-2,5-diazabicyclo[2.2.2]octano-2-carboxamida,

1956717-19-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3,9-diazabicyclo[4.2.1]nonano-9-carboxamida,

1951851-26-5 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,

1950762-35-2 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3-oxa-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,

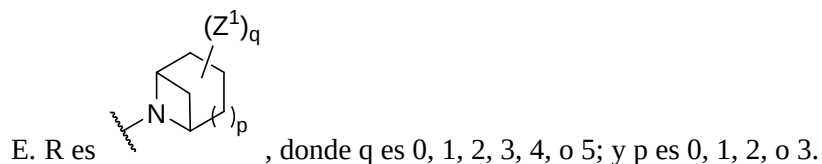
1948326-39-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-8-oxa-3-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxamida,

2390318-25-7 (1S,4S) 2-tia-5-azabicyclo[2.2.1]heptano-5-carboxamida, N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-, 2-óxido, -,

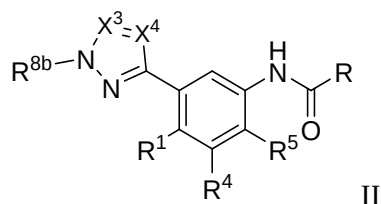
- 2134719-79-0 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3-oxo-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,
- 1951235-51-0 1,3,3a,4,5,6,7,7a-octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-eteno-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 2128457-53-2 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4-azatriciclo[4.3.1.1<sup>3</sup>,8]undecano-4-carboxamida,
- 1943194-72-6 (3aR,7aS)-1,3,3a,4,7,7a-hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 1954930-48-3 octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 1950392-13-8 1,3,3a,4,7,7a-hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-epoxi-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 2127527-42-6 octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-epoxi-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 2321449-65-2 rel-(3aR,4S,7R)-octahidro-3a-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 1943187-21-0 (4S,7R)-octahidro-3a-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,
- 2128457-20-3 hexahidro-2-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,
- 2129297-32-9 hexahidro-3,5-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,
- 2430356-12-8 hexahidro-4-metoxi-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,
- 2135054-93-0 hexahidro-3,3-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,
- 2130442-49-6 hexahidro-4,4-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,

2134261-73-5 hexahidro-2,6-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida, o

1944921-02-1 hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-2-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)-1H-azepina-1-carboxamida;



2. Un compuesto de Fórmula II:



o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo enriquecido isotópicamente, tautómero, estereoisómero, mezcla de estereoisómeros de los mismos, en el que:

$X^3$  es N o  $CR^{6c}$ ;

$X^4$  es N o  $CR^{6d}$ ;

R es  $-NR^2R^3$ ,  $-OR^7$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$  está sustituido con halo o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , y opcionalmente uno a cuatro  $Z^1$ ; y donde el alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$  está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^1$  es halo, ciano, alquilo  $C_{1-3}$ , alquenilo  $C_{2-3}$ , alquinilo  $C_{2-3}$ , o cicloalquilo  $C_{3-6}$ ; en donde el alquilo  $C_{1-3}$ , alquenilo  $C_{2-3}$ , alquinilo  $C_{2-3}$ , o cicloalquilo  $C_{3-6}$ , está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^2$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco  $Z^1$ ;



R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco Z<sup>1</sup>;

o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> juntos forman un heterociclilo, que además puede sustituirse opcionalmente independientemente por uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>5</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, el alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6c</sup> y R<sup>6d</sup> son independientemente hidrógeno, halo, ciano, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde cada alquil C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>7</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>8b</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo es de manera independiente sustituido opcionalmente con 1 a 5 Z<sup>1</sup>;

o R<sup>8b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>6c</sup> y R<sup>6d</sup>, juntos forman un heterociclilo de 5 miembros, que además puede estar opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

cada Z<sup>1</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -S(O)R<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>12</sup>C(O)OR<sup>12</sup>; caracterizado porque cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>10</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>11</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>12</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1b</sup>;

cada Z<sup>1a</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>13</sup>, -SR<sup>13</sup>, -C(O)R<sup>13</sup>, -C(O)OR<sup>13</sup>, -S(O)R<sup>13</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -C(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>C(O)R<sup>13</sup>, -NR<sup>13</sup>S(O)R<sup>13</sup>, -NR<sup>13</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -S(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>C(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>S(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>13</sup>C(O)OR<sup>13</sup>; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1b</sup>;

cada R<sup>13</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>,

alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1b</sup>;

cada Z<sup>1b</sup> es independientemente halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -L-alquilo C<sub>1-6</sub>, -L-alquenilo C<sub>2-6</sub>, -L-alquinilo C<sub>2-6</sub>, -L-haloalquilo C<sub>1-6</sub>, -L-cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, -L-heterociclilo, -L-arilo o -L-heteroarilo; y

cada L es independientemente -O-, -NH-, -S-, -S(O)-, -S(O)<sub>2</sub>-, N(alquilo C<sub>1-6</sub>)-, N(alquenilo C<sub>2-6</sub>)-, N(alquinilo C<sub>2-6</sub>)-, N(haloalquilo C<sub>1-6</sub>)-, N(cicloalquilo C<sub>3-10</sub>)-, -N(heterociclilo)-, -N(arilo)-, -N(heteroarilo)-, -C(O)-, C(O)O-, -C(O)NH-, -C(O)-N(alquilo C<sub>1-6</sub>)-, -C(O)N(alquenilo C<sub>2-6</sub>)-, -C(O)N(alquinilo C<sub>2-6</sub>)-, -C(O)N(haloalquilo C<sub>1-6</sub>)-, -C(O)N(cicloalquilo C<sub>3-10</sub>)-, -C(O)N(heterociclilo)-, -C(O)N(arilo)-, -C(O)N(heteroarilo)-, -NHC(O)-, -NHC(O)O-, -NHC(O)NH-, -NHS(O)-, o -S(O)<sub>2</sub>NH-;

donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo y heteroarilo de Z<sup>1b</sup> y L se sustituye opcionalmente con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalkoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo;

siempre que:

cuando R es -OR<sup>7</sup>; entonces R<sup>7</sup> no es metilo, etilo, isopropilo, tert-butilo, 2-bromoetilo, 2-metoxietilo, 2-cianoetilo, 2-feniletilo, bencilo o 9H-fluoren-9-ilmetilo; y el compuesto no es:

