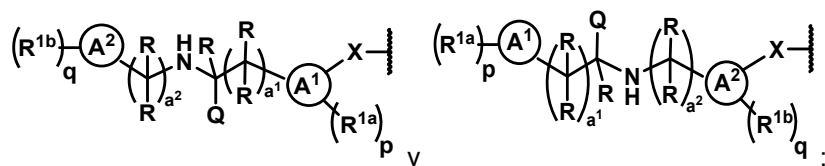


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que se une específicamente a la fosfatasa ácida 3 (ACP3), compuesto que tiene un peso molecular de 5000 Da o menos y una constante de disociación (K_d) de ACP3 de 50 nM o menos.
2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que se une específicamente a la ACP3 en la membrana de las células tumorales.
3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, que no se internaliza de forma significativa.
4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 que presenta una mayor captación en uno o más tumores que en uno o más órganos sanos tras su administración.
5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 que no se acumula de forma significativa en los riñones, las glándulas salivales ni la próstata sana tras su administración.
6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde el compuesto es tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 7 a 92.
7. Un compuesto, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, en donde la estructura del compuesto comprende (i) al menos un grupo R^1 y al menos un grupo seleccionado de R^2 y R^3 , o (ii) al menos un grupo R^1 , en donde:

R^1 se selecciona independientemente de:



Q se selecciona independientemente de PO_3H_2 , $PO_2N(R)_2$, PO_2NH_2 , $PO(OH)F$, $COOH$, $CON(R)_2$, $SO_2N(R)_2$, SO_3H y SO_2NH_2 ; preferiblemente PO_3H_2 , $COOH$ o SO_3H ; más preferiblemente PO_3H_2 ; lo más preferiblemente PO_3H_2 ;

A^1 se selecciona independientemente de arilo, heteroarilo, heterociclilo, alquilo, heteroalquilo, alquenilo, heteroalquenilo, alquinilo, heteroalquinilo, carbociclilo y heterociclilo;

preferiblemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heterociclilo de 5 a 10 miembros, alquilo C_{1-5} , alquenilo C_{2-5} , alquinilo C_{2-5} , carbociclilo C_{3-5} , heteroalquilo C_{1-5} , heteroalquenilo C_{2-5} , heteroalquinilo C_{2-5} y heterociclilo C_{3-5} ;

más preferiblemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C_2 , C_3 o C_4 , alquenilo de C_2 , C_3 o C_4 , alquinilo de C_2 , C_3 o C_4 , y carbociclilo de C_4 o C_5 ;

lo más preferiblemente de fenilo, naftilo, ciclopentilo, piridilo y tiofenilo;

A^2 se selecciona independientemente de arilo, heteroarilo, heterociclilo, alquilo, heteroalquilo, alquenilo, heteroalquenilo, alquinilo, heteroalquinilo, carbociclilo y heterociclilo;

preferiblemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heterociclilo de 5 a 10 miembros, alquilo C_{1-5} , alquenilo C_{2-5} , alquinilo C_{2-5} , carbociclilo C_{3-5} , heteroalquilo C_{1-5} ,

heteroalquenilo C₂₋₅, heteroalquinilo C₂₋₅ y heterociclilo C₃₋₅;

más preferiblemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C₂, C₃ o C₄, alquenilo de C₂, C₃ o C₄, alquinilo de C₂, C₃ o C₄, y carbociclilo de C₄ o C₅;

lo más preferiblemente de fenilo, naftilo, ciclopentilo, piridilo y tiofenilo;

X se selecciona independientemente de O, -CR(R)-, -CH₂-, -CH(Hal)-, -C(Hal)₂-, -arilo OC₆-, -alquilo OC₁₋₆-, -OalqueniloC₂₋₆-, -OalquiniloC₂₋₆-, S, -S(O)-, -S(O)₂-, -N(R)S(O)₂-, -S(O)₂(R)-, -N(R)-, -N(R)C(O)-, -C(O)N(R)-, -N(R)C(S)-, -C(S)N(R)-, -C(O)O-, -OC(O)-, -C(S)O-, -OC(S)-, -C(O)S-, -SC(O)-, -C(S)S-, -SC(S)-, -N(R)C(O)O-, -OC(O)N(R)-, -OC(S)N(R)-, -SC(O)N(R)-, -SC(S)N(R)-, -N(R)C(S)O-, -N(R)C(O)S-, -N(R)C(S)S-, -N(R)C(O)N(R)- y -N(R)C(S)N(R)- o está ausente;

preferiblemente de O, -CR(R)-, -C(Hal)₂-, -OariloC₆- o está ausente;

más preferiblemente de O, CH₂ y CF₂;

lo más preferiblemente O;

a¹ es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0, 1 o 2; más preferiblemente 0 o 1; lo más preferiblemente 0;

a² es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0, 1 o 2; más preferiblemente 0 o 1; lo más preferiblemente 1;

preferiblemente con la condición de que a¹ + a² ≥ 1;

a³ es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10;

p es independientemente 0 o un número entero de 1 o más; preferiblemente 0, 1, 2, 3 o 4; más preferiblemente 0, 1 o 2; lo más preferiblemente 0;

q es independientemente 0 o un número entero de 1 o más; preferiblemente 0, 1, 2, 3 o 4; más preferiblemente 0, 1 o 2; lo más preferiblemente 0;

cada uno de R^{1a} y R^{1b} se selecciona independientemente de OH, halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alquinilo, heteroalquilo, heteroalquenilo, heteroalquinilo, arilo, heteroarilo, alquiloxi, haloalquiloxi, alqueniloxi, alquiniloxi, heteroalquiloxi, heteroalqueniloxi, heteroalquiniloxi, ariloxi, heteroariloxi, CN, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo, -C(O)N(R)arilo, -C(O)N(R)heteroarilo, -N(R)C(O)arilo, -N(R)C(O)heteroarilo, -(C(O)N(R))^{a3}R, -(N(R)C(O))^{a3}R, amino, amonio, dialquilamino y trialquilamonio, cada uno de los cuales se pueden sustituir opcionalmente, y en donde dos o más de R^{1a} o R^{1b} se pueden unir para formar un anillo;

preferiblemente de OH, halógeno, nitro, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, heteroalquilo C₂₋₆, heteroalquenilo C₂₋₆, heteroalquinilo C₂₋₆, arilo C₆, alquiloxi C₁₋₆, alqueniloxi C₂₋₆, alquiniloxi C₂₋₆, heteroalquiloxi C₁₋₆, heteroalqueniloxi C₁₋₆, heteroalquiniloxi C₁₋₆, ariloxi C₆, heteroariloxi, CN, -C(O)OH, -C(O)OC₁₋₆alquilo, -C(O)N(R)C₆arilo, -C(O)N(R)heteroarilo, -N(R)C(O)C₆arilo, -N(R)C(O)heteroarilo, amino, amonio, (C₁₋₆alquil)amino, di(C₁₋₆alquil)amino y tri(C₁₋₆alquil)alquilamonio, cada uno de los cuales puede ser sustituido opcionalmente, y en donde el heteroarilo es un heteroarilo de 5 o 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S;

más preferiblemente de OH, F, Cl, Br, I, nitro, C₁, C₂, C₃ o C₄alcoxi, C₁, C₂, C₃ o C₄haloalcoxi, C₆ariloxi, CN, -C(O)OH, -C(O)OC₁alquilo, -C(O)OC₂alquilo, -C(O)OC₃alquilo, -C(O)N(R)arilo, -C(O)N(R)haloarilo, -C(O)N(R)(tri(C₁₋₃alquil)amonio)arilo, -C(O)N(R)C₅heteroarilo,

-C(O)N(R)C₅(halo)heteroarilo, -N(R)C(O)arilo, -N(R)C(O)haloarilo, -N(R)C(O)C₅heteroarilo, -N(R)C(O)C₅(halo)heteroarilo, -N(R)C(O)(tri(C₁₋₃alquil)amonio)C₅heteroarilo y (C₁₋₃alquil)₃N⁺, cada uno de los cuales puede estar sustituido opcionalmente;

lo más preferiblemente de OH, F, ¹⁸F, Cl, nitro, CH₃O-, EtO-, *n*-PrO-, *i*-PrO-, CyPrO-, CF₃O-, -C(O)OH, -C(O)OCH₃, PhO-, [¹⁸F]fluoropiridinilcarbonilamino, [¹⁸F]fluoropiridinilaminocarbonilo y Me₃N⁺;

R² se selecciona independientemente de -C(O)(CR(R))_{r₁}N((CR(R))_{r₂}R^{2a})(CR(R))_{r₃}R^{2b}, -C(O)R, -C(O)(CR(R))_{r₄}R^{2c}, -C(O)R^{2d}(CR(R))_{r₅}R^{2e}, y -C(O)R^{2f}S(O)₂R^{2g};

R³ se selecciona independientemente de C(O)R^{3a}, (CR(R))_{r₆}C(O)R^{3a}, C(O)N(R)R^{3b}, C(O)R^{3c}, C(O)N(R)R^{3d}, C(O)NR^{3e}R^{3f} y NR^{3e}R^{3f}; y

cada uno de los r₁, r₂ y r₃ se selecciona independientemente de 0, 1, 2 y 3; preferiblemente de 0, 1 y 2; más preferiblemente 0 o 1; lo más preferiblemente 1;

cada uno de los r₄, r₅ y r₆ se selecciona independientemente de 0, 1, 2 y 3; preferiblemente de 0, 1 y 2; más preferiblemente 0 o 1; lo más preferiblemente 0;

Cada uno de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e} y R^{3f} se selecciona independientemente de arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, alquilo y heteroalquilo;

preferiblemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, (arilo de 6 a 10 miembros)alquiloC₁₋₃, (heteroarilo de 5 a 10 miembros)alquiloC₁₋₃, alquilo C₁₋₁₀ y heteroalquilo C₁₋₁₀;

más preferiblemente de arilo de 6 o 10 miembros, y heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, alquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico, y heteroalquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico;

lo más preferiblemente en donde:

R^{2a} y R^{2b} son cada uno independientemente fenilo;

R^{2c} se selecciona independientemente de fenilo, benzo[*b*]tiofen-3-ilo, 3,4-dihidro-2H-benzo[*b*][1,4]oxazina-2-ilo, 2,3-dihidro-4H-benzo[*b*][1,4]oxazina-4-ilo y pirimidina-4-ilo;

R^{2d} es independientemente fenilo;

R^{2e} es independientemente pirrolidin-1-ilo;

R^{2f} es independientemente fenilo;

R^{2g} es independientemente pirrolidin-2-ilo;

R^{3a} es independientemente fenilo, quinolin-4-ilo o isopentilo;

R^{3b} es independientemente fenilo;

R^{3c} es independientemente metilo;

R^{3d} es independientemente metilo;

NR^{3e}R^{3f} se selecciona independientemente de morfolina-4-ilo, (3-aminooxetan-3-il)metilamino, (tiazol-2-il)metilamino, octahidrociclopenta[*c*]pirrol-2-ilo, (3-fenil)oxetan-3-il)amino, 2,3-dihidrobenzo[*f*][1,4]oxazepin-4(5*H*)-ilo, ((4*H*-1,2,4-triazol-3-il)metil)amino y biciclo[1.1.1]pentan-1-ilamino;

en donde dos o más de R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e} y R^{3f} pueden unirse para formar un anillo;

en donde cada uno de R^{2a} y R^{2b} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados

independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

lo más preferiblemente no sustituido;

en donde R^{2c} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃, CH₃O y CH₃S o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por oxo, Cl o CH₃S o no sustituido;

en donde R^{2d} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, oxo-heterociclilo C₄₋₆alquilo C₁₋₂, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

lo más preferiblemente está no sustituido;

en donde R^{2e} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por oxo;

en donde R^{2f} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por OH;

en donde R^{3a} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅, (alquilo C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, (alquenil C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos de Cl, F, CH₃, F y CH₃, CF₃, CH₃O, PhO, tetrazolilo y alilNH₂SO₂⁻ o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por F, por Cl, por Cl y F, por 1*H*-tetrazol-5-ilo, por

aliNHSO₂⁻ o no sustituido;

en donde R^{3b} está opcionalmente sustituido,

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅, y (alquilo C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, (alquenil C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos de F, Cl, CH₃, tetrazolilo y aliNHSO₂⁻, o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por F, por F y CH₃, por CH₃ y CH₃, por Cl, por Cl y F, por (1*H*-tetrazol-5-ilo), por aliNHSO₂⁻, o no sustituido;

en donde R^{3c} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

lo más preferiblemente no sustituido;

en donde R^{3d} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

lo más preferiblemente no sustituido;

NR^{3e}R^{3f} está opcionalmente sustituido;

preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, amino, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, arilo C₆₋₁₀, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ opcionalmente sustituido o no sustituido;

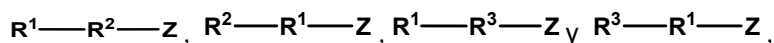
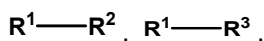
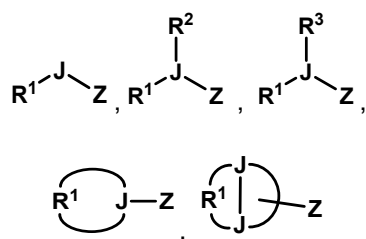
más preferiblemente sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, NH₂, NHBoc, fenilo, metilfenilo, benzo, metilbenzo, alquilo C₁, alquilo C₂, alquilo C₃, alquilo C₄, CF₃ o no sustituido;

lo más preferiblemente sustituido por NH₂, NHBoc, (4-metil)fenilo, (4-cloro)fenilo, (4-fluoro-3-metil)fenilo, metilbenzo, CH₃, CH₃(CH₂)₃ o CF₃;

en donde cada R se selecciona independientemente de H, OH, halógeno, alquilo opcionalmente sustituido o alquiloxi opcionalmente sustituido; preferiblemente H, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido y alquiloxi C₁₋₄ opcionalmente sustituido; más preferiblemente de H, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O; lo más preferiblemente H.

8. El compuesto de la reivindicación 7, en donde el camino más corto que separa los puntos de unión de R¹ y del grupo más cercano seleccionado de R² y R³ tiene una longitud de hasta 20 enlaces;

9. El compuesto de la reivindicación 7 u 8, que tiene una estructura representada por una de las siguientes fórmulas:



10. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, en donde la estructura del compuesto comprende al menos un grupo representado independientemente por la siguiente estructura:



Y se selecciona independientemente de:

- $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1\text{Cyc}^2(\text{R}^2)\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{R}^A\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})(\text{NR}(\text{R}^3))(\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))_{n_2}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))\text{b}'\text{C}(\text{R})(\text{NR}(\text{R}^2))\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))\text{n}^4\text{C}(\text{R})(\text{CR}(\text{R}))\text{n}^3\text{NR}(\text{R}^2))\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))_{n_2}-$, $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))_{n_2}\text{C}(\text{O})-$, $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))_{n_2}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1\text{Cyc}^2(\text{C}(\text{O})\text{R}^2)\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{CR}(\text{R}))\text{a}'\text{N}(\text{R}^2)\text{CR}(\text{R})\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{C}(\text{R})_2)_{1-3}\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{R}^2)\text{C}(\text{R})_2\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1(\text{C}(\text{R})_2)_{1-3}\text{NR}(\text{C}(\text{O})\text{R}^2)\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{R}^A\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})((\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{R}^3)\text{NR}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}(\text{CR}(\text{R}))_{n_5}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{R}^A\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})((\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{R}^3)\text{NR}-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{R}^A\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})(\text{C}(\text{O})\text{R}^3)(\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{NRC}(\text{O})(\text{CR}(\text{R}))_{n_5}\text{C}(\text{O})-$,
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})(\text{NR}(\text{R}^3))(\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{C}(\text{O})-$ y
 $(\text{CR}(\text{R}))_{n_1}\text{Cyc}^1\text{Cyc}^3(\text{CR}(\text{R}))_{n_3}\text{C}(\text{R})((\text{CR}(\text{R}))_{n_4}\text{R}^3)\text{NR}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}(\text{CR}(\text{R}))_{n_5}(\text{C}(\text{O}))_{0-1}-$;

preferiblemente seleccionado de: $-(CR(R))_{n_1}Cyc^1Cyc^2(R^2)C(O)-$ y $-(CR(R))_{n_1}R^ACyc^3(CR(R))_{n_3}C(R)(NR(R^3))(CR(R))_{n_4}C(O)-$;

más preferiblemente seleccionado de $-(CR(R))_{n_1}Cyc^1Cyc^2(R^2)C(O)-$ y $-(CR(R))_{n_1}R^ACyc^3(CR(R))_{n_3}C(R)(NR(R^3))(CR(R))_{n_4}C(O)-$;

lo más preferiblemente $-(CR(R))_{n_1}Cyc^1Cyc^2(R^2)C(O)-$;

en donde cada uno de Cyc^1 y Cyc^2 se selecciona independientemente de carbociclilo, heterociclilo, alquilo, oxoalquilo, heteroalquilo y oxoheteroalquilo;

preferiblemente en donde Cyc^1 se selecciona independientemente de carbociclilo C_{5-10} y heterociclilo de 5 a 10 miembros, $NRC(O)$ y $C(O)NR$; más preferiblemente arilo C_6 , arilo C_{10} , heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, $NHC(O)$ y $C(O)NH$; lo más preferiblemente tetrazolilo o triazolilo.

preferiblemente en donde Cyc^2 se selecciona de heterociclilo de 4 a 6 miembros, $NRC(O)$ y $C(O)NR$; más preferiblemente heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros que comprenda al menos un N; lo más preferiblemente pirrolidinilo;

en donde Cyc^3 se selecciona independientemente de carbociclilo y heterociclilo;

preferiblemente seleccionado independientemente de carbociclilo C_{5-10} , arilo C_{6-10} , heterociclilo de 5 a 10 miembros y heteroarilo de 5 a 10 miembros; más preferiblemente arilo C_6 , arilo C_{10} , heteroarilo de 5 miembros y heteroarilo de 6 miembros; lo más preferiblemente fenilo; en donde R^A se selecciona independientemente de $-C\equiv C-$, $-C(R)_2$, $-C(R)_2C(R)_2-$, $-C(R)_2C(O)-$, $-C(O)C(R)_2-$, $-N=CR-$, $-CR=N-$, $-SC(R)_2-$, $-C(R)_2S-$, $-OC(R)_2-$, $-C(R)_2O-$, $-C(R)_2CR(OH)-$, $-CR(OH)C(R)_2-$, $-NHC(O)-$, $-NRC(O)-$, $-NHC(O)-$, $-NRC(O)-$, carbociclilo C_{5-10} , arilo C_{6-10} , heterociclilo de 5 a 10 miembros y heteroarilo de 5 a 10 miembros; preferiblemente de $-C\equiv C-$, arilo C_6 , arilo C_{10} , heteroarilo de 5 miembros y heteroarilo de 6 miembros; más preferiblemente de $-C\equiv C-$, fenilo y triazolilo; lo más preferiblemente $-C\equiv C-$;

n_1 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 1;

n_2 es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; preferiblemente 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; más preferiblemente 2;

n_3 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 1;

n_4 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 0;

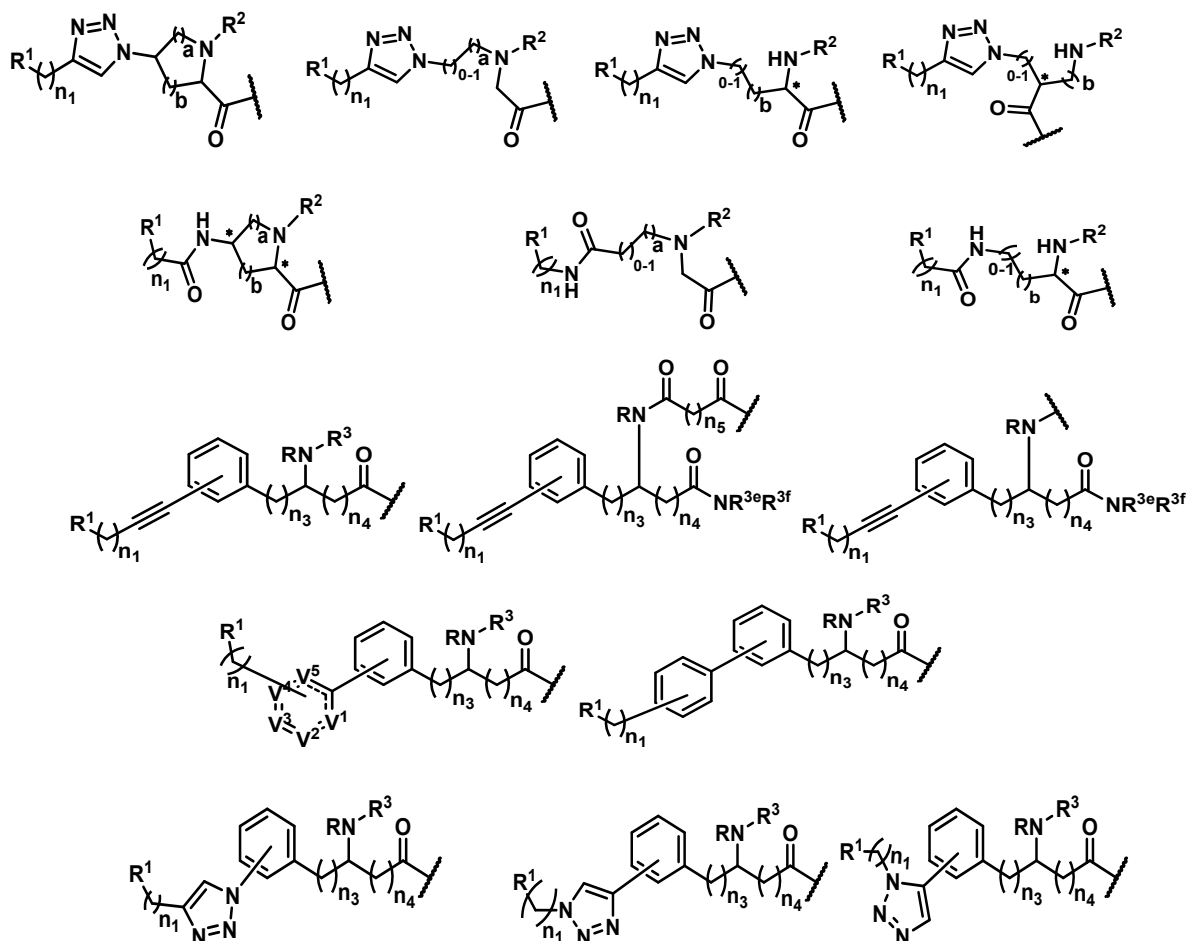
n_5 es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; preferiblemente 0, 1, 2, 3 o 4; más preferiblemente 4;

cada uno de a' y b' es independientemente 1, 2 o 3; preferiblemente 1 o 2; más preferiblemente 1; y

Z representa el punto de unión al resto de la molécula.

11. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 10, en donde R^1 -Y-Z se selecciona independientemente de las siguientes estructuras:





en donde:

n_1 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 1;

n_2 es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; preferiblemente 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; más preferiblemente 2;

n_3 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 1;

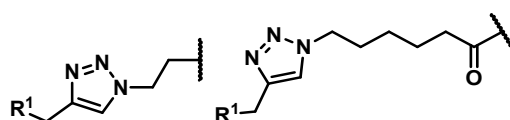
n_4 es independientemente 0, 1 o 2; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 0;

n_5 es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; preferiblemente 0, 1, 2, 3 o 4; más preferiblemente 4;

cada uno de a y b es 0, 1 o 2; preferiblemente con la condición de que $a + b$ sea ≥ 1 y ≤ 3 ; más preferiblemente en donde cada uno de a y b es 1; y

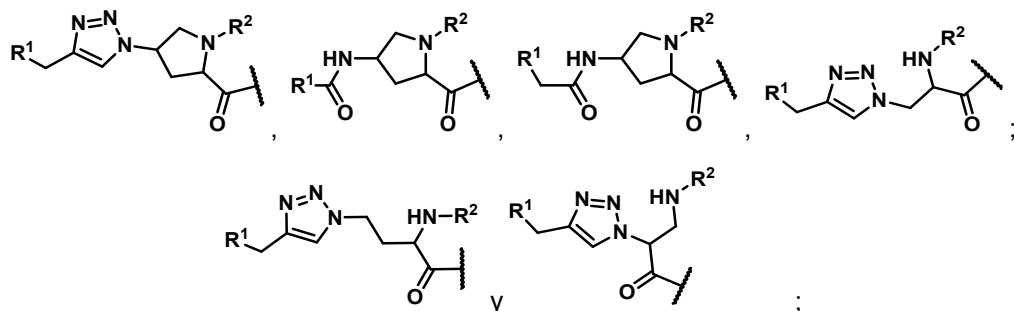
en donde cada uno de V^1 , V^2 , V^3 , V^4 y V^5 se selecciona independientemente de carbono y un heteroátomo; preferiblemente O, S o N, y en donde uno de V^1 , V^2 , V^3 , V^4 y V^5 puede estar ausente.

12. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 11, en donde R^1 -Y-Z está representado independientemente por una de las siguientes estructuras:

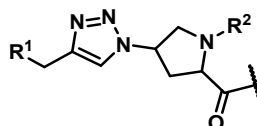


13. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 12, en donde R^1 -Y-Z está representado

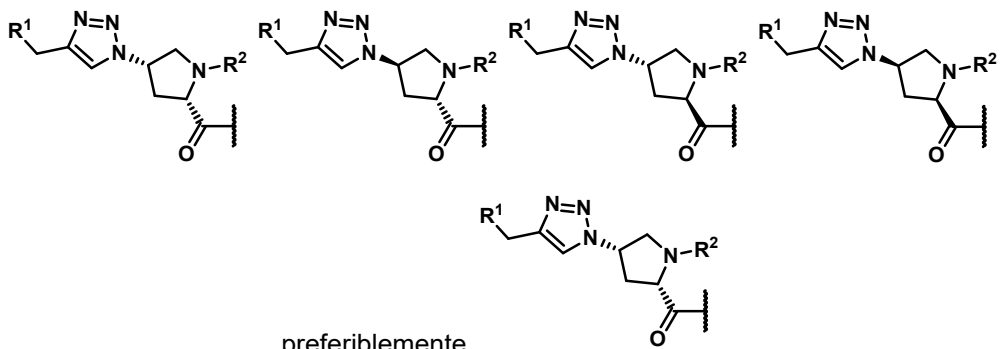
independientemente por la siguiente estructura:



preferiblemente

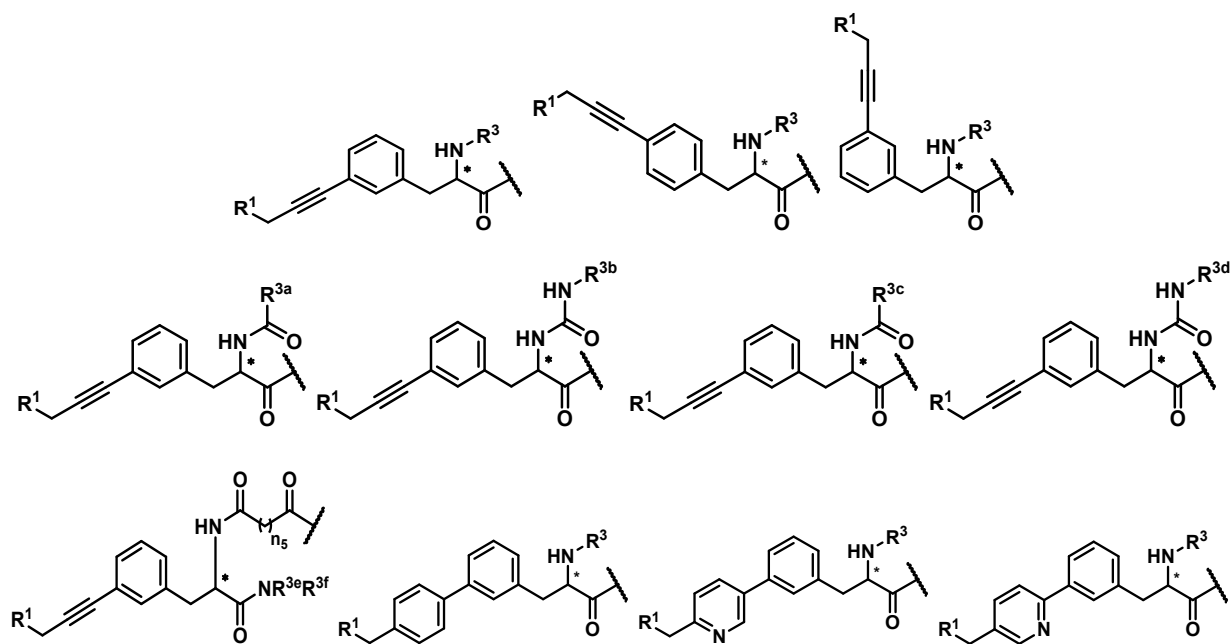


14. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 13, en donde R¹-Y-Z está representado independientemente por cualquiera de las siguientes estructuras:

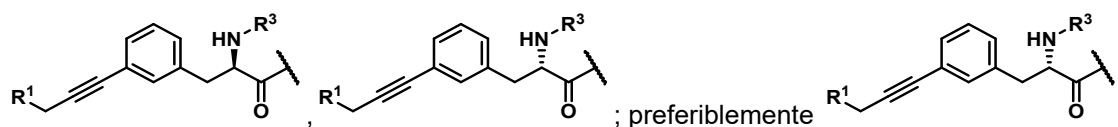


preferiblemente

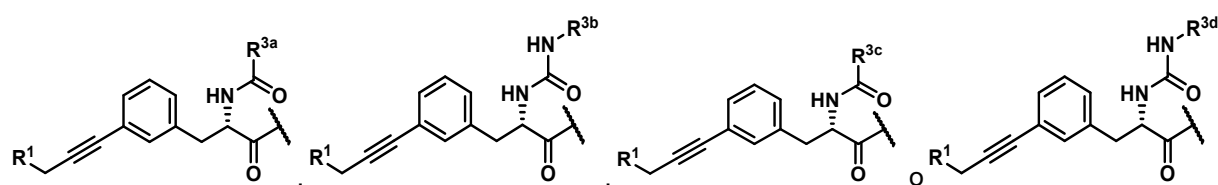
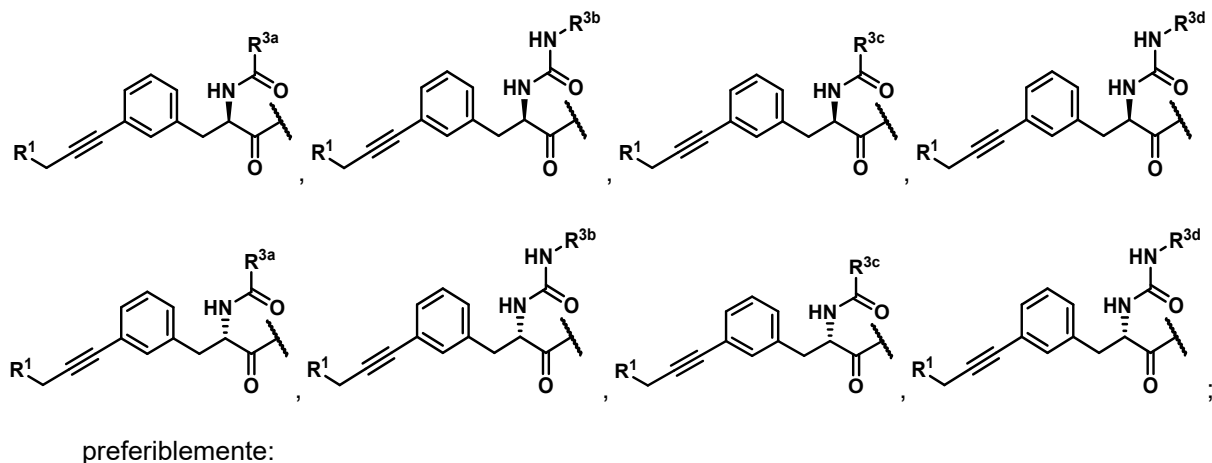
15. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 14, en donde R¹-Y-Z está representado independientemente por las siguientes estructuras:



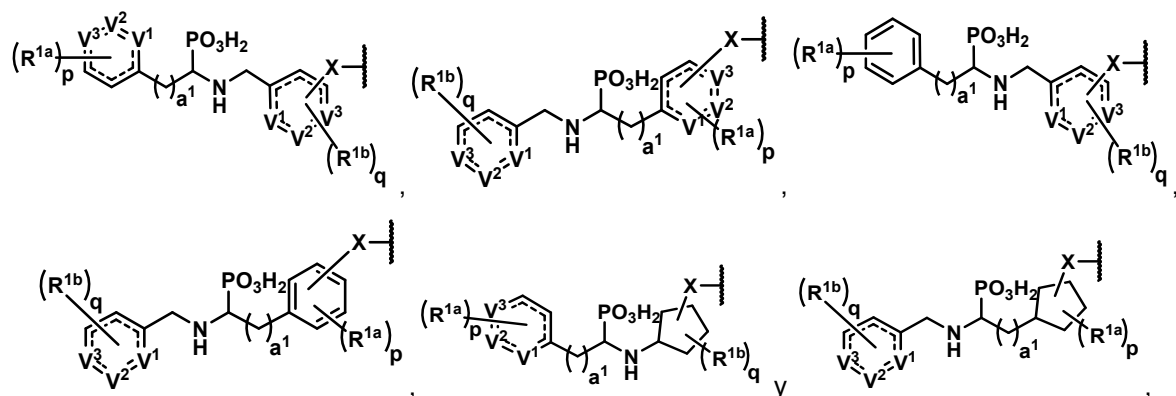
16. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 15, en donde R¹-Y-Z está representado independientemente por cualquiera de las siguientes estructuras:



17. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 16, en donde R¹-Y-Z está representado independientemente por cualquiera de las siguientes estructuras:

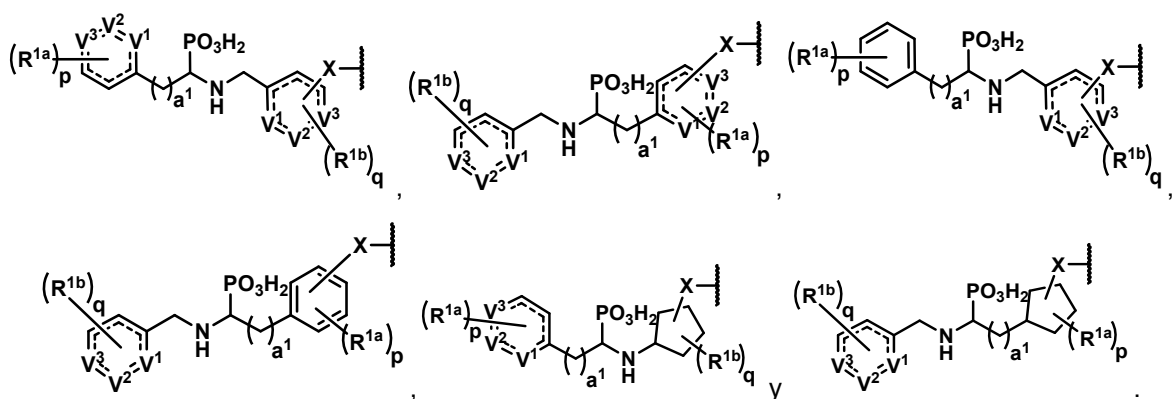


18. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 17, en donde R¹ se selecciona independientemente de:

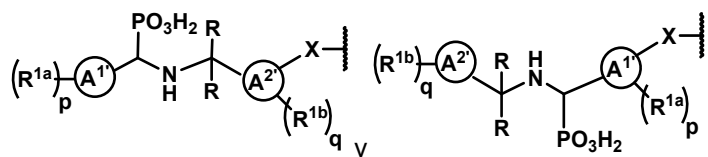


en donde cada uno de V¹, V² y V³ se selecciona independientemente de CH y un heteroátomo; preferiblemente O, S o N; y en donde uno de V¹, V² y V³ puede estar ausente.

19. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 18, en donde R¹ se selecciona independientemente de:

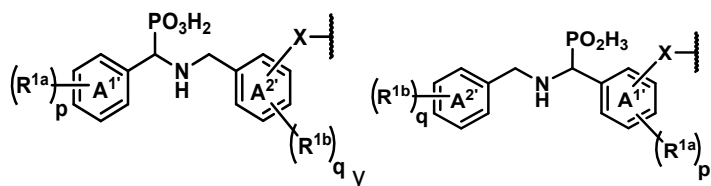


20. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 19, en donde R^1 se selecciona independientemente de:

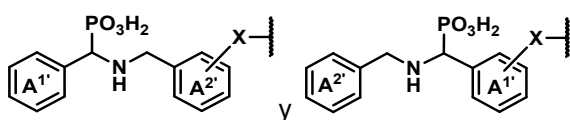


en donde cada A^1 y A^2 representan independientemente arilo; preferiblemente arilo C_{6-10} ; más preferiblemente fenilo o naftilo; lo más preferiblemente fenilo.

21. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 20, en donde R^1 se selecciona independientemente de:



22. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 21, en donde R^1 se selecciona independientemente de:

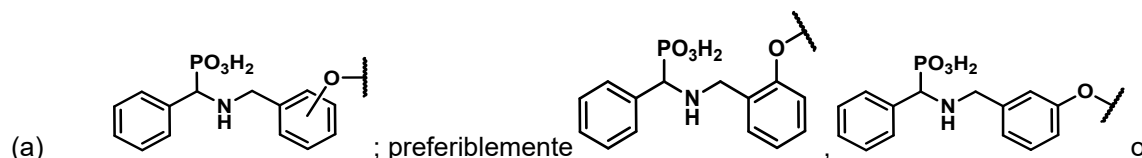


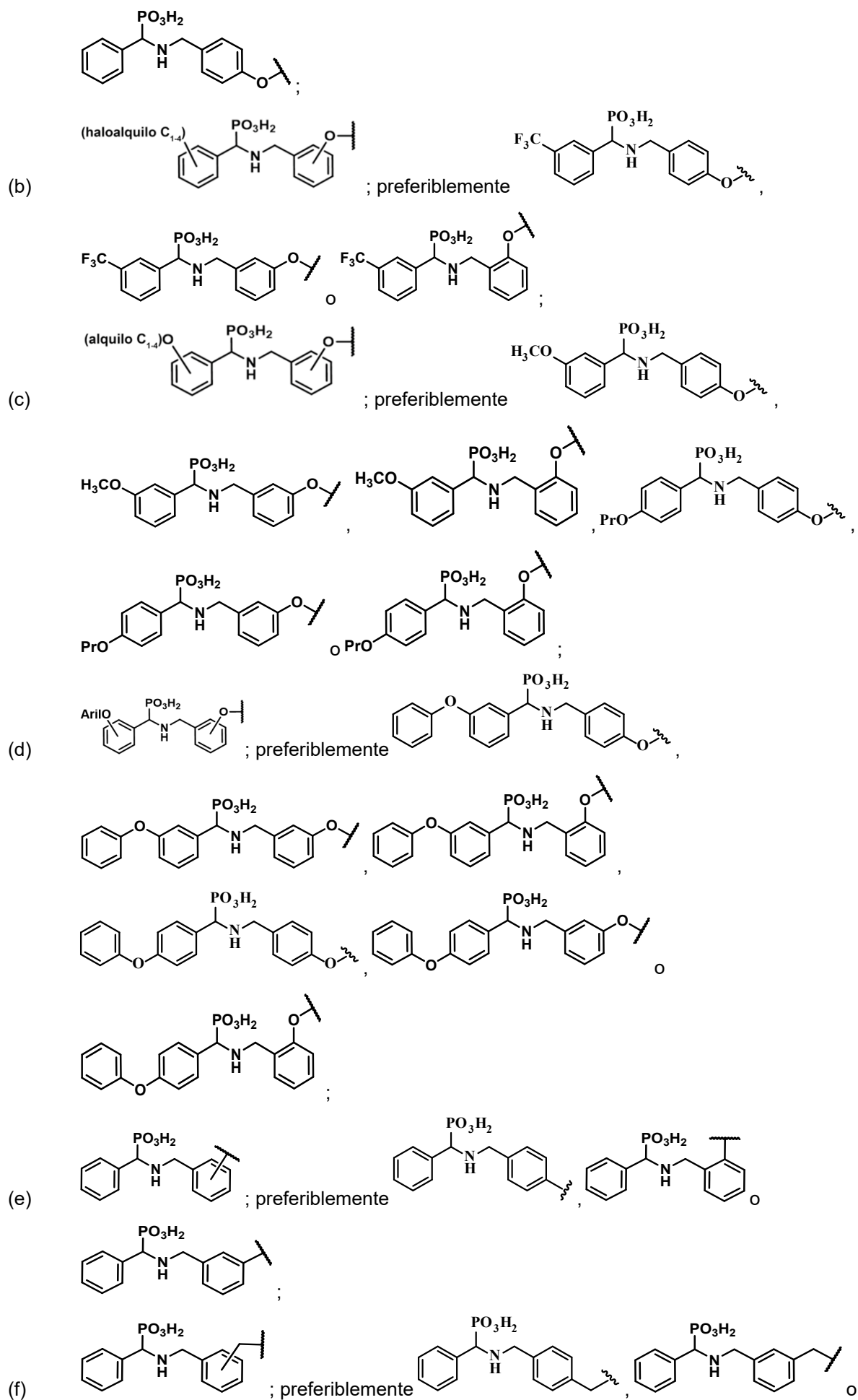
23. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 22, en donde:

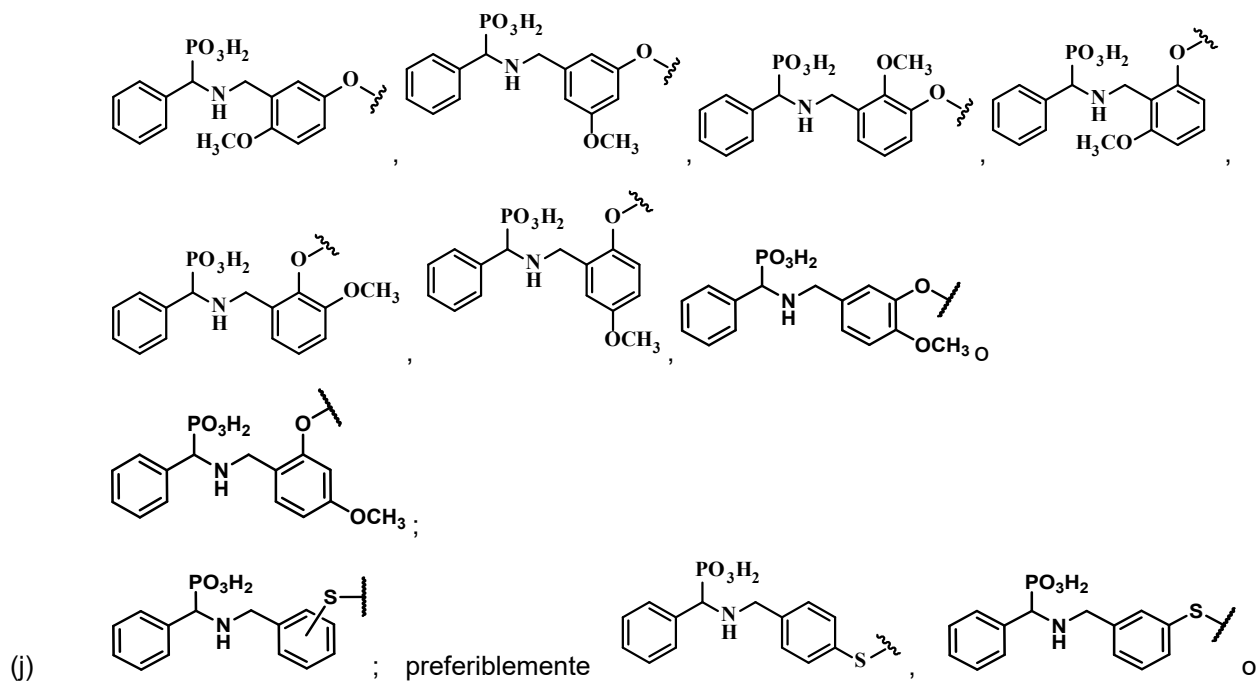
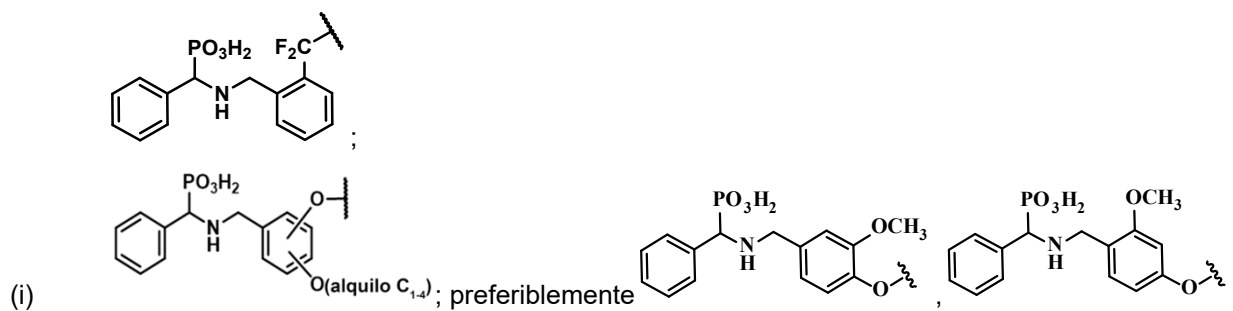
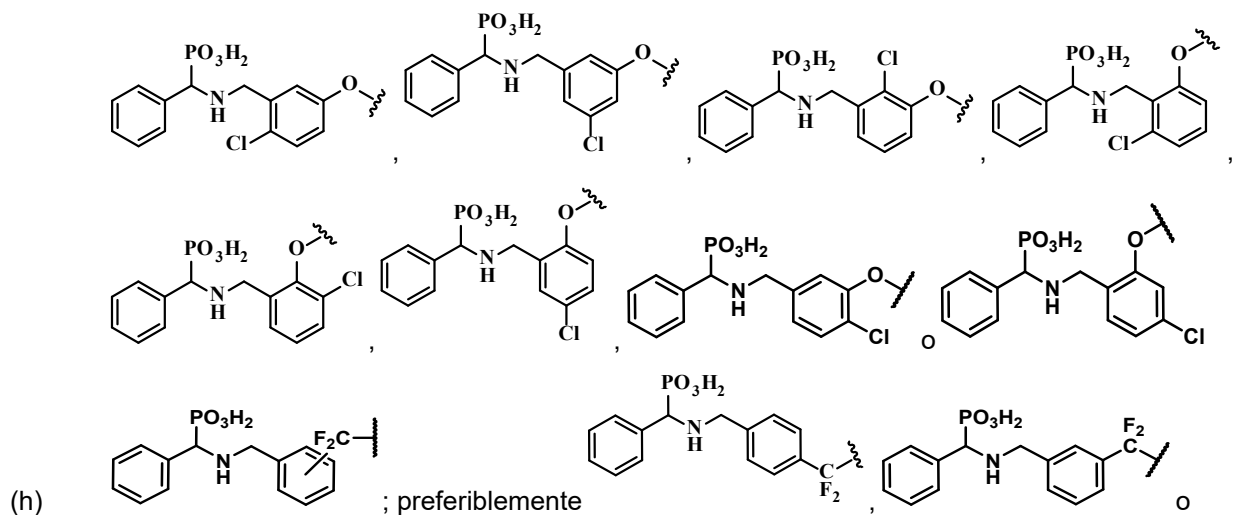
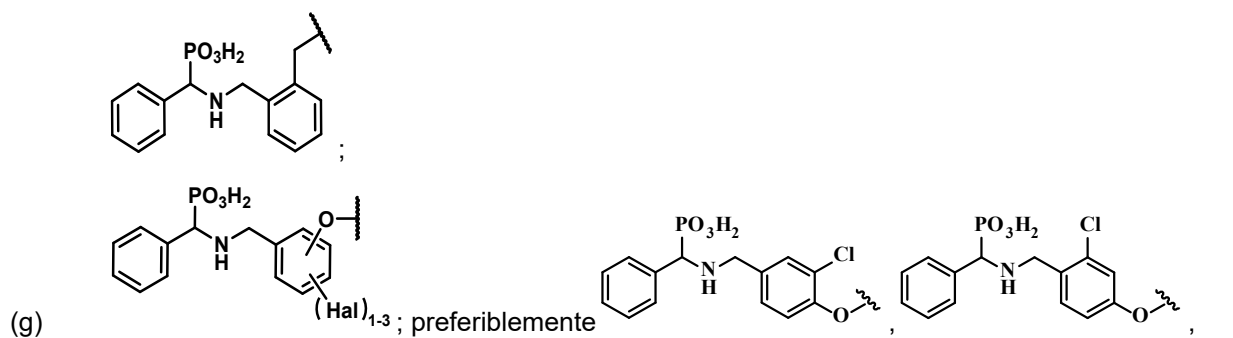
(a) X está unido a A^1 o $A^{1'}$ en una posición 4 o 3 con respecto al punto de unión del grupo $(CR(R))_m$ o $CH(PO_3H_2)$ unido a A^1 o $A^{1'}$; y/o

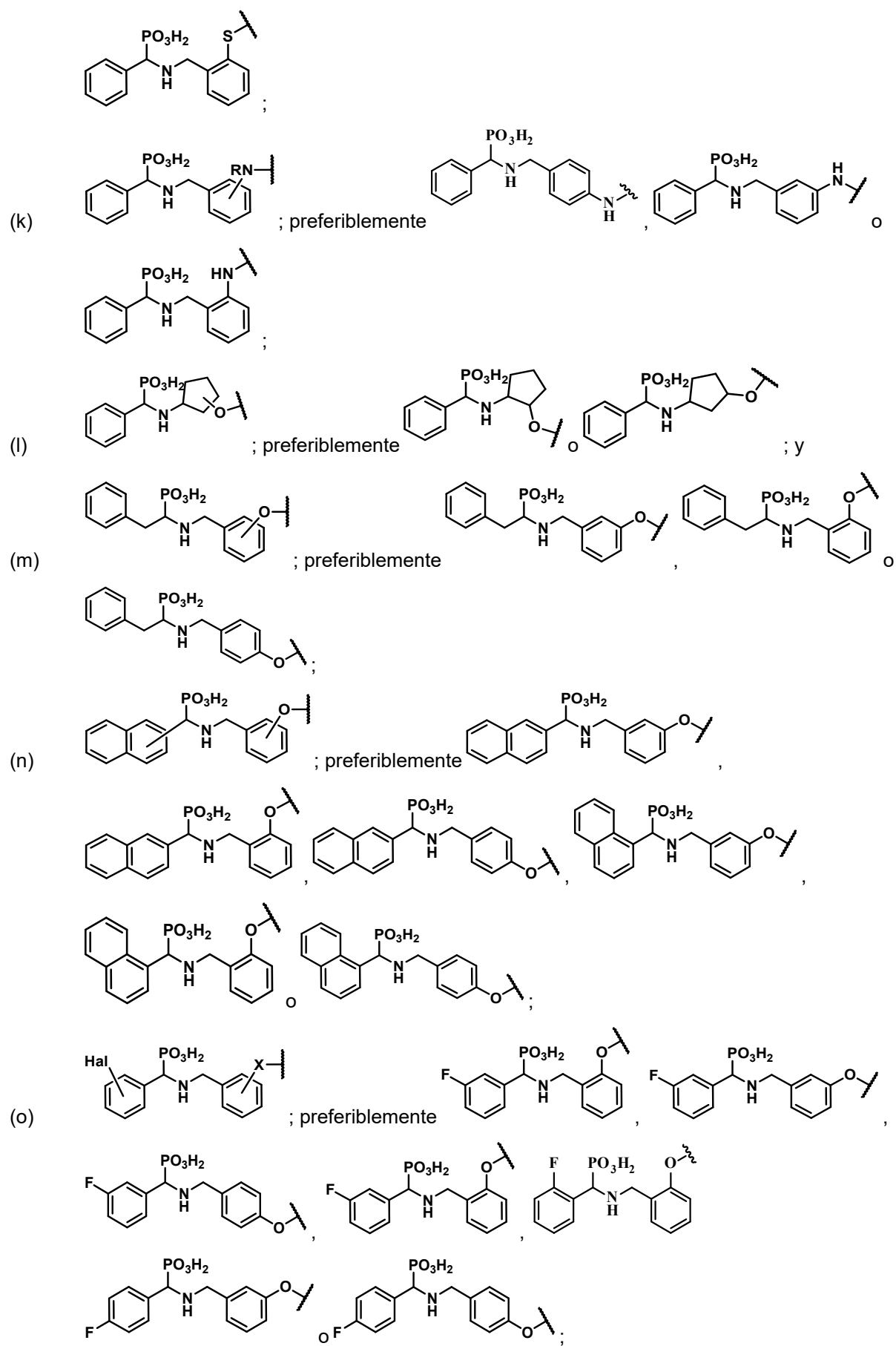
(b) X está unido a A^2 o $A^{2'}$ en una posición 3 con respecto al punto de unión del grupo $(CR(R))_n$ o $CR(R)$ unido a A^2 o $A^{2'}$.

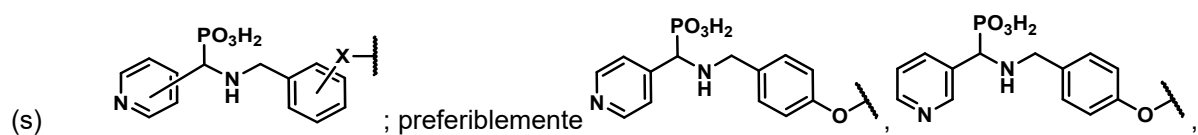
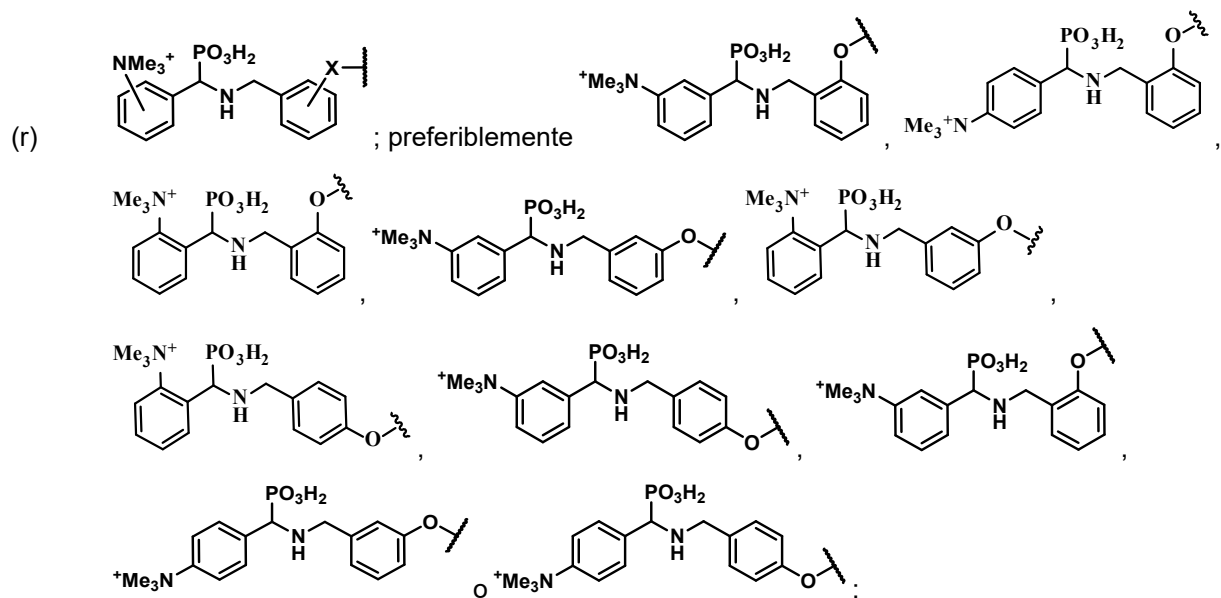
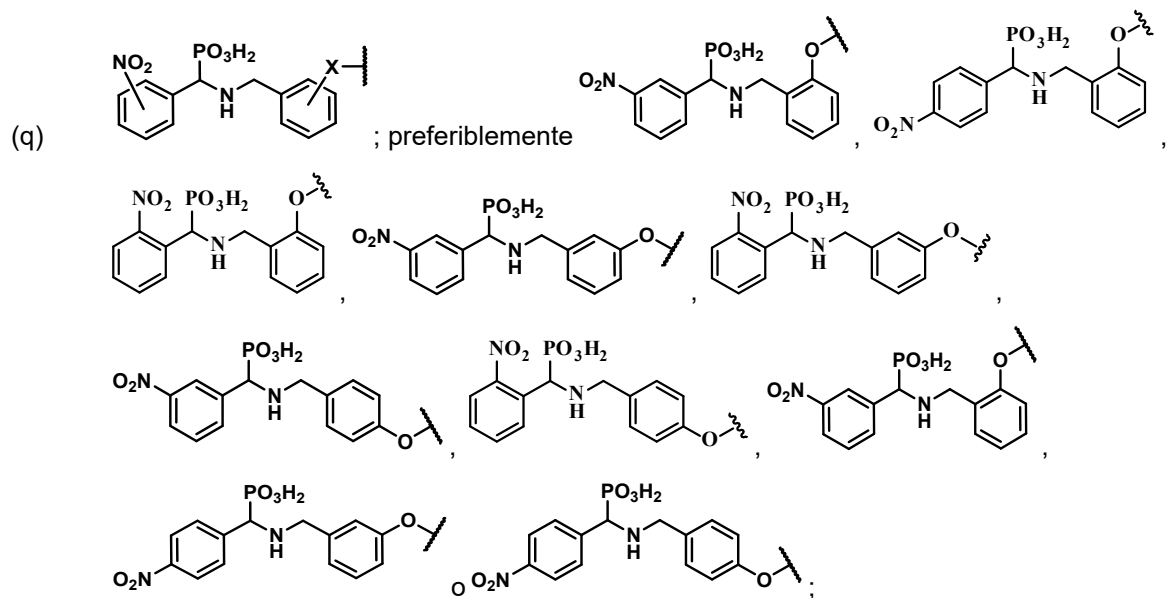
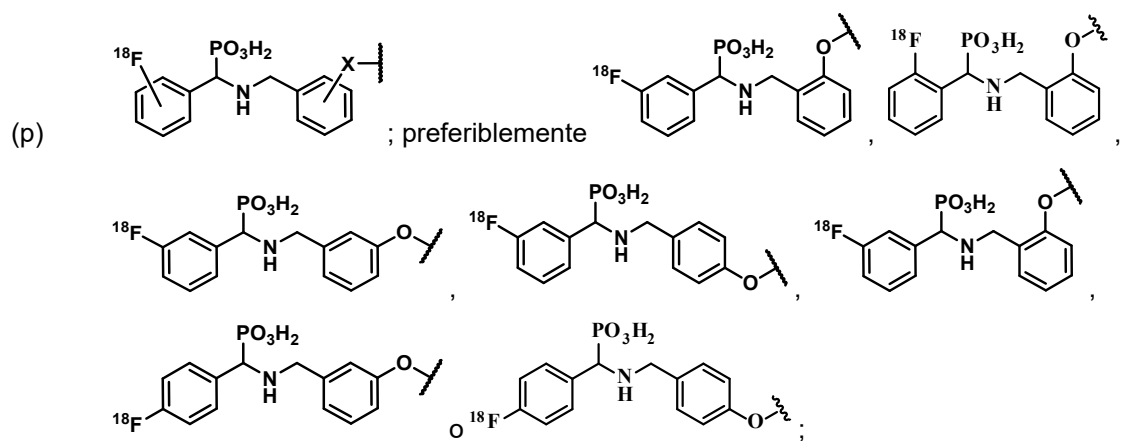
24. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 23, en donde R^1 se selecciona independientemente de:

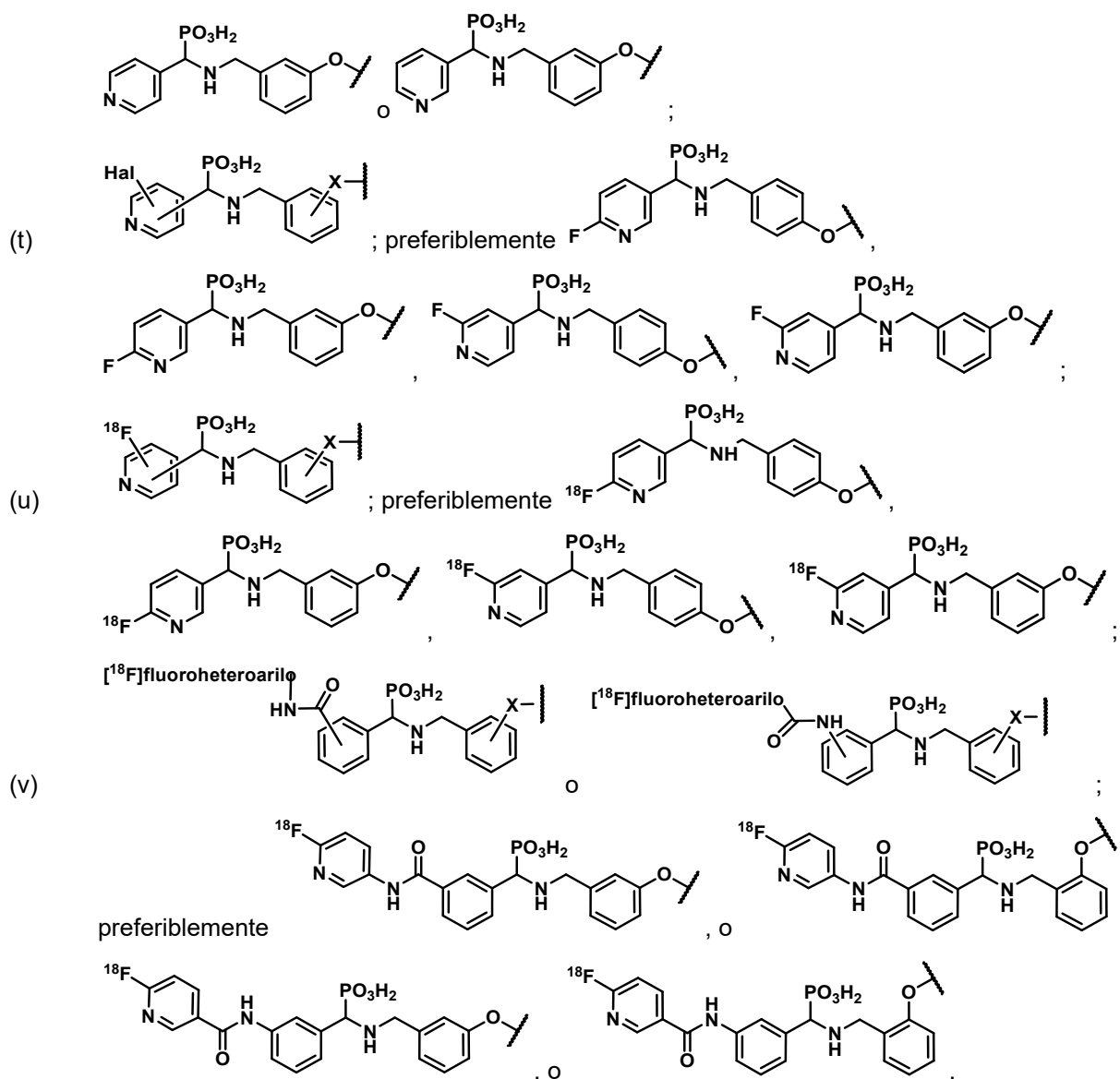




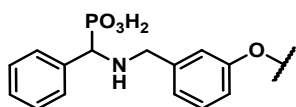




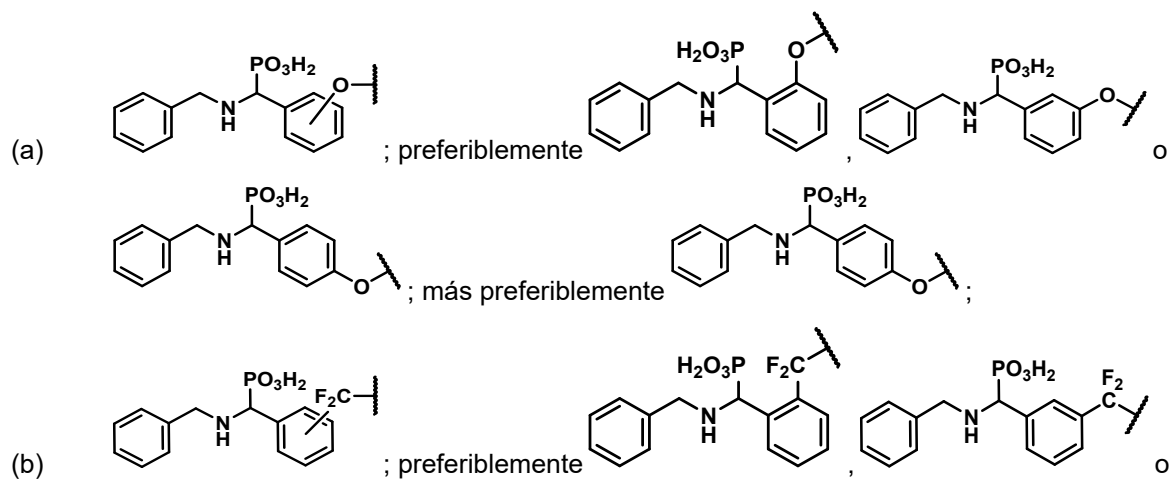


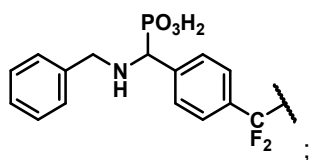


25. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 24, en donde R^1 es

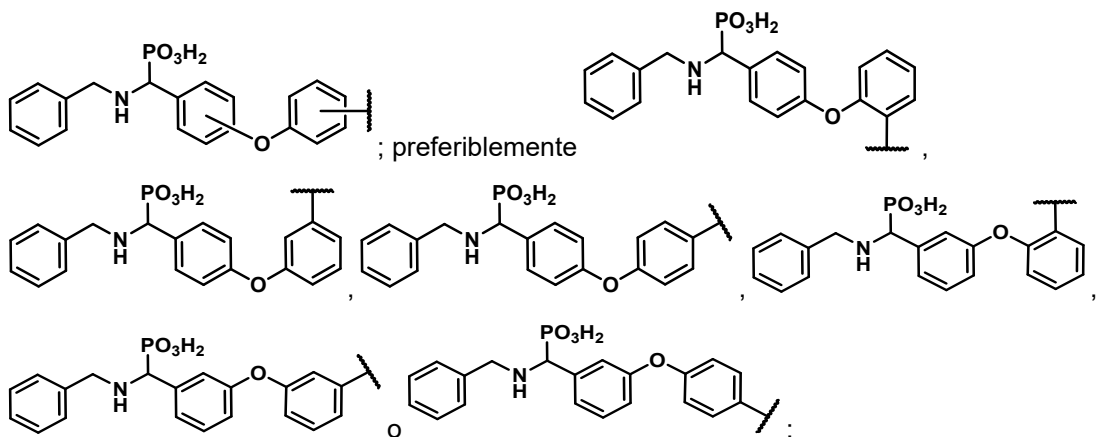


26. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 25, en donde R^1 se selecciona independientemente de:

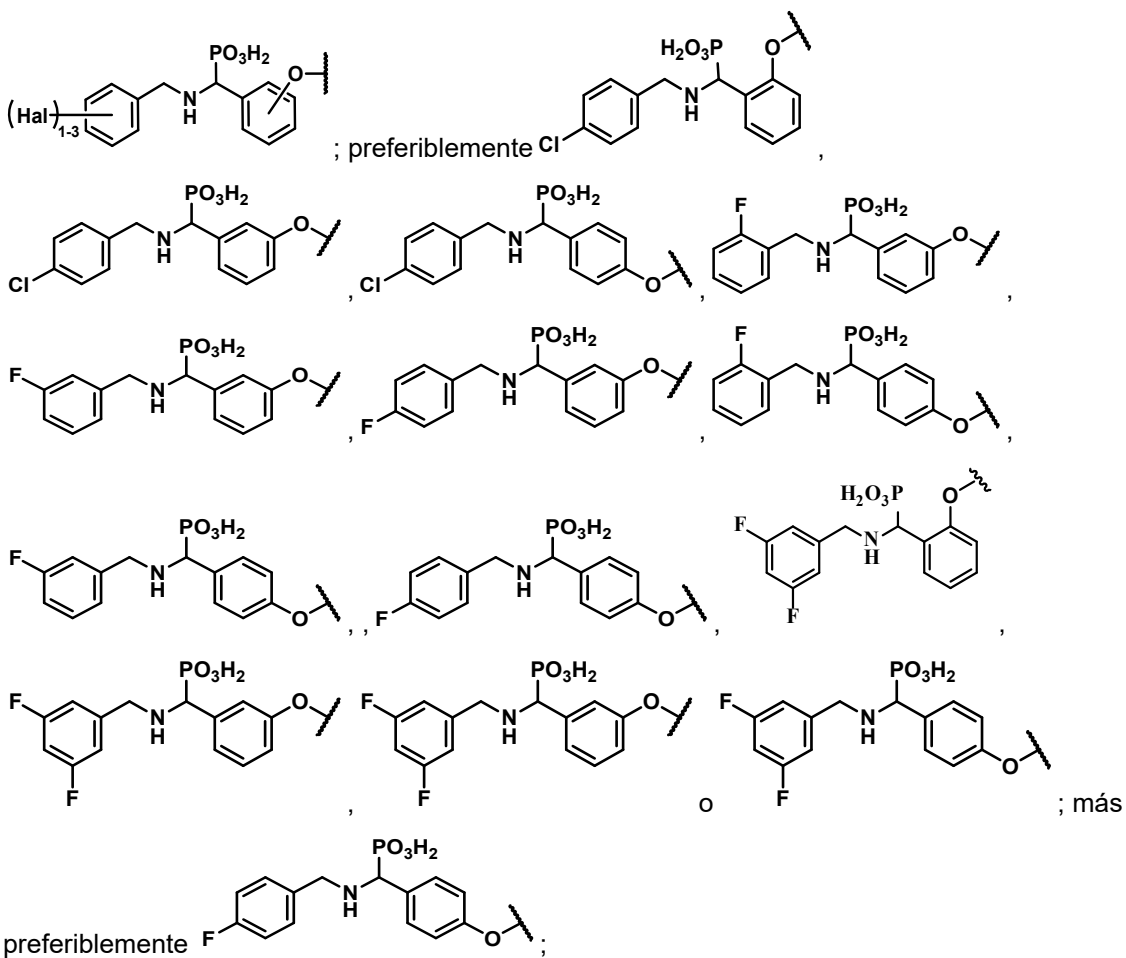




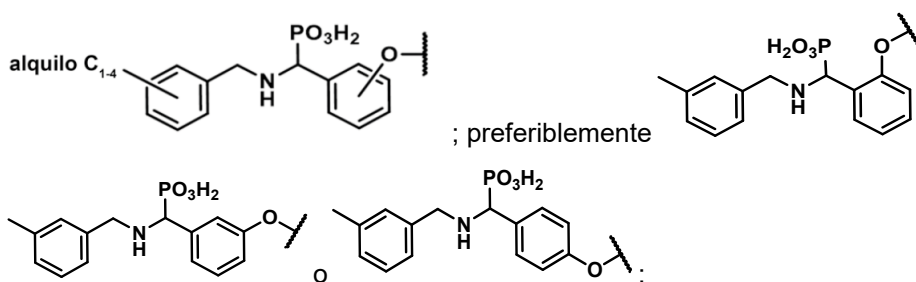
(c)

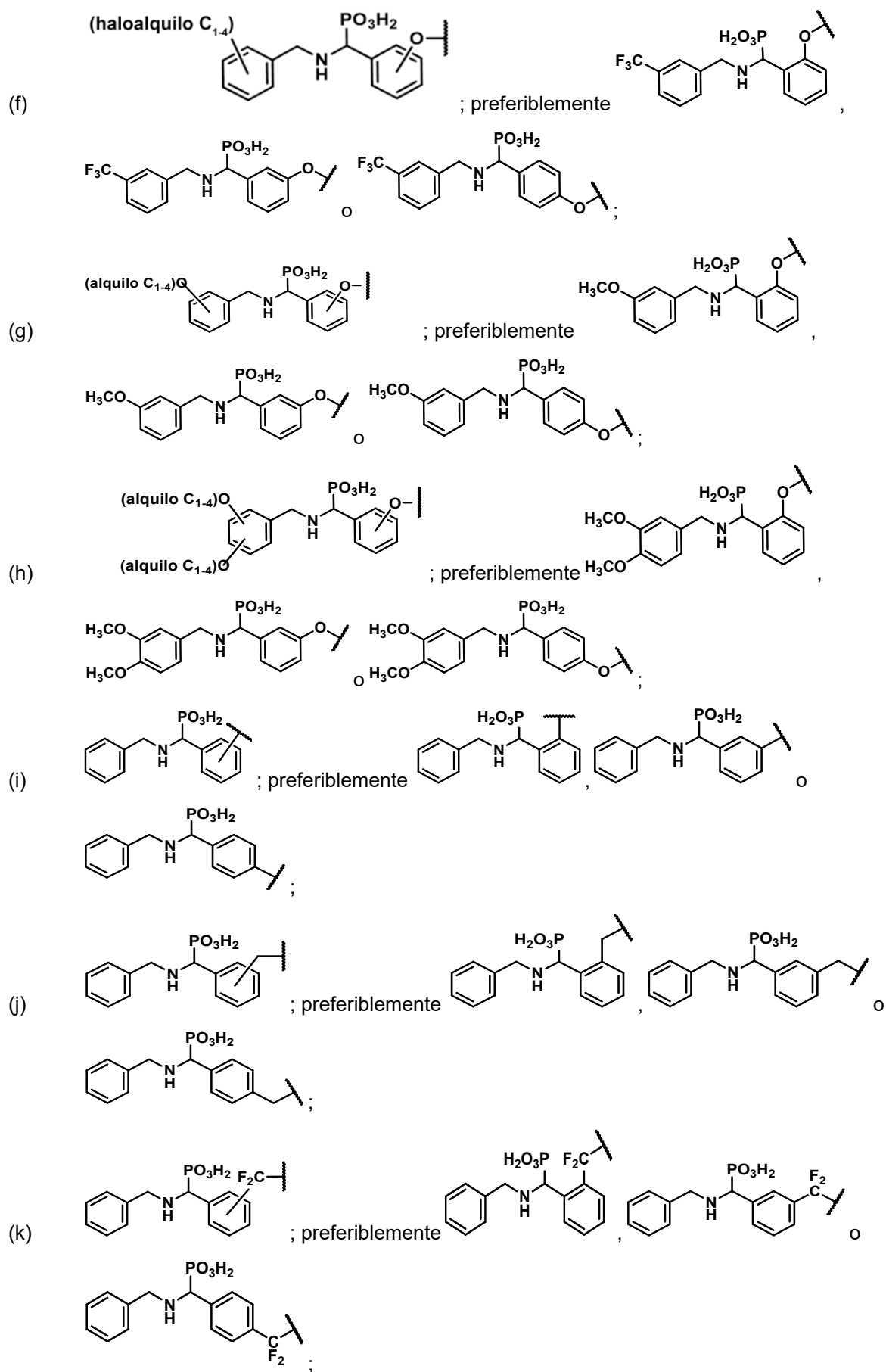


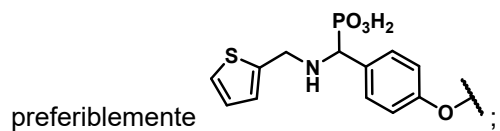
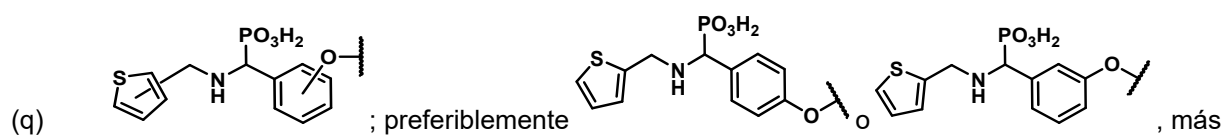
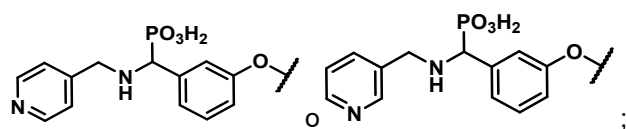
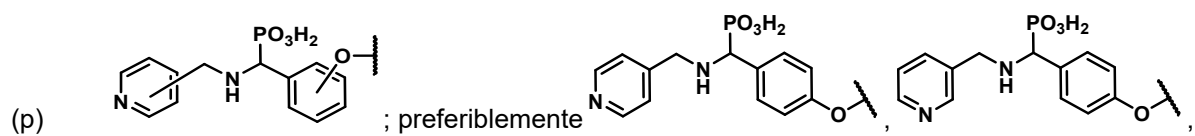
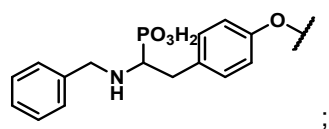
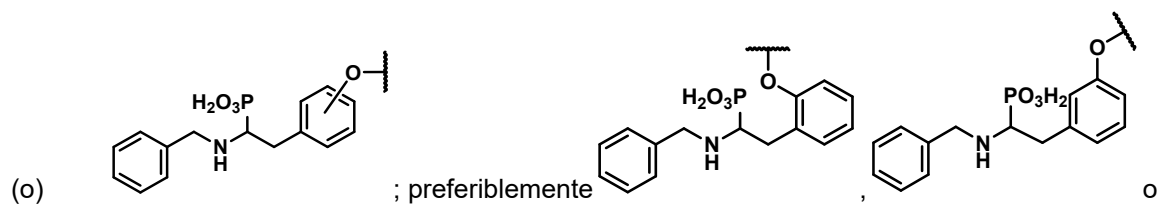
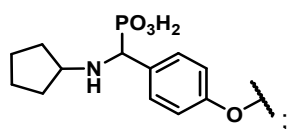
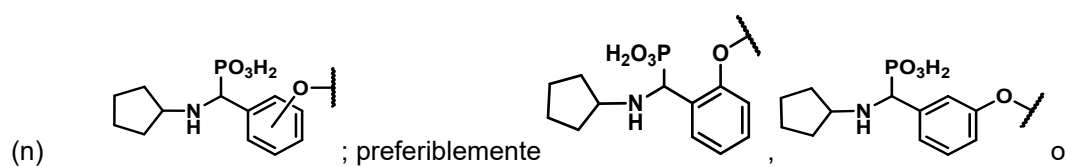
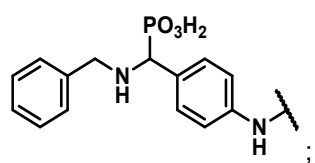
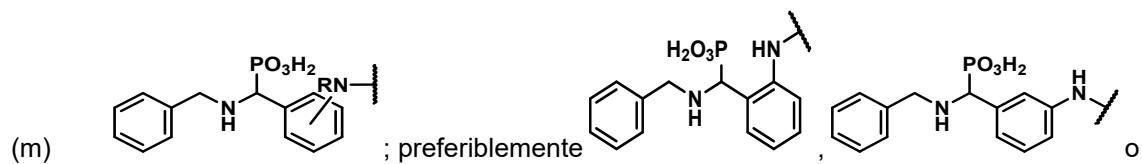
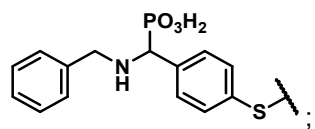
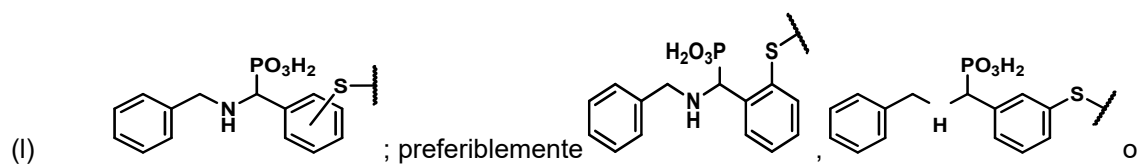
(d)

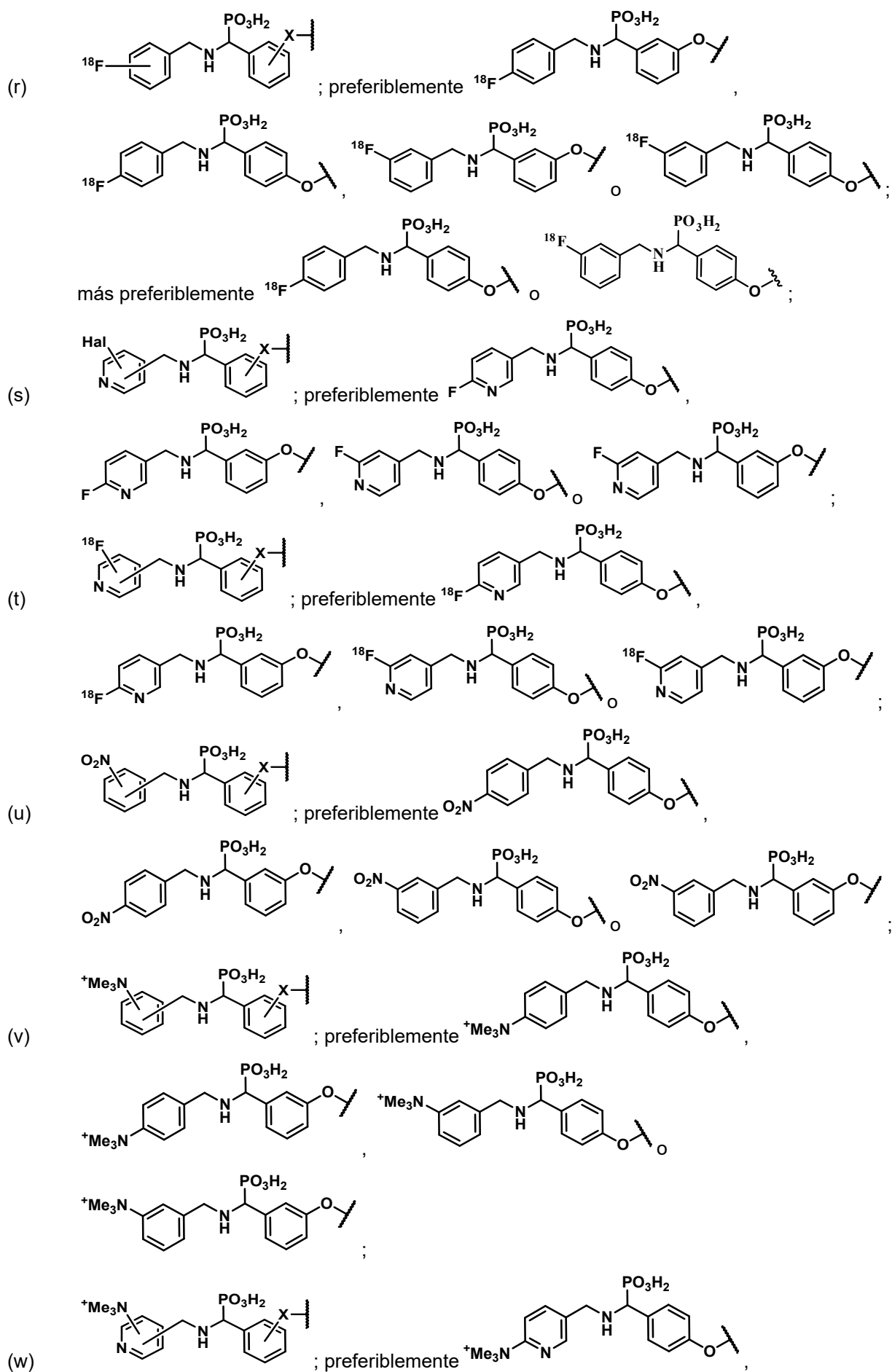


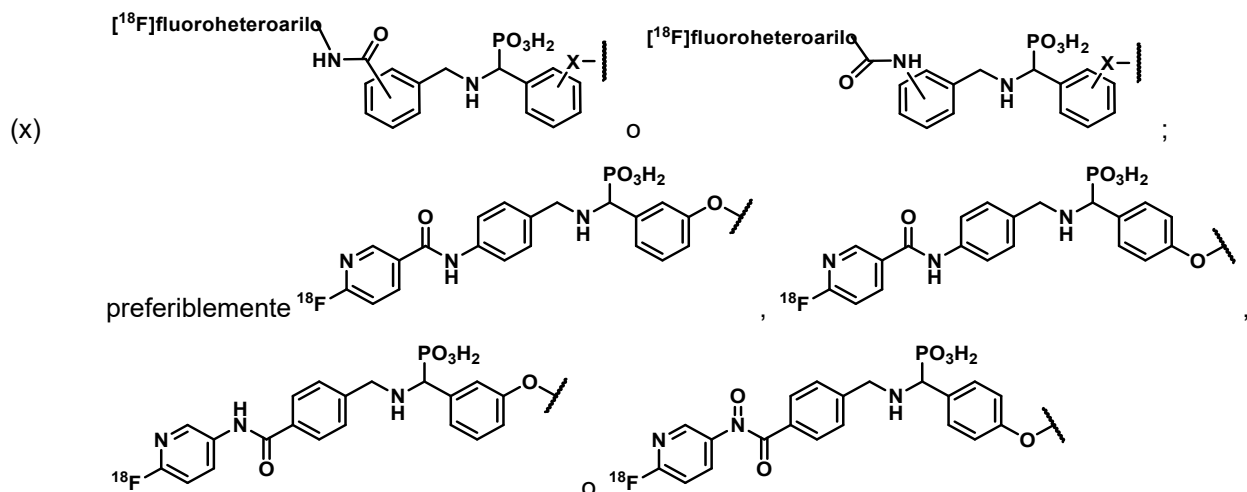
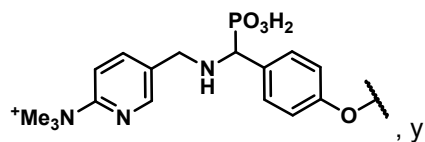
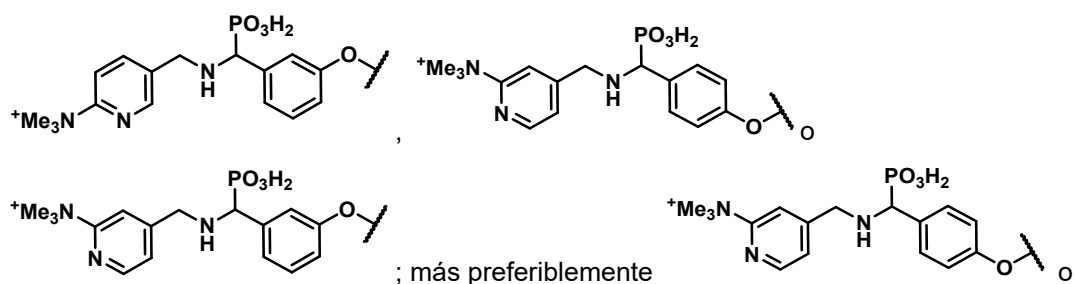
(e)