129628-21-3 Éster 2-metil-2-propenílico del ácido [2,4-dicloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(metiltio)-1H-pirazol-3-il]fenil]-carbámico,

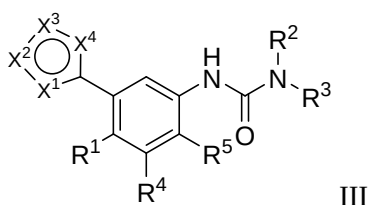
945236-54-4 1-(1,3-benzodioxol-5-il)-N-[4-metil-3-(1-metil-1H-pirazol-3-il)fenil]ciclopropanocarboxamida,

142622-93-3 N-[2,4-dicloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,2,2-trifluoroacetamida,

142621-98-5 N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]-2,2,2-trifluoroacetamida,

- 2231121-13-2 N-[4-bromo-2-fluoro-5-[2-[[2-(trimetilsilil)etoxi]metil]-2H-tetrazol-5-il]fenil]-1-(3-clorofenil)ciclopropanocarboxamida,
- 2231119-31-4 N-[4-bromo-3-[2-[[2-(trimetilsilil)etoxi]metil]-2H-tetrazol-5-il]fenil]-1-(3-clorofenil)ciclopropanocarboxamida,
- 159291-92-6 -bromo-N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]ciclopropanocarboxamida, o
- 141576-10-5 N-[2-cloro-5-[4-cloro-1-metil-5-(metilsulfonil)-1H-pirazol-3-il]-4-fluorofenil]-2,2,2-trifluoroacetamida.

3. Un compuesto de Fórmula III:



o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo enriquecido isotópicamente, tautómero, estereoisómero, mezcla de estereoisómeros de los mismos, en el que:

$X^1$  es N,  $NR^{8a}$ , O, S, o  $CR^{6a}$ ;

$X^2$  es N o  $NR^{8b}$ ;

$X^3$  es N,  $NR^{8c}$ , o  $CR^{6c}$ ;

$X^4$  es N o  $CR^{6d}$ ;

Con la condición de que el anillo conteniendo  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ , y  $X^4$  es aromático;

$R^1$  es halo, ciano, alquilo  $C_{1-3}$ , alquenilo  $C_{2-3}$ , alquinilo  $C_{2-3}$ , o cicloalquilo  $C_{3-6}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^2$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco  $Z^1$ ;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente de forma independiente por uno a cinco Z<sup>1</sup>;

o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> juntos forman un heterociclilo, que además puede sustituirse opcionalmente por uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>5</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup>, R<sup>6c</sup>, y R<sup>6d</sup> son independientemente hidrógeno, halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; caracterizado porque cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>8a</sup>, R<sup>8b</sup>, y R<sup>8c</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo es de manera independiente sustituido opcionalmente con 1 a 5 Z<sup>1</sup>;

o R<sup>6a</sup> y R<sup>8b</sup>, R<sup>8b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>8c</sup> y R<sup>6d</sup>, o R<sup>6c</sup> y R<sup>6d</sup>, juntos forman un cicloalquilo de 5 miembros o un heterociclilo de 5 miembros, que además puede estar opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

cada  $Z^1$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{SR}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{12}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{S}(\text{O})\text{R}^{12}$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{12}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{NR}^{12}\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ , o  $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ ; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{10}$  es independientemente alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{11}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $\text{R}^{12}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1a}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{SR}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ , o  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $\text{R}^{13}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1b}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $\text{C}_{1-6}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$ , alquenil  $\text{C}_{2-6}$ , alquinilo  $\text{C}_{2-6}$ , cicloalquilo  $\text{C}_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{L}$ -alquilo  $\text{C}_{1-6}$ ,  $-\text{L}$ -

haloalquilo C<sub>1-6</sub>, -L-alquenil C<sub>2-6</sub>, -L-alquinilo C<sub>2-6</sub>, -L-cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, -L-heterociclilo, -L-arilo, -L-heteroarilo; y

cada L es independientemente -O-, -NH-, -S-, -S(O)-, -S(O)<sub>2</sub>-, N(alquilo C<sub>1-6</sub>)-, N(alquenil C<sub>2-6</sub>)-, N(alquinilo C<sub>2-6</sub>)-, N(haloalquilo C<sub>1-6</sub>)-, N(cicloalquilo C<sub>3-10</sub>)-, -N(heterociclilo)-, -N(arilo)-, -N(heteroarilo)-, -C(O)-, -C(O)O-, -C(O)NH-, -C(O)-N(alquilo C<sub>1-6</sub>)-, -C(O)N(alquenil C<sub>2-6</sub>)-, -C(O)N(alquinilo C<sub>2-6</sub>)-, -C(O)N(haloalquilo C<sub>1-6</sub>)-, -C(O)N(cicloalquilo C<sub>3-10</sub>)-, -C(O)N(heterociclilo)-, -C(O)N(arilo)-, -C(O)N(heteroarilo)-, -NHC(O)-, -NHC(O)O-, -NHC(O)NH-, -NHS(O)-, o -S(O)<sub>2</sub>NH-;

donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, heterociclilo, arilo y heteroarilo de Z<sup>1b</sup> y L se sustituye opcionalmente con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -SF<sub>5</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo;

siempre que:

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> no sean simultáneamente metilo;

cuando X<sup>1</sup> sea O; entonces al menos uno de R<sup>8b</sup>, R<sup>8c</sup>, R<sup>6c</sup> o R<sup>6d</sup> sea distinto de hidrógeno; y

el compuesto no es:

1150100-88-1 N'-[2,4-difluoro-5-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenil]-N-fenil-N-4-piperidinilurea,

938467-87-9 N'-[4-cloro-3-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenil]-N-(3,3-difenilpropil)-N-[2-(4-morfolinil)etil]-urea,

1808766-39-3 4-(3-clorofenil)-N-[4-fluoro-3-(1H-1,2,4-triazol-5-il)fenil]-1-piperazinacarboxamida,

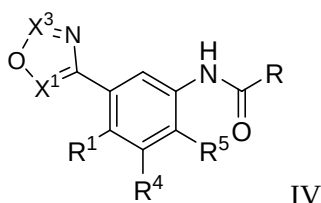
1071521-28-2 4-(3-fluorobenzoi)-N-[4-fluoro-3-[3-(1-metiletil)-1,2,4-oxadiazol-5-il]fenil]-1-piperazinacarboxamida,

1071521-22-6 4-(3-fluorobenzoi)-N-[4-fluoro-3-(1H-1,2,4-triazol-5-il)fenil]-1-piperazinacarboxamida,

1095716-86-1 N-[4-cloro-3-etil-5-(1-metil-1H-pirazol-4-il)fenil]-7,8-dihidro-4-(2-metilfenil)-2-(3-piridinil)pirido[4,3-d]pirimidina-6(5H)-carboxamida, o

1150100-22-3 N-[4-[[5-[[4-[[[2,4-difluoro-5-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenil]amino]carbonil]fenilamino]-1-piperidinil]metil]-6-metil-2-piridinil]oxi]fenil]metanosulfonamida.

4. Un compuesto de Fórmula IV:



o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo enriquecido isotópicamente, tautómero, estereoisómero, mezcla de estereoisómeros de los mismos, en el que:

$X^1$  es N o  $CR^{6a}$ ;

$X^3$  es N o  $CR^{6c}$ ;

R es  $-NR^2R^3$ ,  $-OR^7$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , donde el alquilo  $C_{1-6}$  está sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ; y donde el alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$  está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^1$  es halo, ciano, alquilo  $C_{1-3}$ , alquenilo  $C_{2-3}$ , alquinilo  $C_{2-3}$ , o cicloalquilo  $C_{3-6}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , o cicloalquilo  $C_{3-10}$ , está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^2$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^3$  es alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco  $Z^1$ ;

o  $R^2$  y  $R^3$  juntos forman un heterociclilo, que además puede sustituirse opcionalmente por uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^4$  es hidrógeno, halo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-N(R^{11})_2$ ,  $-OR^{11}$ ,  $-SR^{11}$ ,  $-C(O)R^{11}$ ,  $-C(O)OR^{11}$ ,  $-S(O)R^{11}$ , -



$S(O)_2R^{11}$ ,  $-C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)_2R^{11}$ ,  $-S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{11})_2$ , o  $-NR^{11}C(O)OR^{11}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^5$  es hidrógeno, halo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-N(R^{11})_2$ ,  $-OR^{11}$ ,  $-SR^{11}$ ,  $-C(O)R^{11}$ ,  $-C(O)OR^{11}$ ,  $-S(O)R^{11}$ ,  $-S(O)_2R^{11}$ ,  $-C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)_2R^{11}$ ,  $-S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{11})_2$ , o  $-NR^{11}C(O)OR^{11}$ ; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^{6a}$  y  $R^{6c}$  son independientemente hidrógeno, halo, ciano,  $-NO_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-N(R^{11})_2$ ,  $-OR^{10}$ ,  $-SR^{10}$ ,  $-C(O)R^{11}$ ,  $-C(O)OR^{11}$ ,  $-S(O)R^{11}$ ,  $-S(O)_2R^{11}$ ,  $-C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)R^{11}$ ,  $-NR^{11}S(O)_2R^{11}$ ,  $-S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}C(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)N(R^{11})_2$ ,  $-NR^{11}S(O)_2N(R^{11})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{11})_2$ , o  $-NR^{11}C(O)OR^{11}$ ; caracterizado porque cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^1$ ;

$R^7$  is alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^1$ ;

cada  $Z^1$  es independientemente halo, ciano,  $-NO_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-N(R^{12})_2$ ,  $-OR^{12}$ ,  $-SR^{12}$ ,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-C(O)OR^{12}$ ,  $-S(O)R^{12}$ ,  $-S(O)_2R^{12}$ ,  $-C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}S(O)R^{12}$ ,  $-NR^{12}S(O)_2R^{12}$ ,  $-S(O)N(R^{12})_2$ ,  $-S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}S(O)N(R^{12})_2$ ,  $-NR^{12}S(O)_2N(R^{12})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{12})_2$ , o  $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ ; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $R^{10}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $R^{11}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $R^{12}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1a}$  es independientemente halo, ciano,  $-NO_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-N(R^{13})_2$ ,  $-OR^{13}$ ,  $-SR^{13}$ ,  $-C(O)R^{13}$ ,  $-C(O)OR^{13}$ ,  $-S(O)R^{13}$ ,  $-S(O)_2R^{13}$ ,  $-C(O)N(R^{13})_2$ ,  $-NR^{13}C(O)R^{13}$ ,  $-NR^{13}S(O)R^{13}$ ,  $-NR^{13}S(O)_2R^{13}$ ,  $-S(O)N(R^{13})_2$ ,  $-S(O)_2N(R^{13})_2$ ,  $-NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ ,  $-NR^{13}S(O)N(R^{13})_2$ ,  $-NR^{13}S(O)_2N(R^{13})_2$ ,  $-OC(O)N(R^{13})_2$ , o  $-NR^{13}C(O)OR^{13}$ ; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $R^{13}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1b}$  es independientemente halo, ciano,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NO_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo, L-alquilo  $C_{1-6}$ , L-haloalquilo  $C_{1-6}$ , L-alquenil  $C_{2-6}$ , L-alquinilo  $C_{2-6}$ , L-cicloalquilo  $C_{3-10}$ , L-heterociclilo, L-arilo, L-heteroarilo; y

cada L es independientemente  $-O-$ ,  $-NH-$ ,  $-S-$ ,  $-S(O)-$ ,  $-S(O)_2-$ ,  $N(\text{alquilo } C_{1-6})-$ ,  $N(\text{alquenil } C_{2-6})-$ ,  $N(\text{alquinilo } C_{2-6})-$ ,  $N(\text{haloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $N(\text{cicloalquilo } C_{3-10})-$ ,  $-N(\text{heterociclilo})-$ ,  $-N(\text{arilo})-$ ,  $-N(\text{heteroarilo})-$ ,  $-C(O)-$ ,  $C(O)O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)-N(\text{alquilo } C_{1-6})-$ ,  $-C(O)N(\text{alquenil } C_{2-6})-$ ,  $-C(O)N(\text{alquinilo } C_{1-6})-$ ,  $-C(O)N(\text{haloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $-C(O)N(\text{cicloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $-C(O)N(\text{heterociclilo})-$ ,  $-C(O)N(\text{arilo})-$ ,  $-C(O)N(\text{heteroarilo})-$ ,  $-NHC(O)-$ ,  $-NHC(O)O-$ ,  $-NHC(O)NH-$ ,  $-NHS(O)-$ , o  $-S(O)_2NH-$ ;

donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , heterociclilo, arilo y heteroarilo de  $Z^{1b}$  y L se sustituye opcionalmente con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano,  $-OH$ ,  $-SH$ ,  $-NH_2$ ,  $-NO_2$ ,  $-SF_5$ ,

alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>2-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo;