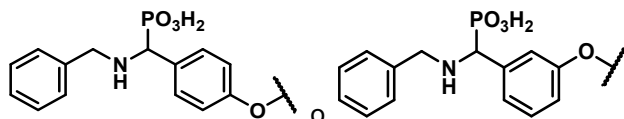




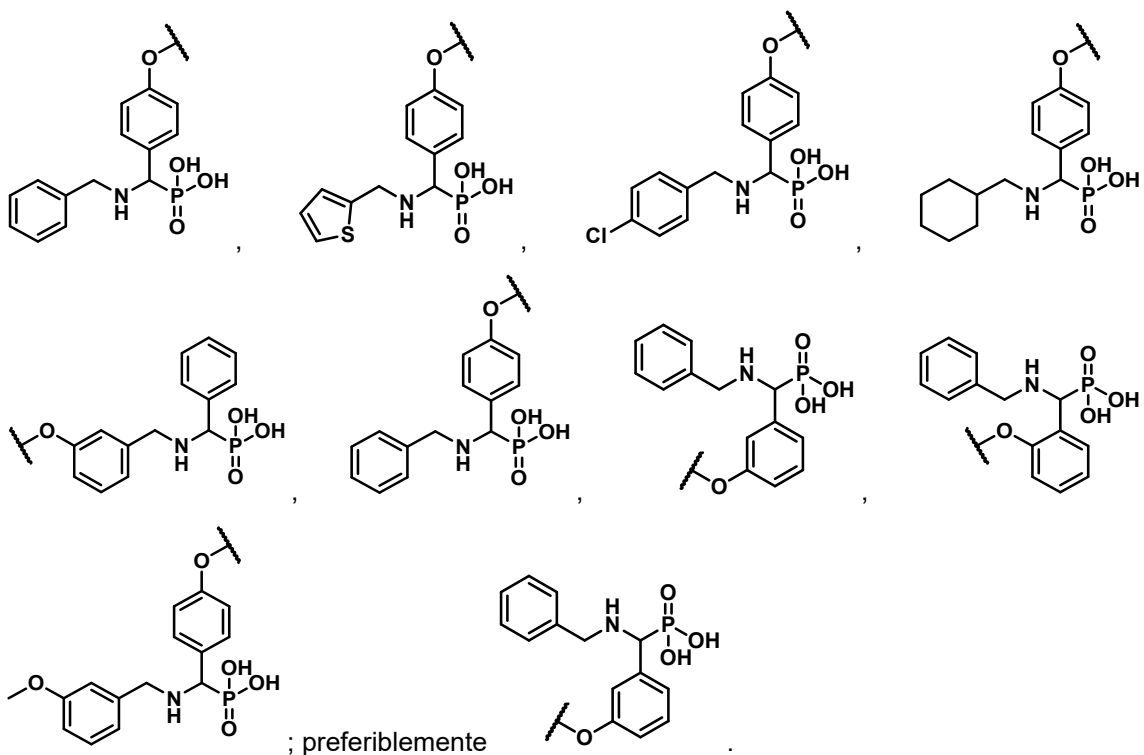




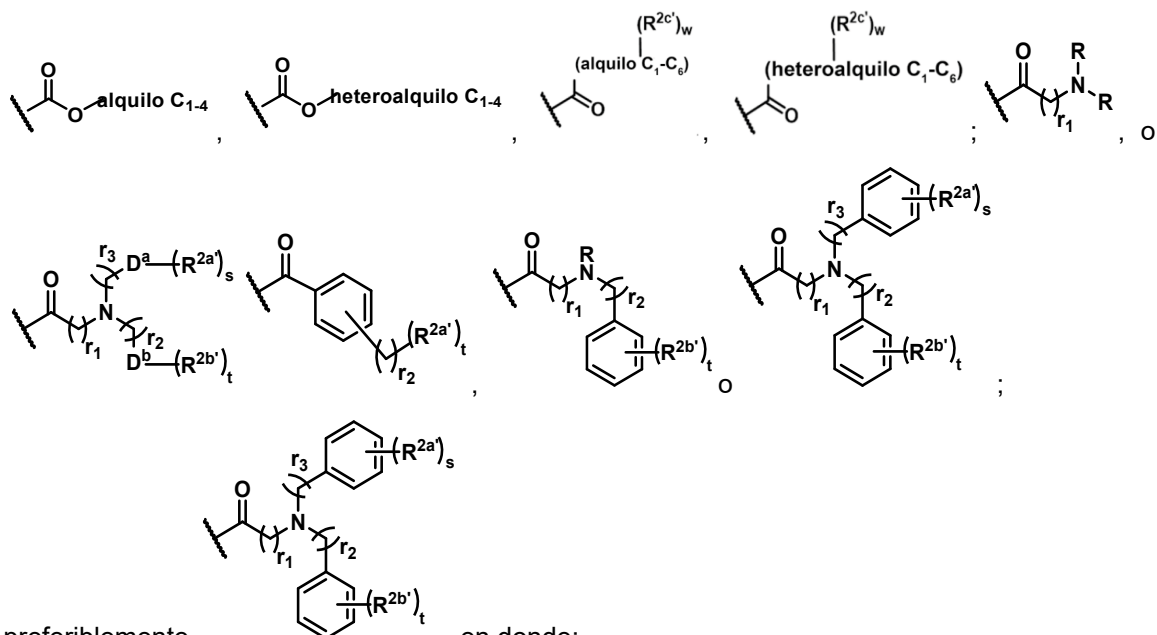
27. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 26, en donde R¹ es



28. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 27, en donde R¹ se selecciona de:



29. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 28, en donde R^2 es representado por:



preferiblement en donde:

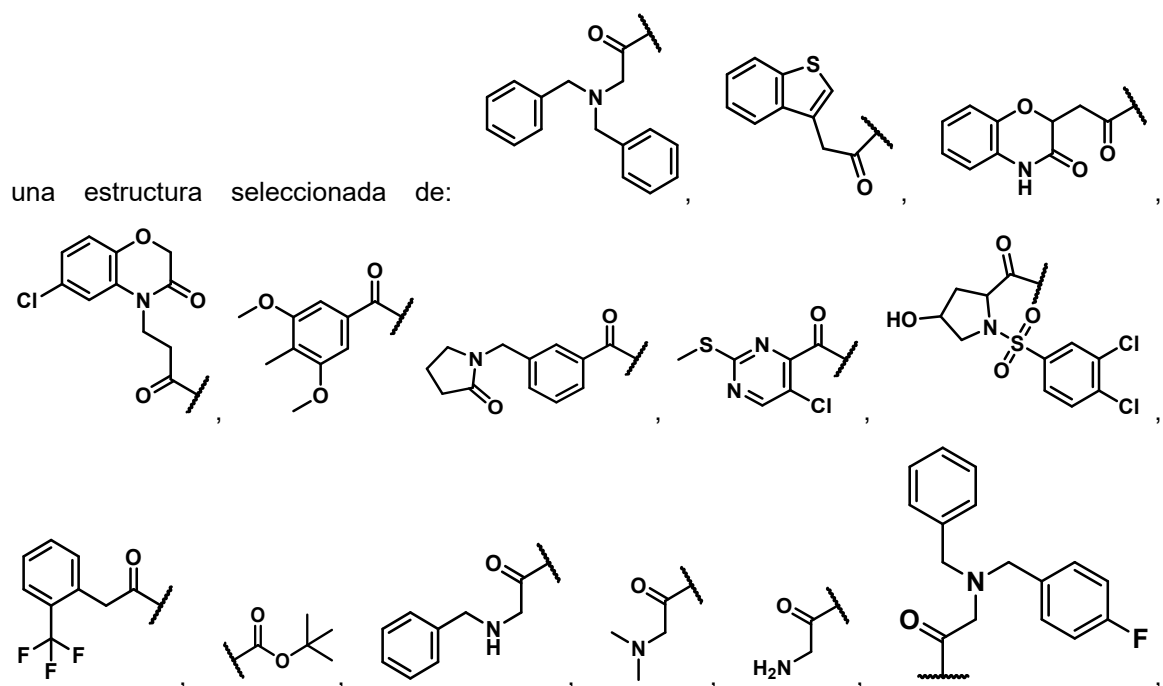
cada uno de R2a', R2b' y R2c' se define independientemente como para R2a;

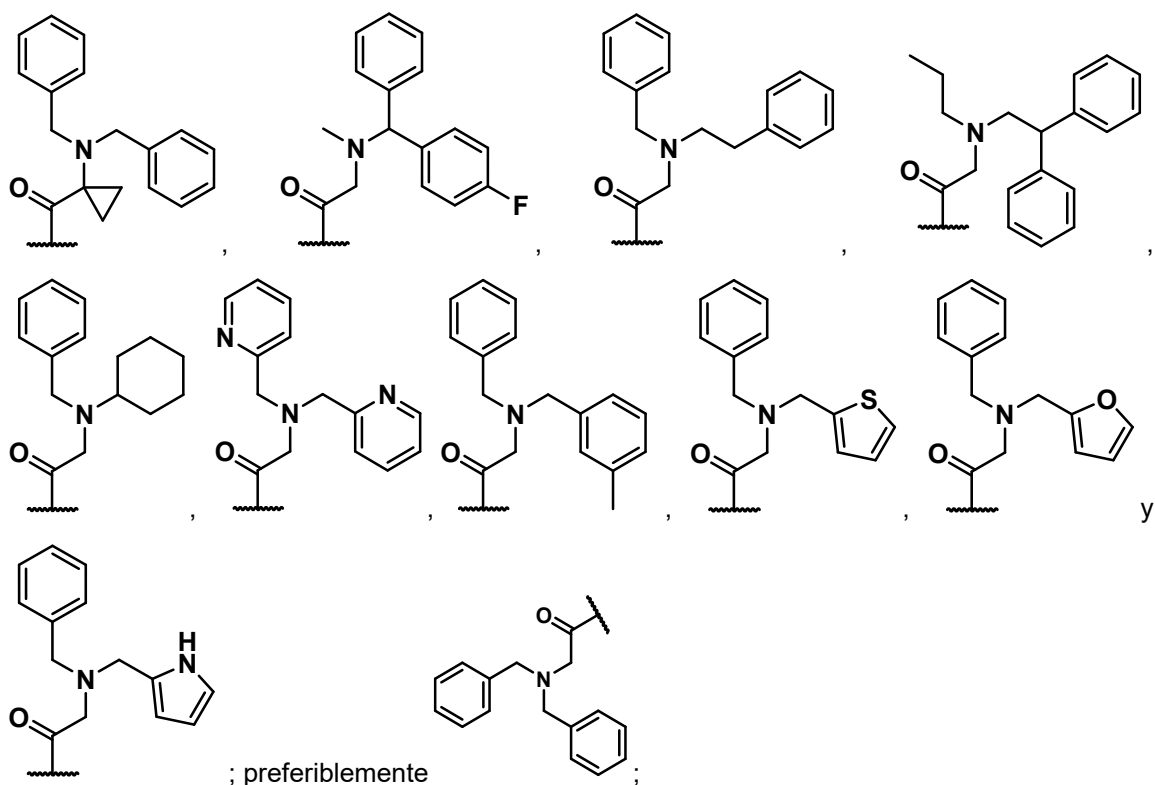
cada uno de D^a y D^b se selecciona independientemente de un arilo de 6 miembros y un heteroarilo de 5 o 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, preferiblemente de pirrol, furano, tiofeno, fenilo, tiazolilo y piridinilo;

cada uno de s y t es independientemente 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 0; y

Cada uno de los r_1 , r_2 y r_3 se selecciona independientemente de 0, 1, 2 y 3; preferiblemente de 1 y 2; más preferiblemente 1.

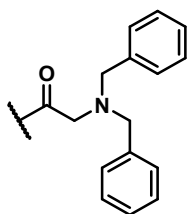
30. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 29, en donde R^2 está representado por



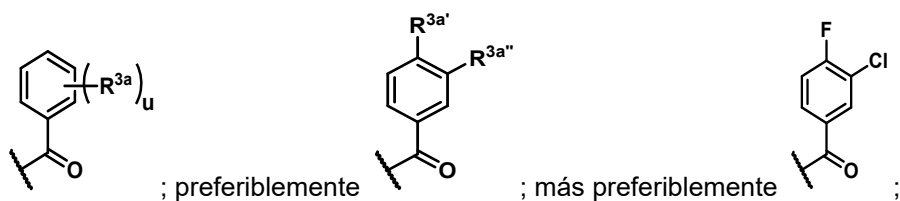


opcionalmente, en donde al menos un átomo de la estructura es un radioisótopo; preferiblemente un radioisótopo seleccionado de ^{11}C , $^{11\text{m}}\text{N}$, ^{16}F , ^{18}F ; más preferiblemente ^{18}F .

31. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 30, en donde R² es representado por

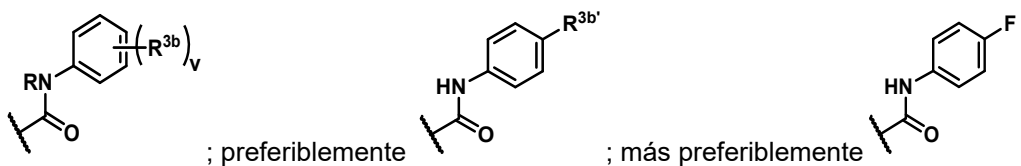


32. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 31, en donde R^3 es representado por:



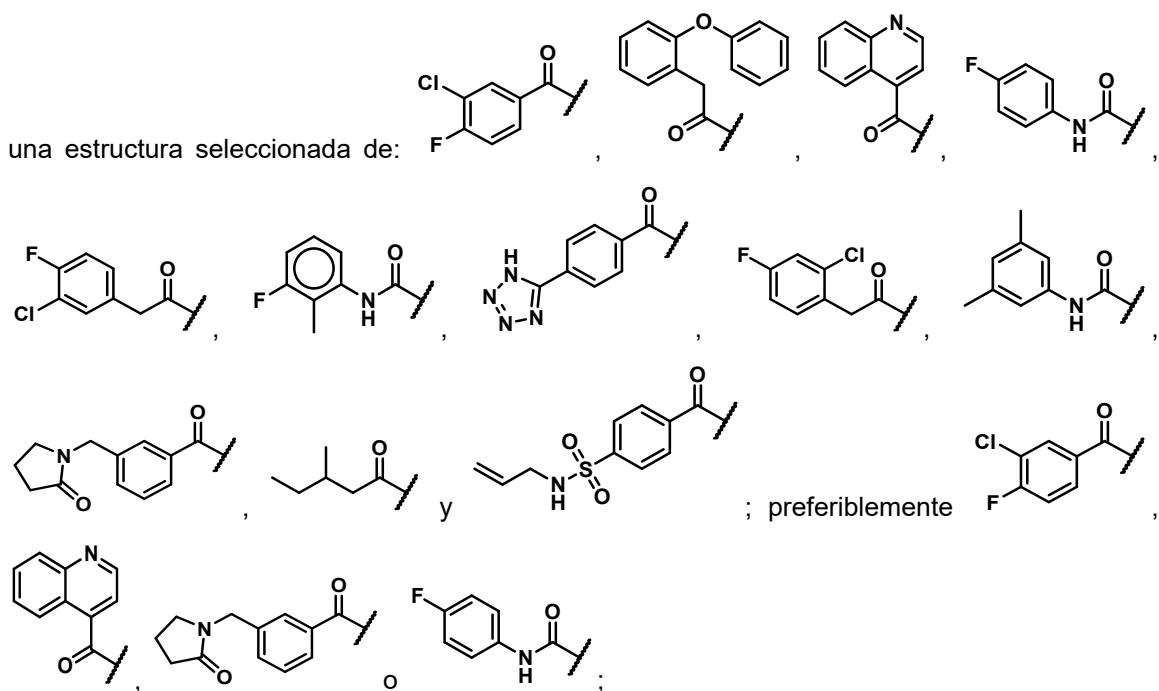
en donde u es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 1 o 2; más preferiblemente 2;
cada uno de $R^{3a'}$ y $R^{3a''}$ es independiente como se definió anteriormente para R^{3a} .

33. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 32, en donde R^3 es representado por:

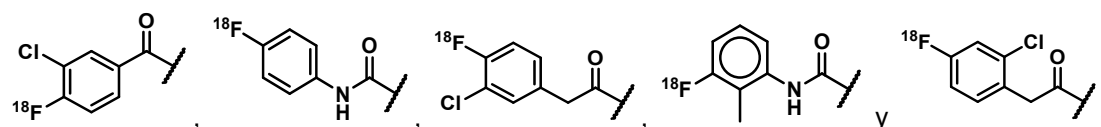


en donde v es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 1; y $R^{3b'}$ es independiente tal como se define para R^{3b} .

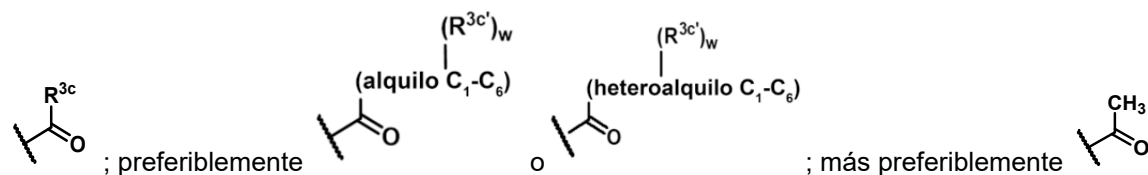
34. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 33, en donde R^3 está representado por



Opcionalmente, en donde al menos un átomo de la estructura es un radioisótopo; preferiblemente un radioisótopo seleccionado de ^{11}C , $^{11\text{m}}\text{N}$, ^{16}F , ^{18}F ; más preferiblemente ^{18}F ; lo más preferiblemente en donde la estructura se selecciona de:

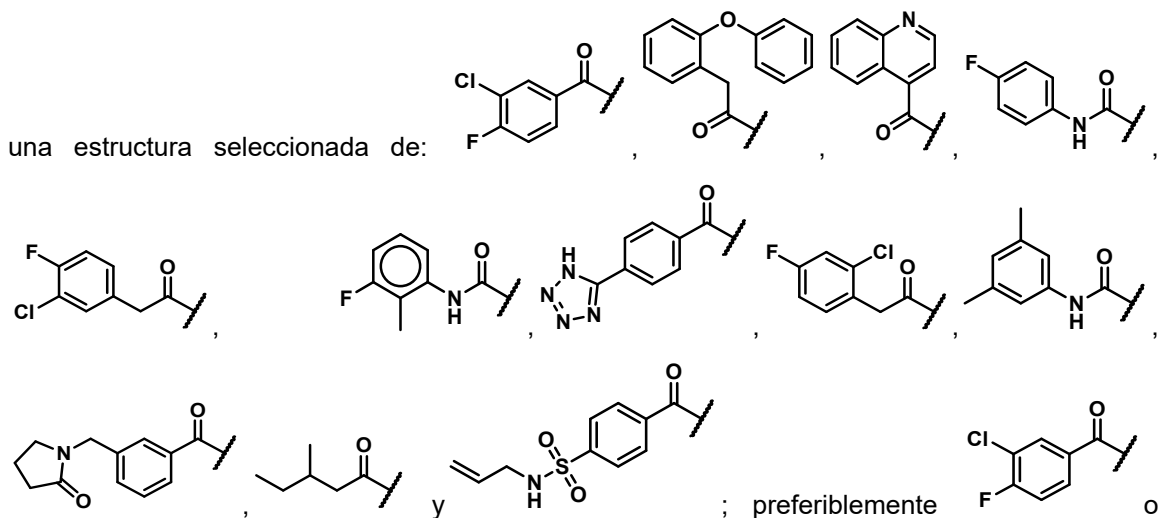


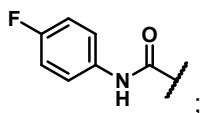
35. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 34, en donde R^3 es representado por:



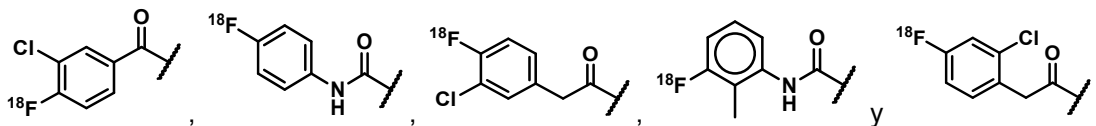
en donde w es 0, o un número entero igual o menor que el número total de átomos de H en el grupo alquilo o heteroalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$; preferiblemente 0, 1, 2 o 3; más preferiblemente 0; y $\text{R}^{3\text{c}'}$ es independiente tal como se define para $\text{R}^{3\text{c}}$.

36. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 35, en donde R^3 está representado por

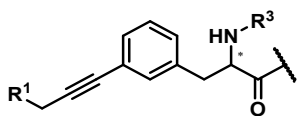




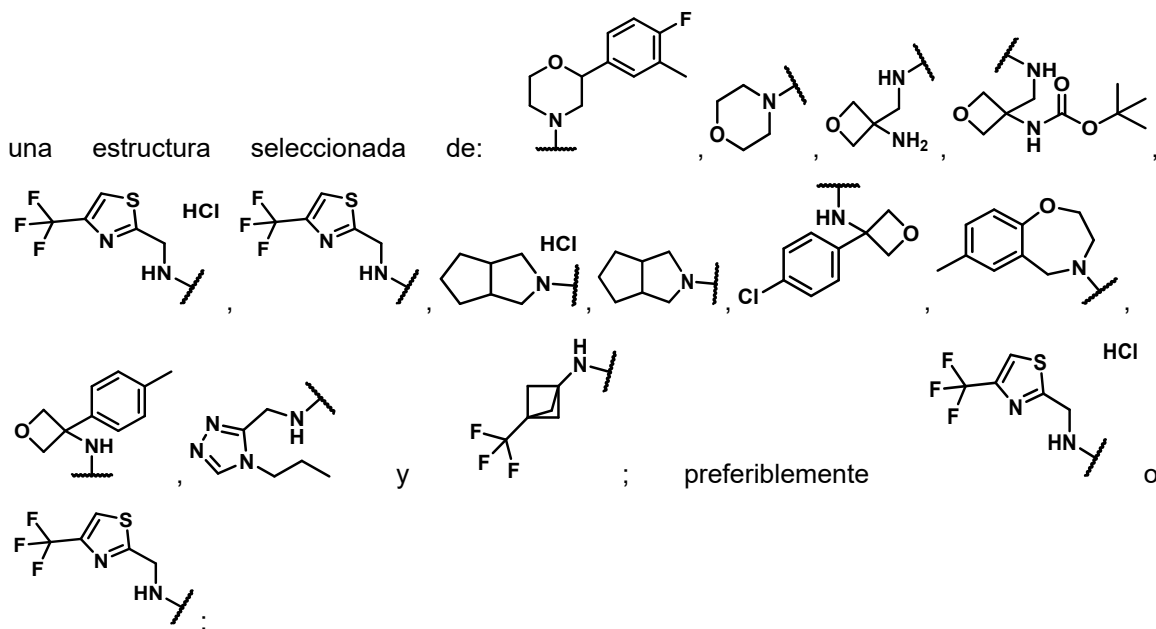
opcionalmente, en donde al menos un átomo de la estructura es un radioisótopo; preferiblemente un radioisótopo seleccionado de ^{11}C , ^{11}mN , ^{16}F , ^{18}F ; más preferiblemente ^{18}F ; lo más preferiblemente en donde la estructura se selecciona de:



37. El compuesto de la reivindicación 36, en donde $\text{R}^1\text{-Y-Z}$ es representado por

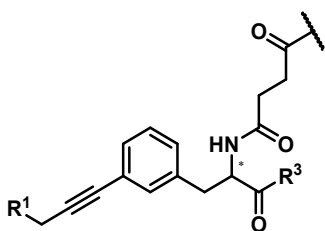


38. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 37, en donde R^3 está representado por

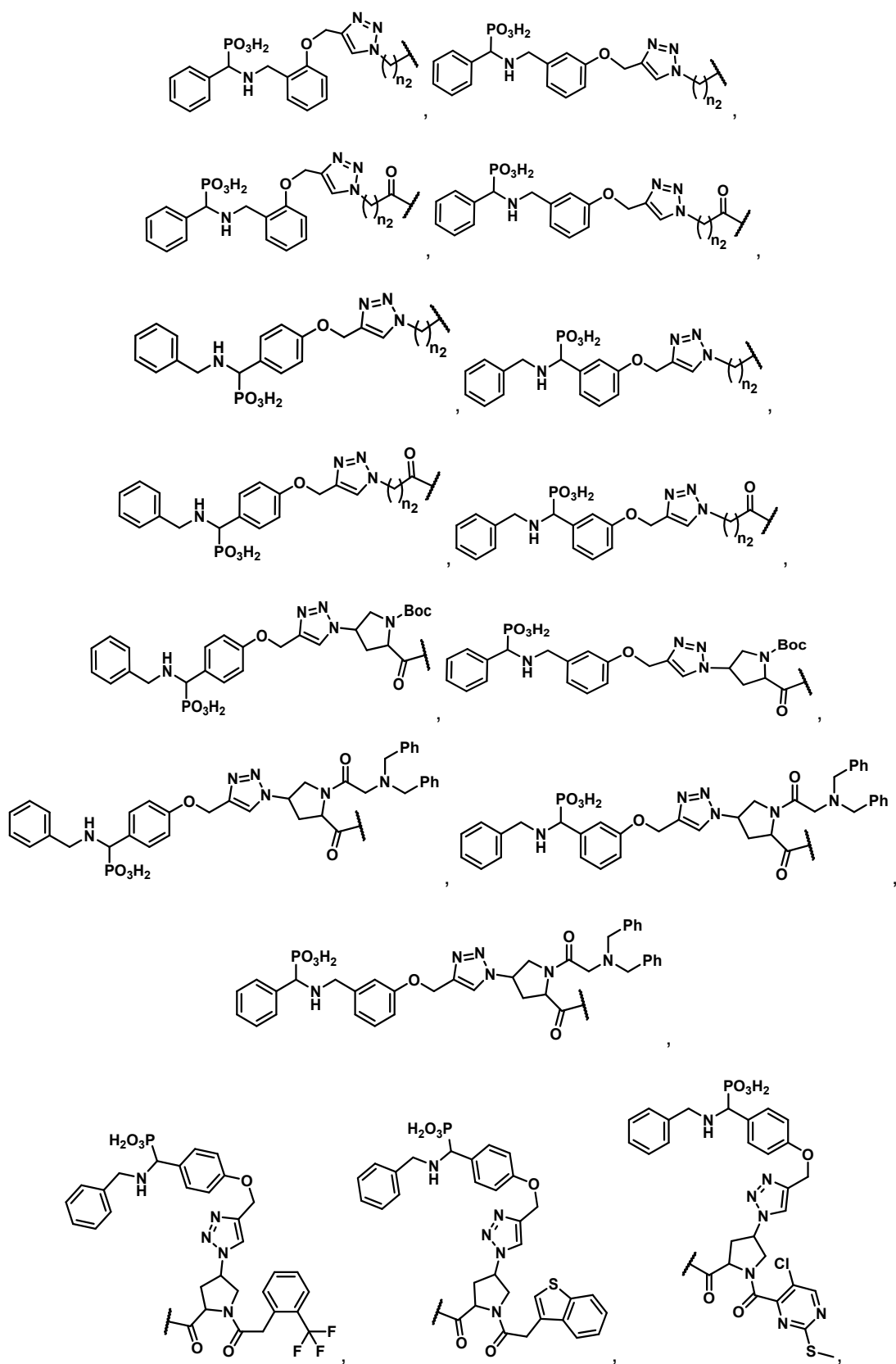


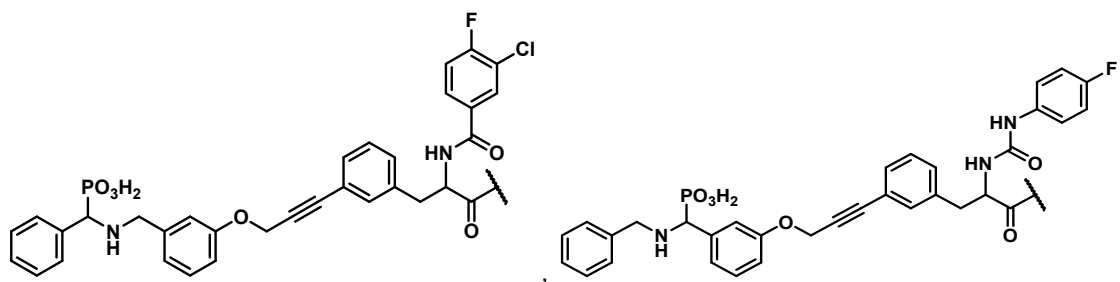
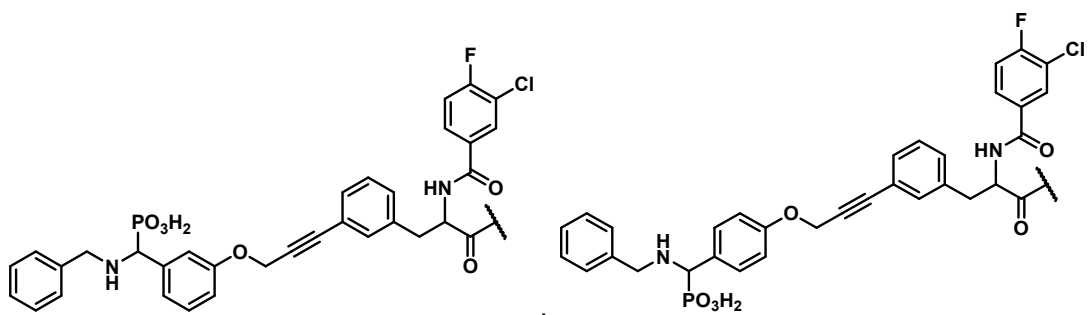
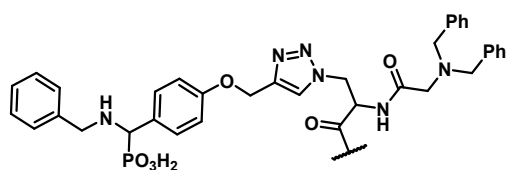
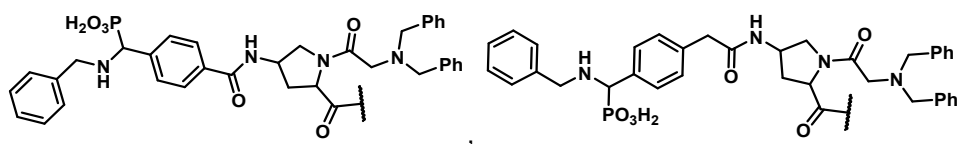
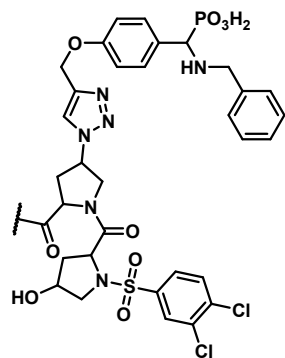
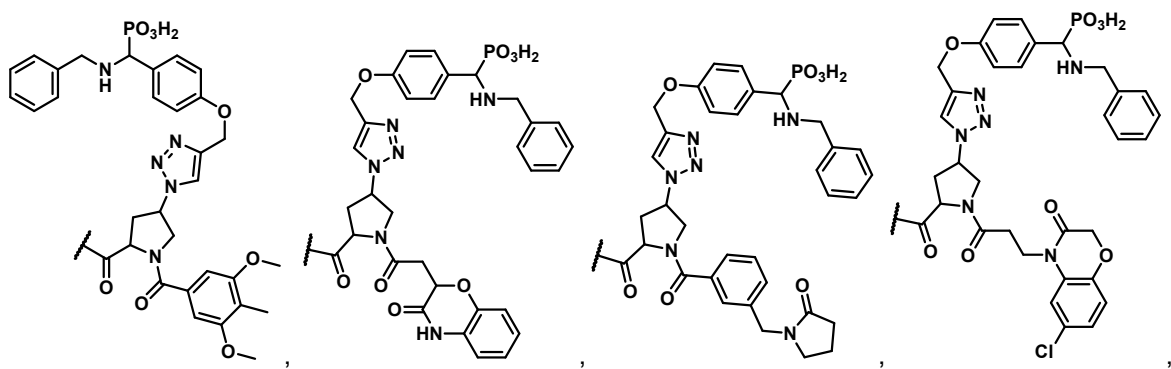
opcionalmente, en donde al menos un átomo de la estructura es un radioisótopo; preferiblemente un radioisótopo seleccionado de ^{11}C , ^{11}mN , ^{16}F , ^{18}F ; más preferiblemente ^{18}F .

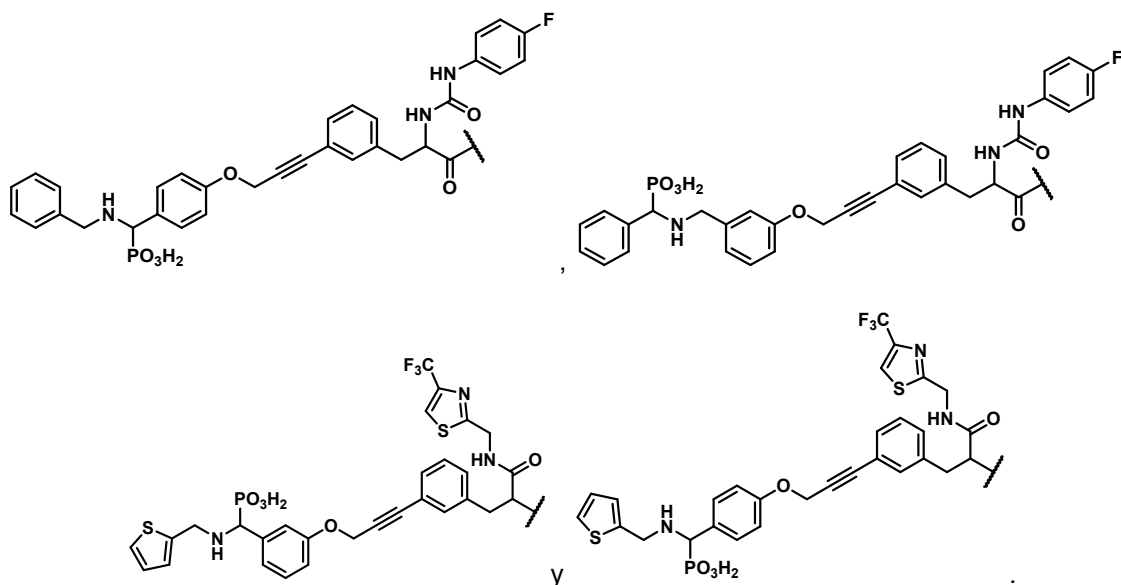
39. El compuesto de la reivindicación 38, en donde $\text{R}^1\text{-Y-Z}$ es representado por



40. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 39, en donde $\text{R}^1\text{-Y-Z}$ está seleccionado independientemente por las siguientes estructuras:







41. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 40, en donde R¹-Y-Z se selecciona independientemente de las estructuras **A-1** a **A-30** o **A-31** a **A-42**, tal y como se definen en la descripción.
42. Un compuesto, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, en donde la estructura del compuesto comprende al menos un grupo representado independientemente por la siguiente estructura:



en donde:

Y se selecciona independientemente de:

-(CR(R))_{n₁}Cyc¹Cyc²(R²)C(O)-,

-(CR(R))_{n₁}R^ACyc³(CR(R))_{n₃}C(R)(NR(R³))(CR(R))_{n₄}C(O)-, y

-(CR(R))_{n₁}Cyc¹(CR(R))_{n₂}(C(O))₀₋₁-,

Cyc¹ se selecciona independientemente de carbociclilo C₅₋₁₀, heterociclilo de 5 a 10 miembros, NRC(O) y C(O)NR;

Cyc² se selecciona independientemente de un heterociclilo de 4 a 6 miembros;

Cyc³ se selecciona independientemente de carbociclilo C₅₋₁₀, arilo C₆₋₁₀, heterociclilo de 5 a 10 miembros y heteroarilo de 5 a 10 miembros;

R^A se selecciona independientemente de -C≡C-, arilo C₆, arilo C₁₀, heteroarilo de 5 miembros y heteroarilo de 6 miembros;

n₁ es independientemente 0, 1 o 2;

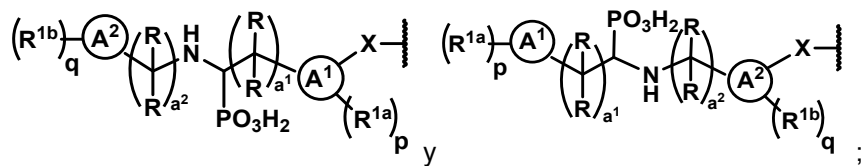
n₂ es independientemente 0, 1 o 2;

n₃ es independientemente 0, 1 o 2;

n₄ es independientemente 0, 1 o 2;

n₅ es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

cada uno de a' y b' es independientemente 1, 2 o 3;



A¹ se selecciona independientemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heterociclilo de 5 a 10 miembros, alquilo C₁₋₅, alquenilo C₂₋₅, alquinilo C₂₋₅, carbociclilo C₃₋₅, heteroalquilo C₁₋₅, heteroalquenilo C₂₋₅, heteroalquinilo C₂₋₅ y heterociclilo C₃₋₅;

A² se selecciona independientemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, heterociclilo de 5 a 10 miembros, alquilo C₁₋₅, alquenilo C₂₋₅, alquinilo C₂₋₅, carbociclilo C₃₋₅, heteroalquilo C₁₋₅, heteroalquenilo C₂₋₅, heteroalquinilo C₂₋₅ y heterociclilo C₃₋₅;

X es seleccionado independientemente de O, -CR(R)-, -C(Hal)₂-, -OariloC₆- o está ausente; más preferiblemente de O, CH₂ y CF₂; lo más preferiblemente O;

a^1 es independientemente 0, 1 o 2;

a^2 es independientemente 0, 1 o 2;

con la condición de que $a^1 + a^2 \geq 1$;

p es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4:

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

cada uno de R^{1a} y R^{1b} se selecciona independientemente de OH, halógeno, nitro, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, heteroalquilo C₂₋₆, heteroalquenilo C₂₋₆, heteroalquinilo C₂₋₆, arilo C₆, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, heteroalquilo C₁₋₆, heteroalquenilo C₁₋₆, heteroalquinilo C₁₋₆, arilo C₆, heteroarilo C₆, heteroarilo y CN, -C(O)OH y -C(O)OC₁₋₆, cada uno de los cuales puede estar sustituido opcionalmente, y donde el heteroarilo es un heteroarilo de 5 o 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S;

R² se selecciona independientemente de -C(O)(CR(R))_{r₁}N((CR(R))_{r₂}R^{2a})(CR(R))_{r₃}R^{2b}, -C(O)R, -C(O)(CR(R))_{r₄}R^{2c}, -C(O)R^{2d}(CR(R))_{r₅}R^{2e}, y -C(O)R^{2f}S(O)₂R^{2g};

R³ se selecciona independientemente de C(O)R^{3a}, (CR(R))_{r6}C(O)R^{3a}, C(O)N(R)R^{3b}, C(O)R^{3c}, C(O)N(R)R^{3d}, C(O)NR^{3e}R^{3f} y NR^{3e}R^{3f};

cada uno de los r_1, r_2 y r_3 se selecciona independientemente de 0, 1 y 2;

cada uno de los r_4 , r_5 y r_6 se selecciona independientemente de 0, 1 y 2:

cada uno de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^{2g} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} y R^{3f} se selecciona

independientemente de arilo de 6 a 10 miembros, heteroarilo de 5 a 10 miembros, (arilo de 6 a 10 miembros)alquilo C_{1-3} , (heteroarilo de 5 a 10 miembros)alquilo C_{1-3} , alquilo C_{1-10} y heteroalquilo C_{1-10} ;

en donde dos o más de R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^{2g} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} y R^{3f} pueden unirse para formar un anillo;

en donde cada uno de R^{2a} y R^{2b} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido.

en donde R^{2c} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados

independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄ o no sustituido; en donde R^{2d} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, oxo-heterociclilo C₄₋₆alquilo C₁₋₂, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido; en donde R^{2e} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido; en donde R^{2f} está sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido,

en donde R^{3a} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅, (alquilo C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, (alquenil C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, o no sustituido;

en donde R^{3b} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅, y (alquilo C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, (alquenil C₁₋₄)NRS(O)₂⁻, o no sustituido;

en donde R^{3c} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido; lo más preferiblemente no sustituido;

en donde R^{3d} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido; lo más preferiblemente no sustituido;

NR^{3e}R^{3f} está sustituido opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, amino, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, arilo C₆₋₁₀, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

en donde cada R se selecciona independientemente de H, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido o alquiloxi C₁₋₄ opcionalmente sustituido; y

Z representa el punto de unión al resto de la molécula.

43. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 42, en donde:

Cyc¹ se selecciona independientemente de arilo C₆, arilo C₁₀, heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, NHC(O) y C(O)NH;

Cyc² se selecciona independientemente de heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros que comprenda al menos un N;

Cyc³ se selecciona independientemente de arilo C₆, arilo C₁₀, heteroarilo de 5 miembros y heteroarilo de 6 miembros;

R^A se selecciona independientemente de -C≡C-, fenilo y triazolilo;

n₁ es 1; n₂ es 2; n₃ es 1; n₄ es 0; n₅ es 4; n' es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4; n'' es 2; X' se selecciona independientemente de O y C(O)NH; cada uno de a' y b' es 1;

A¹ se selecciona independientemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C₂, C₃ o C₄, alquenilo de C₂, C₃ o C₄, alquinilo de C₂, C₃ o C₄, y carbociclilo de C₄ o C₅;

A² se selecciona independientemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C₂, C₃ o C₄, alquenilo de C₂, C₃ o C₄, alquinilo de C₂, C₃ o C₄, y carbociclilo de C₄ o C₅;

X se selecciona independientemente de O, CH₂ y CF₂;

a¹ es independientemente 0 o 1; a² es independientemente 0 o 1; con la condición de que a¹ + a² ≥ 1;

p es independientemente 0, 1 o 2; q es independientemente 0, 1 o 2;

cada uno de R^{1a} y R^{1b} se selecciona independientemente de OH, F, Cl, Br, I, nitro, alcoxi C₁, C₂, C₃ o C₄, haloalcoxi C₁, C₂, C₃ o C₄, ariloxi C₆, CN, -C(O)OH, -C(O)OC₁alquilo, -C(O)OC₂alquilo y -C(O)OC₃alquilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido;

R² se selecciona independientemente de -C(O)(CR(R))_{r1}N((CR(R))_{r2}R^{2a})(CR(R))_{r3}R^{2b}, -C(O)R, -C(O)(CR(R))_{r4}R^{2c}, -C(O)R^{2d}(CR(R))_{r5}R^{2e}, y -C(O)R^{2f}S(O)₂R^{2g};

R³ se selecciona independientemente de C(O)R^{3a}, (CR(R))_{r6}C(O)R^{3a}, C(O)N(R)R^{3b}, C(O)R^{3c}, C(O)N(R)R^{3d}, C(O)NR^{3e}R^{3f} y NR^{3e}R^{3f};

cada uno de r₁, r₂ y r₃ es independientemente 0 o 1; cada uno de r₄, r₅ y r₆ es independientemente 0 o 1;

cada uno de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e} y R^{3f} se selecciona independientemente de arilo de 6 o 10 miembros y heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, alquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico, y heteroalquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico;

en donde dos o más de R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e} y R^{3f} pueden unirse para formar un anillo;

en donde cada uno de R^{2a} y R^{2b} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido

en donde R^{2c} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃, CH₃O y CH₃S, o no sustituido;

en donde R^{2d} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{2e} está sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{2f} está sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{3a} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de Cl, F, CH₃, F y CH₃, CF₃, CH₃O, PhO, tetrazolilo y aliilNHSO₂- o no sustituido;

en donde R^{3b} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de F, Cl, CH₃, tetrazolilo y aliilNHSO₂- o no sustituido;

en donde R^{3c} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , alquilo C_{1-4} , arilo C_{6-10} , heterociclilo C_{1-6} , (amino)alquilo C_{1-4} , heteroarilo C_{1-5} o no sustituido;

en donde R^{3d} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , alquilo C_{1-4} , arilo C_{6-10} , heterociclilo C_{1-6} , (amino)alquilo C_{1-4} , heteroarilo C_{1-5} o no sustituido;

$NR^{3e}R^{3f}$ está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, NH_2 , NHBoc, fenilo, metilfenilo, benzo, metilbenzo, alquilo C_1 , alquilo C_2 , alquilo C_3 , alquilo C_4 , CF_3 o no sustituido; y

en donde cada R se selecciona independientemente de H, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH_3 , CF_3 y CH_3O .