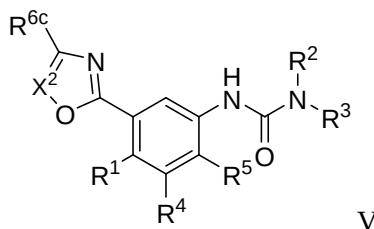
siempre que:

R<sup>6c</sup> no sea 4-amino-2-[(3,4,5-trimetoxifenil)amino]-5-tiazolilo, [[4-(1-pirrolidinilmetil)fenil]amino]-5-tiazolilo o [[6-(4-metil-1-piperazinil)-3-piridinil]amino]-5-tiazolilo;

cuando R sea -OR<sup>7</sup>; entonces R<sup>7</sup> no sea iso-butilo o terc-butilo; y el compuesto no sea:

2024618-95-7 (αR,5R,8S)-N-[4-cloro-3-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenil]-5,6,7,8-tetrahidro-α,2,5-trimetil-8-quinolineacetamida.

5. Un compuesto de Fórmula V:



o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo enriquecido isotópicamente, tautómero, estereoisómero, mezcla de estereoisómeros de los mismos, en el que:

X<sup>2</sup> es N o CR<sup>6b</sup>;

R<sup>1</sup> es halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub>, alquenilo C<sub>2-3</sub>, alquinilo C<sub>2-3</sub>, o cicloalquilo C<sub>3-6</sub>; donde el alquilo C<sub>1-3</sub>, alquenilo C<sub>2-3</sub>, alquinilo C<sub>2-3</sub>, o cicloalquilo C<sub>3-6</sub>, está opcionalmente sustituido con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>2</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, el heterociclilo, el arilo o el heteroarilo se sustituyen opcionalmente por uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -

NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>5</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6b</sup> es independientemente hidrógeno, halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; caracterizado porque cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6c</sup> es independientemente hidrógeno, halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; caracterizado porque cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

o R<sup>6b</sup> y R<sup>6c</sup> juntos forman un heterociclilo de 5 miembros, que además puede estar opcionalmente sustituido independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

cada Z<sup>1</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -S(O)R<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>12</sup>C(O)OR<sup>12</sup>; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada  $R^{10}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $R^{11}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco  $Z^{1a}$ ;

cada  $R^{12}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1a}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo,  $-\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{SR}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ ,  $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ , o  $-\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ ; donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $R^{13}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1b}$  es independientemente halo, ciano,  $-\text{OH}$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{NO}_2$ , alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo, L-alquilo  $C_{1-6}$ , L-haloalquilo  $C_{1-6}$ , L-alquenil  $C_{2-6}$ , L-alquinilo  $C_{2-6}$ , L-cicloalquilo  $C_{3-10}$ , L-heterociclilo, L-arilo, L-heteroarilo; y

cada L es independientemente  $-\text{O}-$ ,  $-\text{NH}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{S}(\text{O})-$ ,  $-\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{N}(\text{alquilo } C_{1-6})-$ ,  $\text{N}(\text{alquenil } C_{2-6})-$ ,  $\text{N}(\text{alquinilo } C_{2-6})-$ ,  $\text{N}(\text{haloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $\text{N}(\text{cicloalquilo } C_{3-10})-$ ,  $-\text{N}(\text{heterociclilo})-$ ,  $-\text{N}(\text{arilo})-$ ,  $-\text{N}(\text{heteroarilo})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $\text{C}(\text{O})\text{O}-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{alquilo } C_{1-6})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{alquenil } C_{2-6})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{alquinilo } C_{1-6})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{haloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{cicloalquilo } C_{1-6})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{heterociclilo})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{arilo})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{heteroarilo})-$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})-$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{O}-$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}-$ ,  $-\text{NHS}(\text{O})-$ , o  $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ;

donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub>, alquino C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, heterociclilo, arilo y heteroarilo de Z<sup>1b</sup> y L se sustituye opcionalmente con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -SF<sub>5</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub>, alquino C<sub>2-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxiC<sub>2-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo;

siempre que se dé uno o más de los siguientes casos:

X<sup>2</sup> es N;

R<sup>1</sup> es distinto de metilo;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> forman un heterociclilo puenteado opcionalmente sustituido, que está opcionalmente fusionado a un anillo arilo o heteroarilo; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> forman un heterociclilo monocíclico de 7 miembros opcionalmente sustituido, que está opcionalmente fusionado a un anillo arilo o heteroarilo;

y el compuesto no es:

2433600-20-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-7-azabicyclo[2.2.1]heptano-7-carboxamida,

1950533-91-1 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-2,5-diazabicyclo[2.2.2]octano-2-carboxamida,

1956717-19-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3,9-diazabicyclo[4.2.1]nonano-9-carboxamida,

1951851-26-5 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,

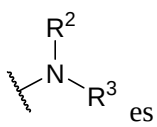
1950762-35-2 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3-oxa-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,

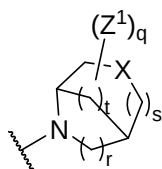
1948326-39-3 N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-8-oxa-3-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carboxamida,

2390318-25-7 2-tia-5-azabicyclo[2.2.1]heptano-5-carboxamida, N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-, 2-óxido, (1S,4S)-,

|              |                                                                                                                  |
|--------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2134719-79-0 | N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-3-oxo-8-azabicyclo[3.2.1]octano-8-carboxamida,                           |
| 1951235-51-0 | 1,3,3a,4,5,6,7,7a-octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-eteno-2H-isoindol-2-carboxamida,         |
| 2128457-53-2 | N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4-azatriciclo[4.3.1.1 <sup>3,8</sup> ]undecano-4-carboxamida,            |
| 1943194-72-6 | (3aR,7aS)-1,3,3a,4,7,7a-hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,  |
| 1954930-48-3 | octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,                          |
| 1950392-13-8 | 1,3,3a,4,7,7a-hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-epoxi-2H-isoindol-2-carboxamida,             |
| 2127527-42-6 | octahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-epoxi-2H-isoindol-2-carboxamida,                           |
| 2321449-65-2 | rel-(3aR,4S,7R)-octahidro-3a-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida, |
| 1943187-21-0 | (4S,7R)-octahidro-3a-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-4,7-metano-2H-isoindol-2-carboxamida,         |
| 2128457-20-3 | hexahidro-2-metil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,                              |
| 2129297-32-9 | hexahidro-3,5-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,                          |
| 2430356-12-8 | hexahidro-4-metoxi-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,                             |
| 2135054-93-0 | hexahidro-3,3-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,                          |
| 2130442-49-6 | hexahidro-4,4-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida,                          |

- 2134261-73-5 hexahidro-2,6-dimetil-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-1H-azepina-1-carboxamida, o
- 1944921-02-1 hexahidro-N-[4-metil-3-(4-metil-2-oxazolil)fenil]-2-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)-1H-azepina-1-carboxamida.

6. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-5, donde R o la mitad  es



, la cual puede estar opcionalmente fusionada a arilo C<sub>6</sub>; donde:

q es 0, 1, 2, o 3;

r es 0 o 1;

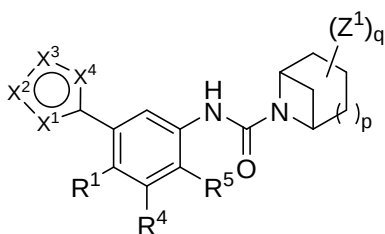
s es 0, 1, o 2;

t es 1 o 2;

X es CH<sub>2</sub>, CHZ<sup>1</sup>, C(Z<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>9</sup>, O, o S; y

R<sup>9</sup> es H o Z<sup>1</sup>.

7. Un compuesto de Fórmula VI:



VI

o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo enriquecido isotópicamente, tautómero, estereoisómero, mezcla de estereoisómeros de los mismos, en el que:

X<sup>1</sup> es N, NR<sup>8a</sup>, O, S, o CR<sup>6a</sup>;

X<sup>2</sup> es N, NR<sup>8b</sup>, O, S, o CR<sup>6b</sup>;



X<sup>3</sup> es N, NR<sup>8c</sup>, o CR<sup>6c</sup>;

X<sup>4</sup> es N o CR<sup>6d</sup>;

Con la condición de que al menos uno de X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, y X<sup>4</sup> es N, y el anillo conteniendo X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, y X<sup>4</sup> es aromático;

q es 0, 1, 2, 3, 4, o 5;

p es 0, 1, 2, o 3;

R<sup>1</sup> es halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub>, alquenilo C<sub>2-3</sub>, alquinilo C<sub>2-3</sub>, o cicloalquilo C<sub>3-6</sub>; donde el alquilo C<sub>1-3</sub>, alquenilo C<sub>2-3</sub>, alquinilo C<sub>2-3</sub>, o cicloalquilo C<sub>3-6</sub>, está opcionalmente sustituido con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>5</sup> es hidrógeno, halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>11</sup>, -SR<sup>11</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup>, R<sup>6c</sup>, y R<sup>6d</sup> son independientemente hidrógeno, halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -C(O)R<sup>11</sup>, -C(O)OR<sup>11</sup>, -S(O)R<sup>11</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)R<sup>11</sup>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>, -S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>11</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>11</sup>C(O)OR<sup>11</sup>; caracterizado porque cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo, se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

R<sup>8a</sup>, R<sup>8b</sup>, y R<sup>8c</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, o heteroarilo es de manera independiente sustituido opcionalmente con 1 a 5 Z<sup>1</sup>;

o R<sup>8a</sup> y R<sup>6b</sup>, o R<sup>8b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>6b</sup> y R<sup>6c</sup>, o R<sup>8c</sup> y R<sup>6d</sup>, o R<sup>6c</sup> y R<sup>6d</sup>, juntos forman un cicloalquilo de 5 miembros o un heterociclilo de 5 miembros, que además puede estar opcionalmente sustituido de forma independiente con uno a cinco Z<sup>1</sup>;

cada Z<sup>1</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>12</sup>, -SR<sup>12</sup>, -C(O)R<sup>12</sup>, -C(O)OR<sup>12</sup>, -S(O)R<sup>12</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)R<sup>12</sup>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, -S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>C(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>12</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>12</sup>C(O)OR<sup>12</sup>; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>10</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>11</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente de manera independiente con uno a cinco Z<sup>1a</sup>;

cada R<sup>12</sup> es independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1b</sup>;

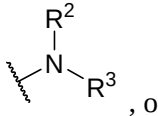
cada Z<sup>1a</sup> es independientemente halo, ciano, -NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -OR<sup>13</sup>, -SR<sup>13</sup>, -C(O)R<sup>13</sup>, -C(O)OR<sup>13</sup>, -S(O)R<sup>13</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -C(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>C(O)R<sup>13</sup>, -NR<sup>13</sup>S(O)R<sup>13</sup>, -NR<sup>13</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>13</sup>, -S(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>C(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>S(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -NR<sup>13</sup>S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)N(R<sup>13</sup>)<sub>2</sub>, o -NR<sup>13</sup>C(O)OR<sup>13</sup>; donde cada alquilo C<sub>1-6</sub>, alquenil C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-10</sub>, heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco Z<sup>1b</sup>;