44. El compuesto de la reivindicación 42, en donde:

Cyc¹ se selecciona independientemente de arilo C_6 , arilo C_{10} , heteroarilo de 5 miembros, heteroarilo de 6 miembros, NHC(O) y C(O)NH;

Cyc² se selecciona independientemente de heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros que comprenda al menos un N;

Cyc³ se selecciona independientemente de arilo C_6 , arilo C_{10} , heteroarilo de 5 miembros y heteroarilo de 6 miembros;

R^A se selecciona independientemente de $-C\equiv C-$, fenilo y triazolilo;

n_1 es 1; n_2 es 2; n_3 es 1; n_4 es 0; n_5 es 4; n' es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4; n'' es 2; X' se selecciona independientemente de O y C(O)NH; cada uno de a' y b' es 1;

A^1 se selecciona independientemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C_2 , C_3 o C_4 , alqueno de C_2 , C_3 o C_4 , alquino de C_2 , C_3 o C_4 , y carbociclilo de C_4 o C_5 ;

A^2 se selecciona independientemente de arilo de 6 o 10 miembros, heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contenga al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, heterociclilo de 4 o 5 miembros, alquilo de C_2 , C_3 o C_4 , alqueno de C_2 , C_3 o C_4 , alquino de C_2 , C_3 o C_4 , y carbociclilo de C_4 o C_5 ;

X se selecciona independientemente de O, CH_2 y CF_2 ;

a^1 es independientemente 0 o 1; a^2 es independientemente 0 o 1; con la condición de que $a^1 + a^2 \geq 1$;

p es independientemente 0, 1 o 2; q es independientemente 0, 1 o 2;

cada uno de R^{1a} y R^{1b} se selecciona independientemente de OH, F, Cl, Br, I, nitro, alcoxi C_1 , C_2 , C_3 o C_4 , haloalcoxi C_1 , C_2 , C_3 o C_4 , arilo C_6 , CN, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ alquilo, $-C(O)OC_2$ alquilo y $-C(O)OC_3$ alquilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido;

R^2 se selecciona independientemente de $-C(O)(CR(R))_{r_1}N((CR(R))_{r_2}R^{2a})(CR(R))_{r_3}R^{2b}$, $-C(O)R$, $-C(O)(CR(R))_{r_4}R^{2c}$, $-C(O)R^{2d}(CR(R))_{r_5}R^{2e}$, y $-C(O)R^{2f}S(O)_2R^{2g}$;

R^3 se selecciona independientemente de $C(O)R^{3a}$, $(CR(R))_{r_6}C(O)R^{3a}$, $C(O)N(R)R^{3b}$, $C(O)R^{3c}$, $C(O)N(R)R^{3d}$, $C(O)NR^{3e}R^{3f}$ y $NR^{3e}R^{3f}$;

cada uno de r_1 , r_2 y r_3 es independientemente 0 o 1; cada uno de r_4 , r_5 y r_6 es independientemente 0 o 1;

cada uno de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^{2g} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} y R^{3f} se selecciona

independientemente de arilo de 6 o 10 miembros y heteroarilo de 5, 6 o 10 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S, alquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico, y heteroalquilo C₁₋₆ lineal, ramificado y/o cíclico;

en donde dos o más de R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{2e}, R^{2f}, R^{2g}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R^{3e} y R^{3f} pueden unirse para formar un anillo;

en donde cada uno de R^{2a} y R^{2b} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido

en donde R^{2c} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃, CH₃O y CH₃S, o no sustituido;

en donde R^{2d} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{2e} está sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{2f} está sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O o no sustituido;

en donde R^{3a} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de Cl, F, CH₃, F y CH₃, CF₃, CH₃O, PhO, tetrazolilo y aliilNHSO₂- o no sustituido;

en donde R^{3b} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de F, Cl, CH₃, tetrazolilo y aliilNHSO₂- o no sustituido;

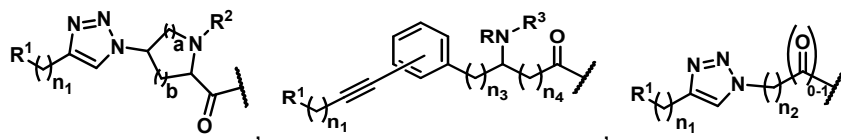
en donde R^{3c} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

en donde R^{3d} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de OH, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquiloxi C₁₋₄, ariloxi C₆₋₁₀, heterociclilo C₁₋₆, (amino)alquilo C₁₋₄, heteroarilo C₁₋₅ o no sustituido;

NR^{3e}R^{3f} está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados independientemente de oxo, OH, Cl, F, Br, I, NH₂, NHBoc, fenilo, metilfenilo, benzo, metilbenzo, alquilo C₁, alquilo C₂, alquilo C₃, alquilo C₄, CF₃ o no sustituido; y

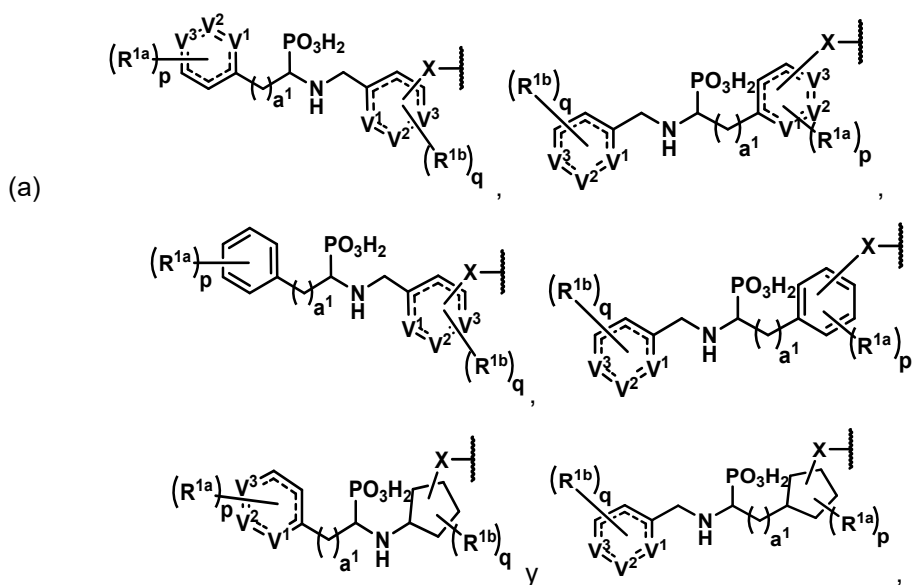
en donde cada R se selecciona independientemente de H, OH, Cl, F, Br, I, t-Bu, CH₃, CF₃ y CH₃O.

45. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 44, en donde R¹-Y-Z está seleccionado independientemente por las siguientes estructuras:

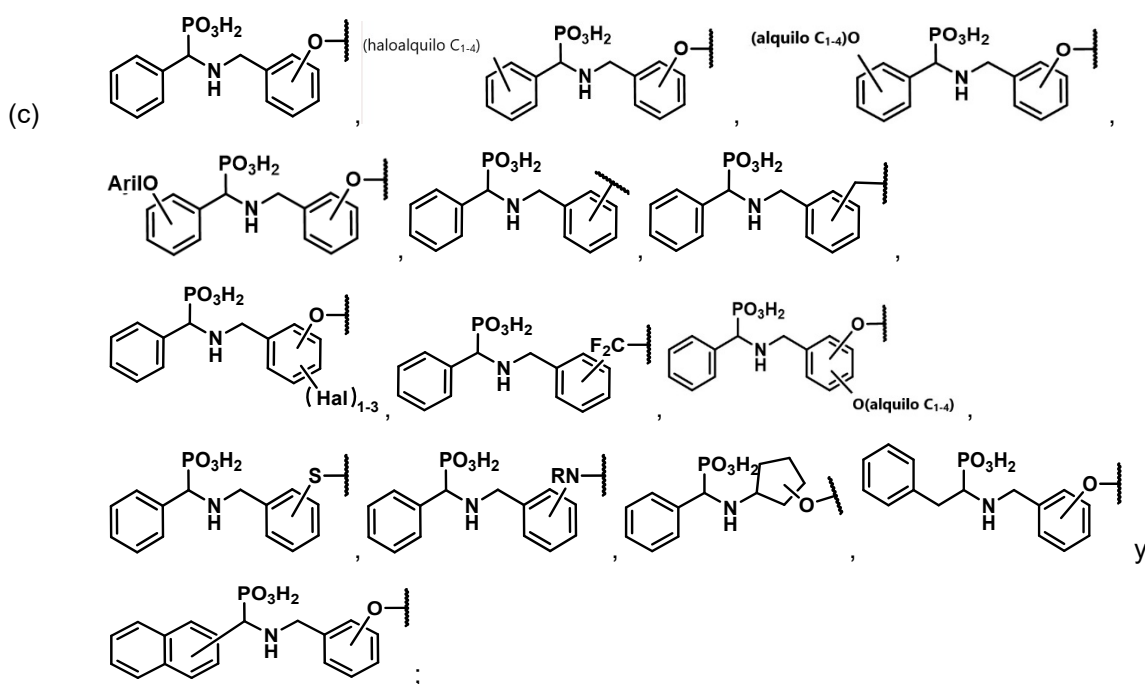
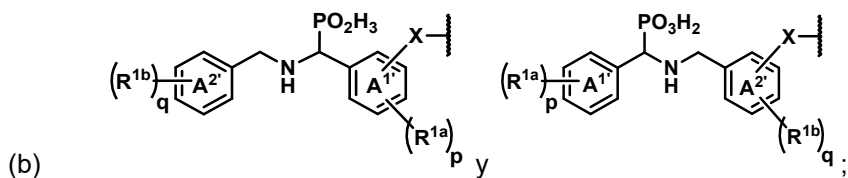


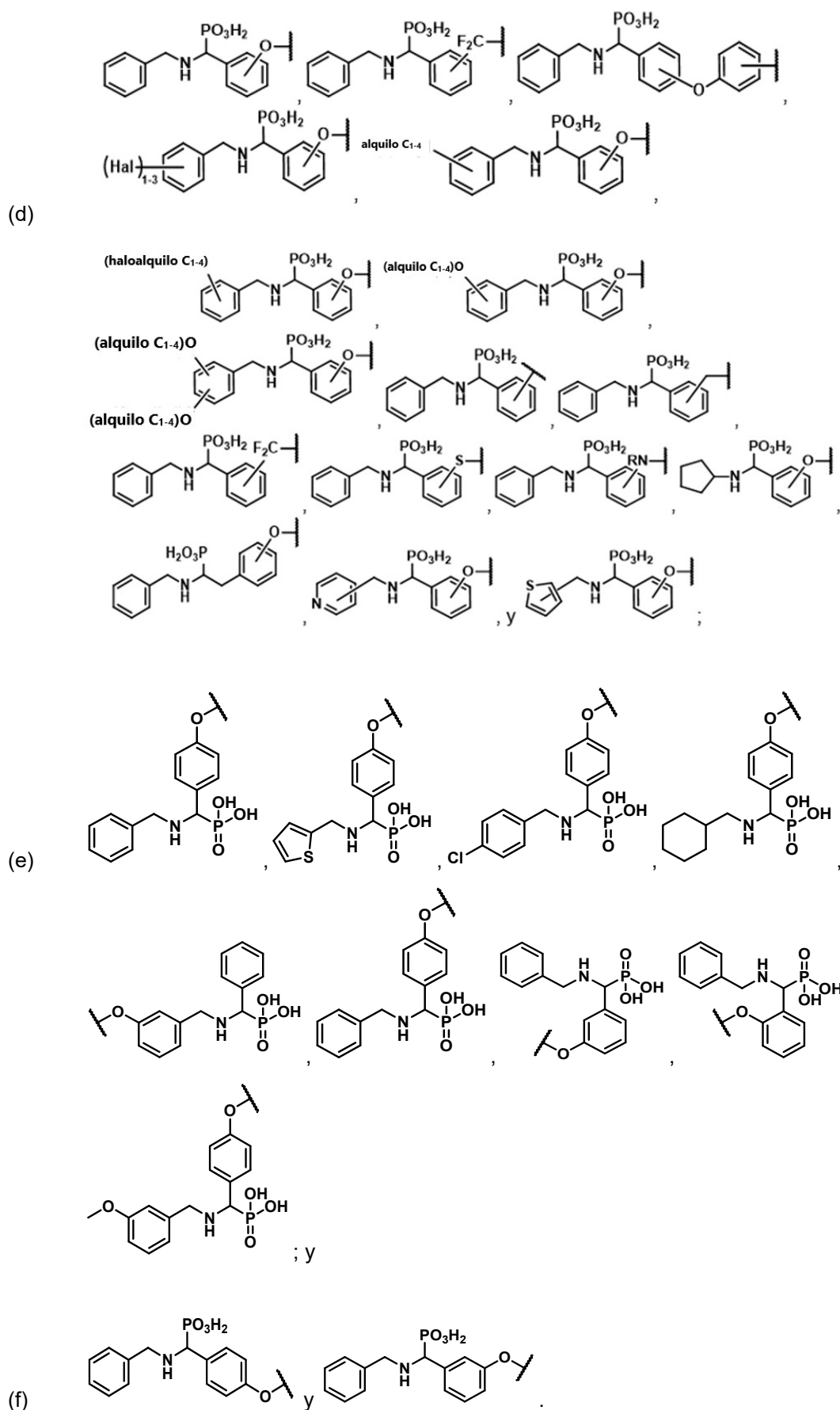
en donde cada uno de a y b es 0, 1 o 2, con la condición de que a + b es ≥ 1 y ≤ 3 .

46. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 45, en donde R¹ se selecciona independientemente de:



en donde cada uno de V^1 , V^2 y V^3 se selecciona independientemente de CH y un heteroátomo, preferiblemente O, S o N, y en donde uno de V^1 , V^2 y V^3 puede estar ausente;





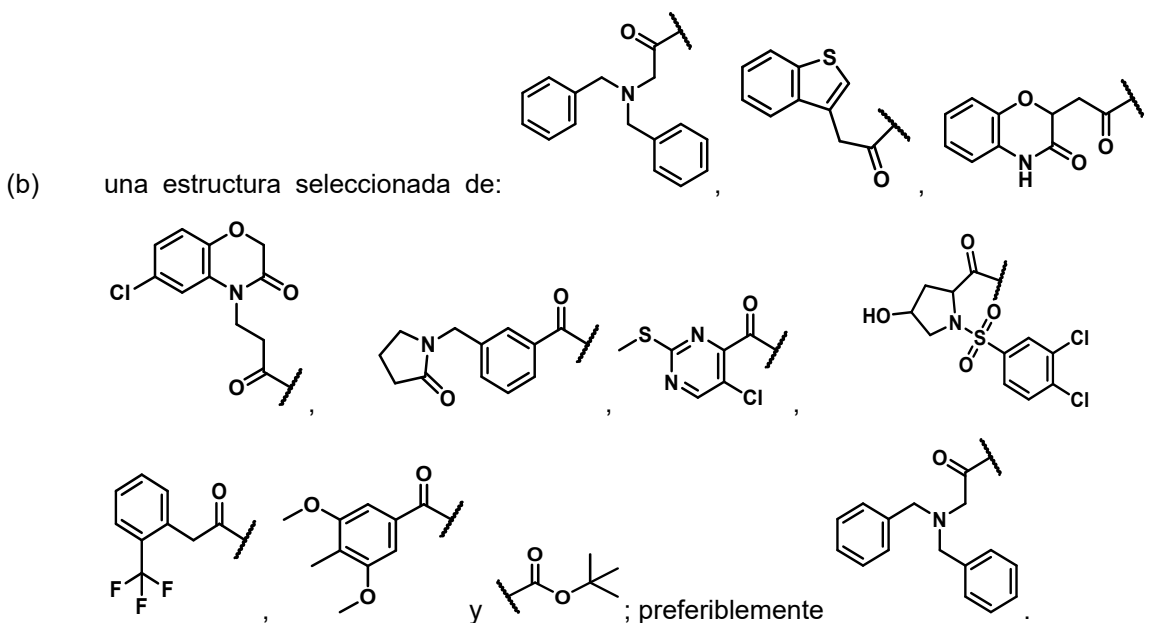
47. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 46, en donde R^2 es representado por:

(a) , en donde:

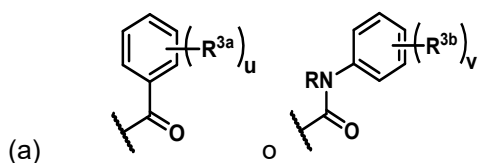
cada uno de $R^{2a'}$ y $R^{2b'}$ se define independientemente como para R^{2a} ;

cada uno de s y t es independientemente 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 0; y

Cada uno de los r_1 , r_2 y r_3 se selecciona independientemente de 0, 1, 2 y 3; preferiblemente de 1 y 2; más preferiblemente 1; o

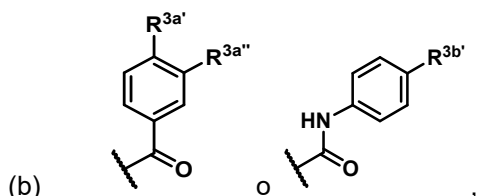


48. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 47, en donde R^3 es representado por:



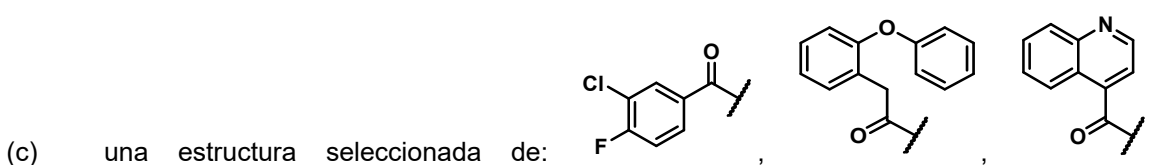
en donde u es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 1 o 2; más preferiblemente 2; y

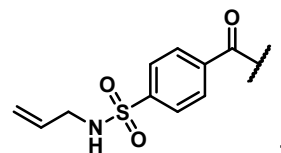
v es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 0 o 1; más preferiblemente 1; o



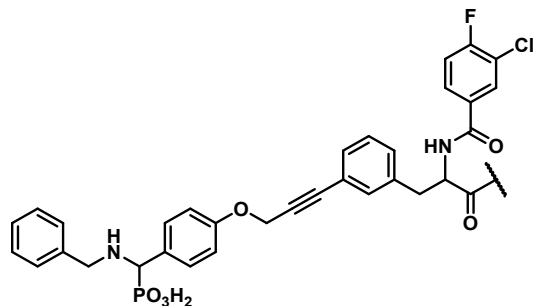
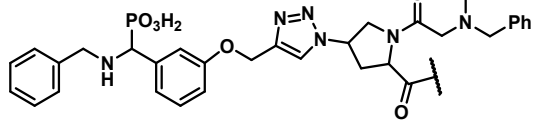
en donde cada uno de $R^{3a'}$ y $R^{3a''}$ se define independientemente como para R^{3a} ; y