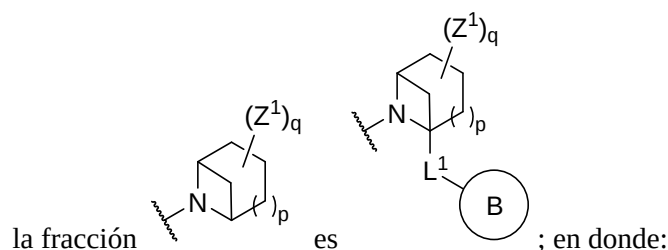
cada  $R^{13}$  es independientemente hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo; donde cada alquilo alquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente independientemente con uno a cinco  $Z^{1b}$ ;

cada  $Z^{1b}$  es independientemente halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alquenil  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, heteroarilo, L-alquilo  $C_{1-6}$ , L-haloalquilo  $C_{1-6}$ , L-alquenil  $C_{2-6}$ , L-alquinilo  $C_{2-6}$ , L-cicloalquilo  $C_{3-10}$ , L-heterociclilo, L-arilo, L-heteroarilo; y

cada L es independientemente -O-, -NH-, -S-, -S(O)-, -S(O)<sub>2</sub>-, N(alquilo  $C_{1-6}$ )-, N(alquenilo  $C_{2-6}$ )-, N(alquinilo  $C_{2-6}$ )-, N(haloalquilo  $C_{1-6}$ )-, N(cicloalquilo  $C_{3-10}$ )-, -N(heterociclilo)-, -N(arilo)-, -N(heteroarilo)-, -C(O)-, C(O)O-, -C(O)NH-, -C(O)-N(alquilo  $C_{1-6}$ )-, -C(O)N(alquenil  $C_{2-6}$ )-, -C(O)N(alquinilo  $C_{1-6}$ )-, -C(O)N(haloalquilo  $C_{1-6}$ )-, -C(O)N(cicloalquilo  $C_{1-6}$ )-, -C(O)N(heterociclilo)-, -C(O)N(arilo)-, -C(O)N(heteroarilo)-, -NHC(O)-, -NHC(O)O-, -NHC(O)NH-, -NHS(O)-, o -S(O)<sub>2</sub>NH-;

donde cada alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , heterociclilo, arilo y heteroarilo de  $Z^{1b}$  y L se sustituye opcionalmente con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano, -OH, -SH, -NH<sub>2</sub>, -NO<sub>2</sub>, -SF<sub>5</sub>, alquilo  $C_{1-6}$ , alquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi  $C_{2-6}$ , haloalcoxi  $C_{1-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo y heteroarilo;

8. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-5 o 7, en el que R, la fracción , o



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

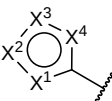
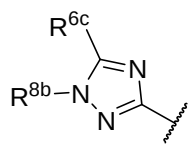
p es 0, 1, 2, o 3;

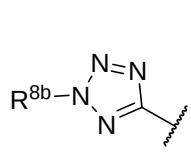
el anillo B es cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, o heteroarilo; donde el cicloalquilo  $C_{3-10}$ , heterociclilo, arilo, o heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno a cinco  $Z^{1b}$ ; y

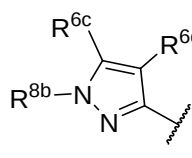
$L^1$  es un enlace, alquilenilo  $C_{1-4}$ , alquenilenilo  $C_{2-4}$ , o alquinilenilo  $C_{2-4}$ .

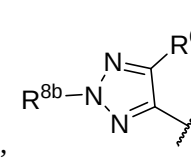
9. El compuesto de la reivindicación 7 u 8, en el que p es 1.
10. El compuesto de la reivindicación 6, 7 u 8, en el que q es 1 o 2.
11. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R1 es halo, ciano, alquilo C1-3, haloalquilo C1-3 o cicloalquilo C3-6 opcionalmente sustituido con ciano o metilo.
12. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R1 es flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, isopropilo, difluorometilo, trifluorometilo, ciclobutilo o ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o metilo.
13. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R1 es cloro, ciano o trifluorometilo.
14. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R4 es hidrógeno o alquilo C1-6.
15. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R4 es hidrógeno o metilo.
16. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R5 es hidrógeno o halo.
17. El compuesto de cualquier reivindicación anterior, en el que R5 es hidrógeno o flúor.

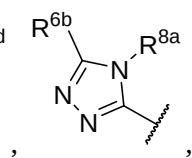
18. El compuesto de la reivindicación 1 o 7, donde la fracción
 

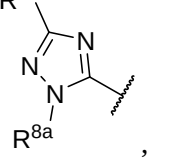

es


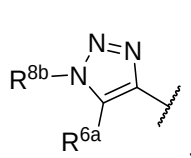


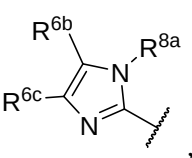


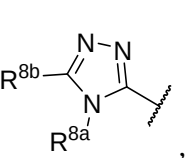


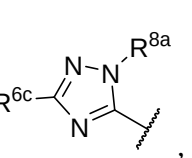


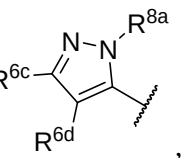


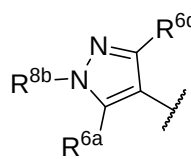


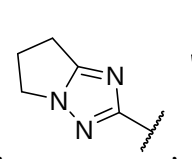


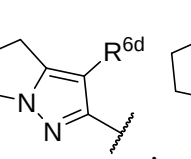


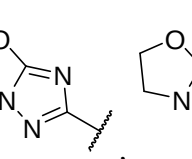


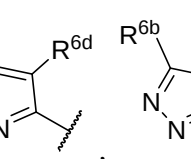


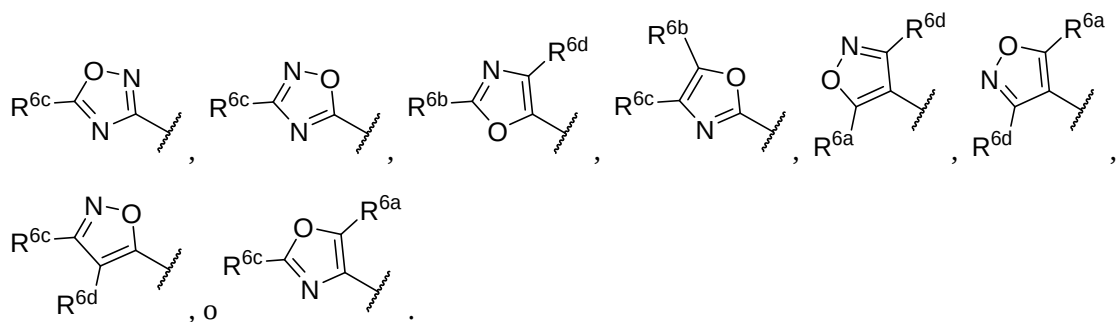












19. Un compuesto seleccionado de la Tabla 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
20. Un compuesto seleccionado de la Tabla 2, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
21. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
22. Un método para inhibir la actividad de SARM1, comprendiendo el método poner en contacto una célula con una cantidad eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, siendo la composición farmacéutica de la reivindicación 21.
23. El método de la reivindicación 22, en el que el contacto es in vivo.
24. El método para tratar una enfermedad o afección mediada, al menos en parte, por SARM1, comprendiendo el método administrar a un sujeto que lo necesite, una cantidad eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21.
25. El método para inhibir la degeneración axonal, comprendiendo el método administrar a un sujeto que lo necesite, una cantidad eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21.

26. El método para tratar una enfermedad o trastorno neurodegenerativo o neurológico, comprendiendo el método administrar una cantidad eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21, a un sujeto que lo necesite.
27. El método de la reivindicación 26, en el que la enfermedad o trastorno neurológico o neurodegenerativo está asociado con degeneración axonal, daño axonal, axonopatía, una enfermedad desmielinizante, una mielinolisis pontina central, una enfermedad o trastorno de lesión nerviosa, una enfermedad metabólica, una enfermedad mitocondrial, degeneración axonal metabólica, daño axonal resultante de una lesión axonal traumática (TAI), una leucoencefalopatía o una leucodistrofia.
28. El método de la reivindicación 24, en el que la enfermedad o afección es una lesión de la médula espinal, accidente cerebrovascular, esclerosis múltiple, leucoencefalopatía multifocal progresiva, hipomielinización congénita, encefalomyelitis, encefalomyelitis diseminada aguda, mielólisis pontina central, hiponatremia osmótica, desmielinización hipóxica, desmielinización isquémica, adrenoleucodistrofia, enfermedad de Alexander, enfermedad de Niemann-Pick, enfermedad de Pelizaeus Merzbacher, leucomalacia periventricular, leucodistrofia de células globoides (enfermedad de Krabbe), degeneración walleriana, neuritis óptica, mielitis transversa, esclerosis lateral amiotrófica (ELA, enfermedad de Lou Gehrig), enfermedad de Huntington, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Tay-Sacks, enfermedad de Gaucher, síndrome de Hurler, lesión cerebral traumática (LCT), lesión axonal traumática. (TAI), lesión posterior a la radiación, complicaciones neurológicas de la quimioterapia (neuropatía periférica inducida por quimioterapia, CIPN), neuropatía, neuropatía óptica isquémica aguda, deficiencia de vitamina B12, síndrome de deficiencia aislada de vitamina E, síndrome de Bassen-Kornzweig, degeneración retiniana, retinitis pigmentosa, glaucoma, retinitis pigmentosa, lesión óptica traumática, atrofia óptica hereditaria de Leber (neuropatía), amaurosis congénita de Leber, neuromielitis óptica, leucodistrofia metacromática, leucoencefalitis hemorrágica aguda, neuralgia del trigémino, parálisis de Bell, isquemia cerebral, atrofia multisistémica, glaucoma traumático, paraparesia espástica tropical, mielopatía asociada al virus linfotrópico de células T humanas 1 (HTLV-1), encefalopatía por el virus del Nilo occidental, encefalitis por el virus de La Crosse, encefalitis por Bunyavirus, encefalitis viral pediátrica, temblor esencial, enfermedad de Charcot-Marie-Tooth, neurona motora enfermedad, atrofia muscular espinal (AME), neuropatía autonómica y sensitiva hereditaria (HSAN), adrenomieloneuropatía, parálisis supranuclear progresiva (PSP), ataxia de Fredrich, ataxias hereditarias, pérdida auditiva inducida por ruido, pérdida auditiva congénita, demencia con cuerpos de Lewy, demencia frontotemporal,

amiloidosis, neuropatía diabética, neuropatía por VIH, neuropatías y axonopatías entéricas, síndrome de Guillain-Barré o neuropatía axonal motora aguda grave (AMAN).

29. Un método para el tratamiento de la neuropatía periférica inducida por quimioterapia (CIPN), comprendiendo el procedimiento la administración a un sujeto que lo necesite de una cantidad eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o una sal farmacéuticamente aceptable, un análogo enriquecido isotópicamente, un estereoisómero, un tautómero o una mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21.
30. Un uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o una sal farmacéuticamente aceptable, un análogo enriquecido isotópicamente, un estereoisómero, un tautómero o una mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21, para el tratamiento de una enfermedad o afección mediada, en al menos en parte, por SARM1.
31. El uso de la reivindicación 29, en el que la enfermedad o afección es una lesión de la médula espinal, accidente cerebrovascular, esclerosis múltiple, leucoencefalopatía multifocal progresiva, hipomielinización congénita, encefalomiелitis, encefalomiелitis diseminada aguda, mielólisis pontina central, hiponatremia osmótica, desmielinización hipóxica, desmielinización isquémica, adrenoleucodistrofia, enfermedad de Alexander, enfermedad de Niemann-Pick, enfermedad de Pelizaeus Merzbacher, leucomalacia periventricular, leucodistrofia de células globoides (enfermedad de Krabbe), degeneración walleriana, neuritis óptica, miелitis transversa, esclerosis lateral amiotrófica (ELA, enfermedad de Lou Gehrig), enfermedad de Huntington, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Tay-Sacks, enfermedad de Gaucher, síndrome de Hurler, lesión cerebral traumática (LCT), lesión axonal traumática. (TAI), lesión postradiación, complicaciones neurológicas de la quimioterapia (neuropatía periférica inducida por quimioterapia, CIPN), neuropatía, neuropatía óptica isquémica aguda, deficiencia de vitamina B12, síndrome de deficiencia aislada de vitamina E, síndrome de Bassen-Kornzweig, degeneración retiniana, retinitis pigmentosa, glaucoma, lesión óptica traumática, atrofia óptica hereditaria de Leber (neuropatía), amaurosis congénita de Leber, neuromiелitis óptica, leucodistrofia metacromática, leucoencefalitis hemorrágica aguda, neuralgia del trigémino, parálisis de Bell, isquemia cerebral, atrofia multisistémica, glaucoma traumático, paraparesia espástica tropical, miелopatía asociada al virus linfotrópico de células T humanas 1 (HTLV-1), encefalopatía por el virus del Nilo occidental, encefalitis por el virus de La Crosse, encefalitis por Bunyavirus, encefalitis viral pediátrica, temblor esencial, enfermedad de Charcot-Marie-Tooth, enfermedad de las neuronas motoras, atrofia muscular espinal (AME), neuropatía autonómica y sensorial hereditaria (HSAN), adrenomiелoneuropatía, parálisis supranuclear progresiva (PSP), ataxia de Fredrich, ataxias hereditarias, pérdida auditiva inducida por ruido, pérdida auditiva

congénita, demencia por cuerpos de Lewy, demencia frontotemporal, amiloidosis, neuropatía diabética, neuropatía por VIH, neuropatías y axonopatías entéricas, síndrome de Guillain-Barré o neuropatía axonal motora aguda grave (AMAN).

32. Un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21, para uso en terapia.
33. Un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21, para su uso en el tratamiento de una lesión de la médula espinal, accidente cerebrovascular, esclerosis múltiple, leucoencefalopatía multifocal progresiva, hipomielinización congénita, encefalomielitis, encefalomielitis diseminada aguda, mielólisis pontina central, hiponatremia osmótica, desmielinización hipóxica, desmielinización isquémica, adrenoleucodistrofia, enfermedad de Alexander, enfermedad de Niemann-Pick, enfermedad de Pelizaeus Merzbacher, leucomalacia periventricular, leucodistrofia de células globoides (enfermedad de Krabbe), degeneración walleriana, neuritis óptica, mielitis transversa, esclerosis lateral amiotrófica (ELA, enfermedad de Lou Gehrig), enfermedad de Huntington, Enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Tay-Sacks, enfermedad de Gaucher, síndrome de Hurler, lesión cerebral traumática (LCT), lesión axonal traumática (LTC), lesión posterior a la radiación, complicaciones neurológicas de la quimioterapia (neuropatía periférica inducida por quimioterapia, CIPN), neuropatía, neuropatía óptica isquémica aguda, deficiencia de vitamina B12, síndrome de deficiencia aislada de vitamina E, síndrome de Bassen-Kornzweig, degeneración retiniana, retinitis pigmentosa, glaucoma, lesión óptica traumática, atrofia óptica hereditaria de Leber (neuropatía), amaurosis congénita de Leber, neuromielitis óptica, leucodistrofia metacromática, leucoencefalitis hemorrágica aguda, neuralgia del trigémino, parálisis de Bell, isquemia cerebral, atrofia multisistémica, glaucoma traumático, paraparesia espástica tropical, mielopatía asociada al virus linfotrópico T humano 1 (HTLV-1), encefalopatía por el virus del Nilo occidental, La Encefalitis por virus Crosse, encefalitis por Bunyavirus, encefalitis viral pediátrica, temblor esencial, enfermedad de Charcot-Marie-Tooth, enfermedad de las neuronas motoras, atrofia muscular espinal (AME), neuropatía autonómica y sensitiva hereditaria (HSAN), adrenomieloneuropatía, parálisis supranuclear progresiva (PSP), ataxia de Fredrich, ataxias hereditarias, pérdida auditiva inducida por ruido, pérdida auditiva congénita, demencia por cuerpos de Lewy, demencia frontotemporal, amiloidosis, neuropatía diabética, neuropatía por VIH, neuropatías y axonopatías entéricas, síndrome de Guillain-Barré o neuropatía axonal motora aguda grave (AMAN).



34. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-20, o una sal farmacéuticamente aceptable, análogo isotópicamente enriquecido, estereoisómero, tautómero o mezcla de estereoisómeros del mismo, o la composición farmacéutica de la reivindicación 21, para la fabricación de un medicamento para tratar una lesión de la médula espinal, accidente cerebrovascular, esclerosis múltiple, leucoencefalopatía multifocal progresiva, hipomielinización congénita, encefalomielitis, encefalomielitis diseminada aguda, mielólisis pontina central, hiponatremia osmótica, desmielinización hipóxica, desmielinización isquémica, adrenoleucodistrofia, enfermedad de Alexander, enfermedad de Niemann-Pick, enfermedad de Pelizaeus Merzbacher, leucomalacia periventricular, leucodistrofia de células globoides (enfermedad de Krabbe), degeneración walleriana, neuritis óptica, mielitis transversa, esclerosis lateral amiotrófica (ELA, enfermedad de Lou Gehrig), Enfermedad de Huntington, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Tay-Sacks, enfermedad de Gaucher, síndrome de Hurler, lesión cerebral traumática (LCT), lesión axonal traumática (LTP), lesión posterior a la radiación, complicaciones neurológicas de la quimioterapia (neuropatía periférica inducida por quimioterapia, CIPN), neuropatía, neuropatía óptica isquémica aguda, deficiencia de vitamina B12, síndrome de deficiencia aislada de vitamina E, síndrome de Bassen-Kornzweig, degeneración retiniana, retinitis pigmentosa, glaucoma, lesión óptica traumática, atrofia óptica hereditaria de Leber (neuropatía), amaurosis congénita de Leber, neuromielitis óptica, leucodistrofia metacromática, leucoencefalitis hemorrágica aguda, neuralgia del trigémino, parálisis de Bell, isquemia cerebral, atrofia multisistémica, glaucoma traumático, paraparesia espástica tropical, mielopatía asociada al virus linfotrópico de células T humanas 1 (HTLV-1), virus del Nilo occidental encefalopatía, encefalitis por el virus de La Crosse, encefalitis por Bunyavirus, encefalitis viral pediátrica, temblor esencial, enfermedad de Charcot-Marie-Tooth, enfermedad de la motoneurona, atrofia muscular espinal (AME), neuropatía autonómica y sensitiva hereditaria (HSAN), adrenomieloneuropatía, parálisis supranuclear progresiva (PSP), ataxia de Fredrich, ataxias hereditarias, pérdida auditiva inducida por ruido, pérdida auditiva congénita, demencia con cuerpos de Lewy, demencia frontotemporal, amiloidosis, neuropatía diabética, neuropatía por VIH, neuropatías y axonopatías entéricas, síndrome de Guillain-Barré o neuropatía axonal motora aguda grave (AMAN).