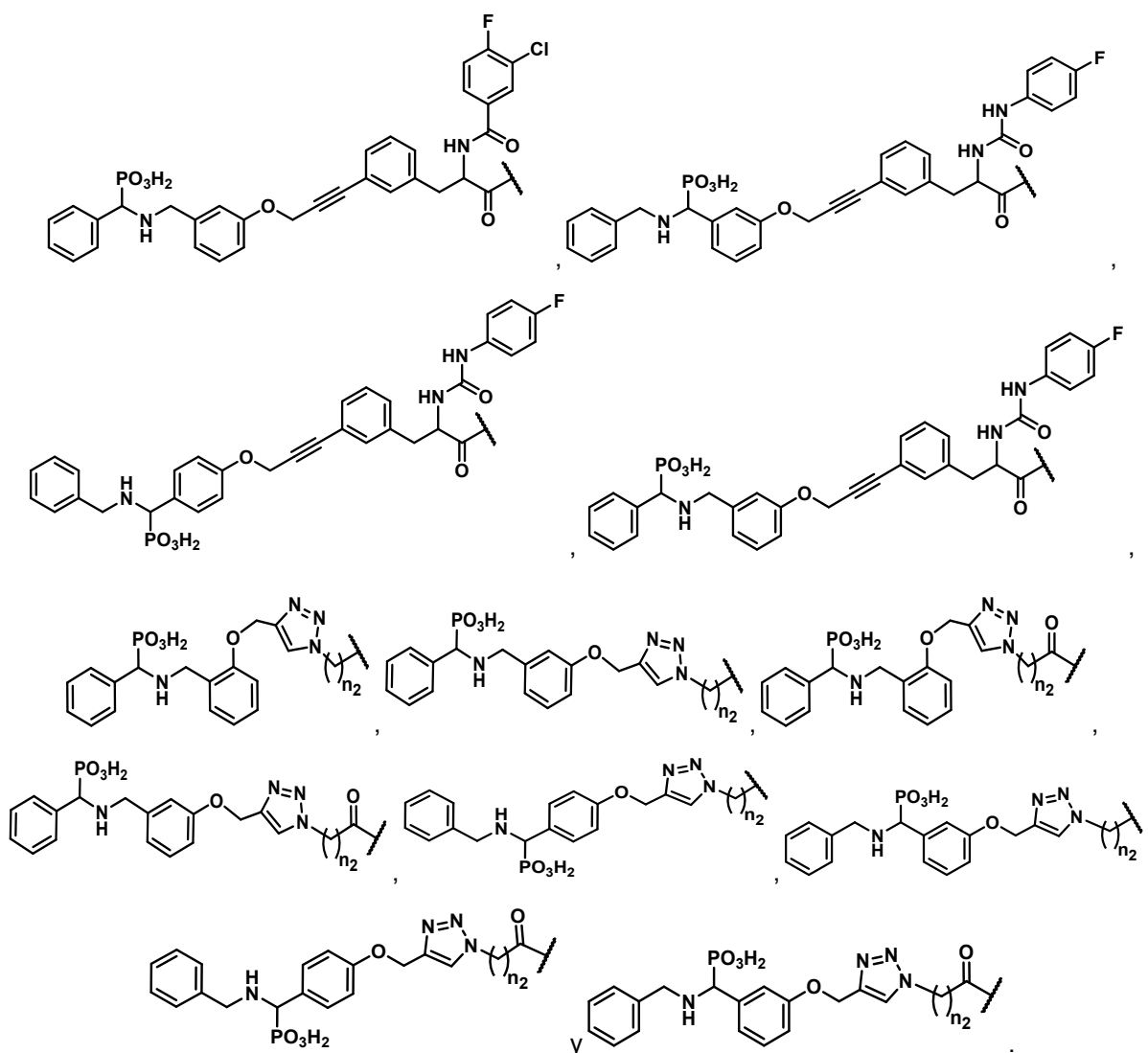
$R^{3b'}$ se define independientemente como para R^{3b} ; o



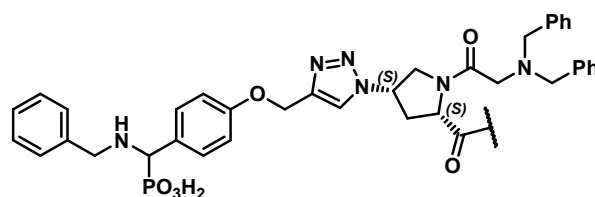


- CC(=O)N1CC[C@H](C1c2ccnc2COc3ccc(cc3)C(Cc4ccccc4)N)C5=CC=CC=C5C6=CC=CC=C6C7=CC=CC=C7C8=CC=CC=C8C9=CC=CC=C9C10=CC=CC=C10C11=CC=CC=C11C12=CC=CC=C12C13=CC=CC=C13C14=CC=CC=C14C15=CC=CC=C15C16=CC=CC=C16C17=CC=CC=C17C18=CC=CC=C18C19=CC=CC=C19C20=CC=CC=C20C21=CC=CC=C21C22=CC=CC=C22C23=CC=CC=C23C24=CC=CC=C24C25=CC=CC=C25C26=CC=CC=C26C27=CC=CC=C27C28=CC=CC=C28C29=CC=CC=C29C30=CC=CC=C30C31=CC=CC=C31C32=CC=CC=C32C33=CC=CC=C33C34=CC=CC=C34C35=CC=CC=C35C36=CC=CC=C36C37=CC=CC=C37C38=CC=CC=C38C39=CC=CC=C39C40=CC=CC=C40C41=CC=CC=C41C42=CC=CC=C42C43=CC=CC=C43C44=CC=CC=C44C45=CC=CC=C45C46=CC=CC=C46C47=CC=CC=C47C48=CC=CC=C48C49=CC=CC=C49C50=CC=CC=C50C51=CC=CC=C51C52=CC=CC=C52C53=CC=CC=C53C54=CC=CC=C54C55=CC=CC=C55C56=CC=CC=C56C57=CC=CC=C57C58=CC=CC=C58C59=CC=CC=C59C60=CC=CC=C60C61=CC=CC=C61C62=CC=CC=C62C63=CC=CC=C63C64=CC=CC=C64C65=CC=CC=C65C66=CC=CC=C66C67=CC=CC=C67C68=CC=CC=C68C69=CC=CC=C69C70=CC=CC=C70C71=CC=CC=C71C72=CC=CC=C72C73=CC=CC=C73C74=CC=CC=C74C75=CC=CC=C75C76=CC=CC=C76C77=CC=CC=C77C78=CC=CC=C78C79=CC=CC=C79C80=CC=CC=C80C81=CC=CC=C81C82=CC=CC=C82C83=CC=CC=C83C84=CC=CC=C84C85=CC=CC=C85C86=CC=CC=C86C87=CC=CC=C87C88=CC=CC=C88C89=CC=CC=C89C90=CC=CC=C90C91=CC=CC=C91C92=CC=CC=C92C93=CC=CC=C93C94=CC=CC=C94C95=CC=CC=C95C96=CC=CC=C96C97=CC=CC=C97C98=CC=CC=C98C99=CC=CC=C99C100=CC=CC=C100C101=CC=CC=C101C102=CC=CC=C102C103=CC=CC=C103C104=CC=CC=C104C105=CC=CC=C105C106=CC=CC=C106C107=CC=CC=C107C108=CC=CC=C108C109=CC=CC=C109C110=CC=CC=C110C111=CC=CC=C111C112=CC=CC=C112C113=CC=CC=C113C114=CC=CC=C114C115=CC=CC=C115C116=CC=CC=C116C117=CC=CC=C117C118=CC=CC=C118C119=CC=CC=C119C120=CC=CC=C120C121=CC=CC=C121C122=CC=CC=C122C123=CC=CC=C123C124=CC=CC=C124C125=CC=CC=C125C126=CC=CC=C126C127=CC=CC=C127C128=CC=CC=C128C129=CC=CC=C129C130=CC=CC=C130C131=CC=CC=C131C132=CC=CC=C132C133=CC=CC=C133C134=CC=CC=C134C135=CC=CC=C135C136=CC=CC=C136C137=CC=CC=C137C138=CC=CC=C138C139=CC=CC=C139C140=CC=CC=C140C141=CC=CC=C141C142=CC=CC=C142C143=CC=CC=C143C144=CC=CC=C144C145=CC=CC=C145C146=CC=CC=C146C147=CC=CC=C147C148=CC=CC=C148C149=CC=CC=C149C150=CC=CC=C150C151=CC=CC=C151C152=CC=CC=C152C153=CC=CC=C153C154=CC=CC=C154C155=CC=CC=C155C156=CC=CC=C156C157=CC=CC=C157C158=CC=CC=C158C159=CC=CC=C159C160=CC=CC=C160C161=CC=CC=C161C162=CC=CC=C162C163=CC=CC=C163C164=CC=CC=C164C165=CC=CC=C165C166=CC=CC=C166C167=CC=CC=C167C168=CC=CC=C168C169=CC=CC=C169C170=CC=CC=C170C171=CC=CC=C171C172=CC=CC=C172C173=CC=CC=C173C174=CC=CC=C174C175=CC=CC=C175C176=CC=CC=C176C177=CC=CC=C177C178=CC=CC=C178C179=CC=CC=C179C180=CC=CC=C180C181=CC=CC=C181C182=CC=CC=C182C183=CC=CC=C183C184=CC=CC=C184C185=CC=CC=C185C186=CC=CC=C186C187=CC=CC=C187C188=CC=CC=C188C189=CC=CC=C189C190=CC=CC=C190C191=CC=CC=C191C192=CC=CC=C192C193=CC=CC=C193C194=CC=CC=C194C195=CC=CC=C195C196=CC=CC=C196C197=CC=CC=C197C198=CC=CC=C198C199=CC=CC=C199C200=CC=CC=C200C201=CC=CC=C201C202=CC=CC=C202C203=CC=CC=C203C204=CC=CC=C204C205=CC=CC=C205C206=CC=CC=C206C207=CC=CC=C207C208=CC=CC=C208C209=CC=CC=C209C210=CC=CC=C210C211=CC=CC=C211C212=CC=CC=C212C213=CC=CC=C213C214=CC=CC=C214C215=CC=CC=C215C216=CC=CC=C216C217=CC=CC=C217C218=CC=CC=C218C219=CC=CC=C219C220=CC=CC=C220C221=CC=CC=C221C222=CC=CC=C222C223=CC=CC=C223C224=CC=CC=C224C225=CC=CC=C225C226=CC=CC=C226C227=CC=CC=C227C228=CC=CC=C228C229=CC=CC=C229C230=CC=CC=C230C231=CC=CC=C231C232=CC=CC=C232C233=CC=CC=C233C234=CC=CC=C234C235=CC=CC=C235C236=CC=CC=C236C237=CC=CC=C237C238=CC=CC=C238C239=CC=CC=C239C240=CC=CC=C240C241=CC=CC=C241C242=CC=CC=C242C243=CC=CC=C243C244=CC=CC=C244C245=CC=CC=C245C246=CC=CC=C246C247=CC=CC=C247C248=CC=CC=C248C249=CC=CC=C249C250=CC=CC=C250C251=CC=CC=C251C252=CC=CC=C252C253=CC=CC=C253C254=CC=CC=C254C255=CC=CC=C255C256=CC=CC=C256C257=CC=CC=C257C258=CC=CC=C258C259=CC=CC=C259C260=CC=CC=C260C261=CC=CC=C261C262=CC=CC=C262C263=CC=CC=C263C264=CC=CC=C264C265=CC=CC=C265C266=CC=CC=C266C267=CC=CC=C267C268=CC=CC=C268C269=CC=CC=C269C270=CC=CC=C270C271=CC=CC=C271C272=CC=CC=C272C273=CC=CC=C273C274=CC=CC=C274C275=CC=CC=C275C276=CC=CC=C276C277=CC=CC=C277C278=CC=CC=C278C279=CC=CC=C279C280=CC=CC=C280C281=CC=CC=C281C282=CC=CC=C282C283=CC=CC=C283C284=CC=CC=C284C285=CC=CC=C285C286=CC=CC=C286C287=CC=CC=C287C288=CC=CC=C288C289=CC=CC=C289C290=CC=CC=C290C291=CC=CC=C291C292=CC=CC=C292C293=CC=CC=C293C294=CC=CC=C294C295=CC=CC=C295C296=CC=CC=C296C297=CC=CC=C297C298=CC=CC=C298C299=CC=CC=C299C300=CC=CC=C300C301=CC=CC=C301C302=CC=CC=C302C303=CC=CC=C303C304=CC=CC=C304C305=CC=CC=C305C306=CC=CC=C306C307=CC=CC=C307C308=CC=CC=C308C309=CC=CC=C309C310=CC=CC=C310C311=CC=CC=C311C312=CC=CC=C312C313=CC=CC=C313C314=CC=CC=C314C315=CC=CC=C315C316=CC=CC=C316C317=CC=CC=C317C318=CC=CC=C318C319=CC=CC=C319C320=CC=CC=C320C321=CC=CC=C321C322=CC=CC=C322C323=CC=CC=C323C324=CC=CC=C324C325=CC=CC=C325C326=CC=CC=C326C327=CC=CC=C327C328=CC=CC=C328C329=CC=CC=C329C330=CC=CC=C330C331=CC=CC=C331C332=CC=CC=C332C333=CC=CC=C333C334=CC=CC=C334C335=CC=CC=C335C336=CC=CC=C336C337=CC=CC=C337C338=CC=CC=C338C339=CC=CC=C339C340=CC=CC=C340C341=CC=CC=C341C342=CC=CC=C342C343=CC=CC=C343C344=CC=CC=C344C345=CC=CC=C345C346=CC=CC=C346C347=CC=CC=C347C348=CC=CC=C348C349=CC=CC=C349C350=CC=CC=C350C351=CC=CC=C351C352=CC=CC=C352C353=CC=CC=C353C354=CC=CC=C354C355=CC=CC=C355C356=CC=CC=C356C357=CC=CC=C357C358=CC=CC=C358C359=CC=CC=C



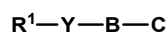


50. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 49, en donde R¹-Y-Z está representado



independientemente por **A-7**:

51. Un compuesto, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, en donde el compuesto tiene una estructura representada por la siguiente estructura:



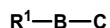
en donde R¹ es como se define en cualquiera de las reivindicaciones anteriores;

Y es como se define en cualquiera de las reivindicaciones anteriores o está ausente;

B es un enlazador; y

cada **C** es un átomo, una molécula o una partícula, y/o es un agente terapéutico o de diagnóstico.

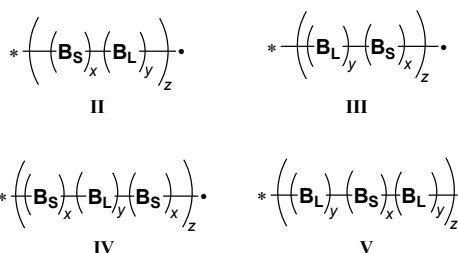
52. El compuesto de la reivindicación 51, en donde R^1 es como se define en cualquiera de las reivindicaciones 42 a 50.
53. Un compuesto, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, en donde el compuesto tiene una estructura c representada por la siguiente estructura:



B es un enlazador; y

cada **C** es un átomo, una molécula o una partícula, y/o es un agente terapéutico o de diagnóstico.

54. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 53, en donde **B** es un enlace sencillo o un grupo alifático C1-50 opcionalmente sustituido, en el cual opcionalmente uno o más átomos de carbono pueden reemplazarse por un heteroátomo, un grupo carbocíclico C3-12 o un grupo heterocíclico C1-12, y el cual puede estar saturado u opcionalmente contener uno o más enlaces dobles o triples.
55. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 54, en donde **B** es un enlace sencillo.
56. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 54, en donde **B** está representado por cualquiera de las siguientes Fórmulas generales II-V:



en donde

cada x es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10;

cada y es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10;

cada z es 0, 1, 2, 3 o 4; preferiblemente 1;

preferiblemente con la condición de que al menos uno de x e y no sea 0;

* representa un punto de unión a una fracción R^1-Y - o R^1 -;

• representa un punto de unión a una fracción **C**; y

cada uno de **BS** y **BL** se selecciona independientemente de alquileo, cicloalquileo, arilalquileo, heteroarilalquileo, heteroalquileo, heterocicloalquileo, alquenileno, cicloalquenileno, arilalquenileno, heteroarilalquenileno, heteroalquenileno, heterocicloalquenileno, alquinileno, heteroalquinileno, arileno, heteroarileno, aminoacilo, oxialquileo, aminoalquileo, éster diácido, dialquilsiloxano, amida, tioamida, tioéter, tioéster, éster, carbamato, hidrazona, tiazolidina, metilencocarbamato, disulfuro, vinileno, imina, imidamida, fosforamida, sacárido, éster de fosfato, fosforamida, carbamato, dipéptido, tripéptido, tetrapéptido, hexapéptido, heptapéptido, octapéptido, nonapéptido y decapéptido, en donde los péptidos más largos que un dipéptido pueden ser cíclicos, y en donde cada uno de los anteriores está opcionalmente sustituido.

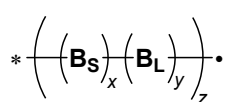
57. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 54, en donde **B** está representado por $(B_S)_x$, en donde:
- cada x se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 y 10;

cada **B_S** se selecciona independientemente del grupo que consiste en alquileo, cicloalquileo, arilalquileo, heteroarilalquileo, heteroalquileo, heterocicloalquileo, alquienilo, cicloalquienilo, arilalquienilo, heteroarilalquienilo, heteroalquienilo, heterocicloalquienilo, alquinilo, heteroalquinilo, arileno, heteroarileno, aminoacilo, oxialquileo, aminoalquileo, éster diácido, dialquilsiloxano, amida, tioamida, tioéter, tioéster, éster, carbamato, hidrazona, tiazolidina, metilencocarbamato, disulfuro, vinileno, imina, imidamida, fosforamida, sacárido, éster de fosfato, fosforamida, carbamato, dipéptido, tripéptido, tetrapéptido, hexapéptido, heptapéptido, octapéptido, nonapéptido y decapeptido, en donde los péptidos más largos que un dipéptido pueden ser cíclicos.

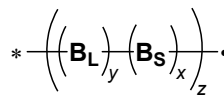
58. El compuesto de la reivindicación 52, en donde B es:

(a) un enlace sencillo o un grupo alifático C1-50 opcionalmente sustituido, en el cual opcionalmente uno o más átomos de carbono pueden reemplazarse por un heteroátomo, un grupo carbocíclico C3-12 o un grupo heterocíclico C1-12, y el cual puede estar saturado u opcionalmente contener uno o más enlaces dobles o triples;

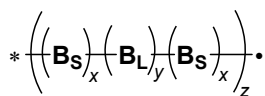
(b) representado por cualquiera de las siguientes Fórmulas generales II-V:



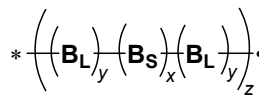
II



III



IV



V

en donde

cada x es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10;

cada y es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10;

cada z es 0, 1, 2, 3 o 4; preferiblemente 1;

preferiblemente con la condición de que al menos uno de x e y no sea 0;

* representa un punto de unión a una fracción **R¹-Y-** o **R¹-**;

• representa un punto de unión a una fracción **C**; y

cada uno de **BS** y **BL** se selecciona independientemente de alquileo, cicloalquileo, arilalquileo, heteroarilalquileo, heteroalquileo, heterocicloalquileo, alquienilo, cicloalquienilo, arilalquienilo, heteroarilalquienilo, heteroalquienilo, heterocicloalquienilo, alquinilo, heteroalquinilo, arileno, heteroarileno, aminoacilo, oxialquileo, aminoalquileo, éster diácido, dialquilsiloxano, amida, tioamida, tioéter, tioéster, éster, carbamato, hidrazona, tiazolidina, metilencocarbamato, disulfuro, vinileno, imina, imidamida, fosforamida, sacárido, éster de fosfato, fosforamida, carbamato, dipéptido, tripéptido, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido. o

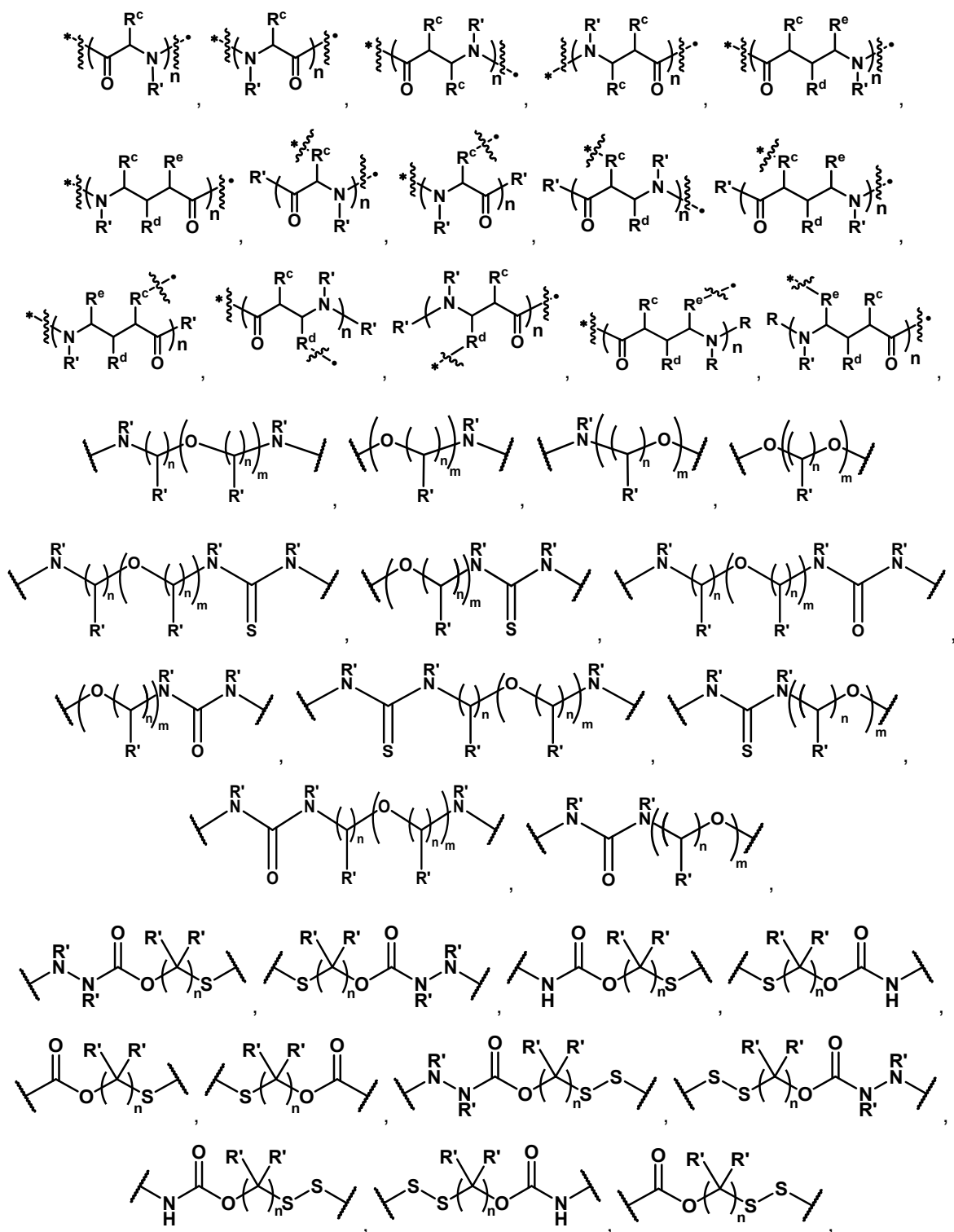
(c) representado por (Bs)x, en donde:

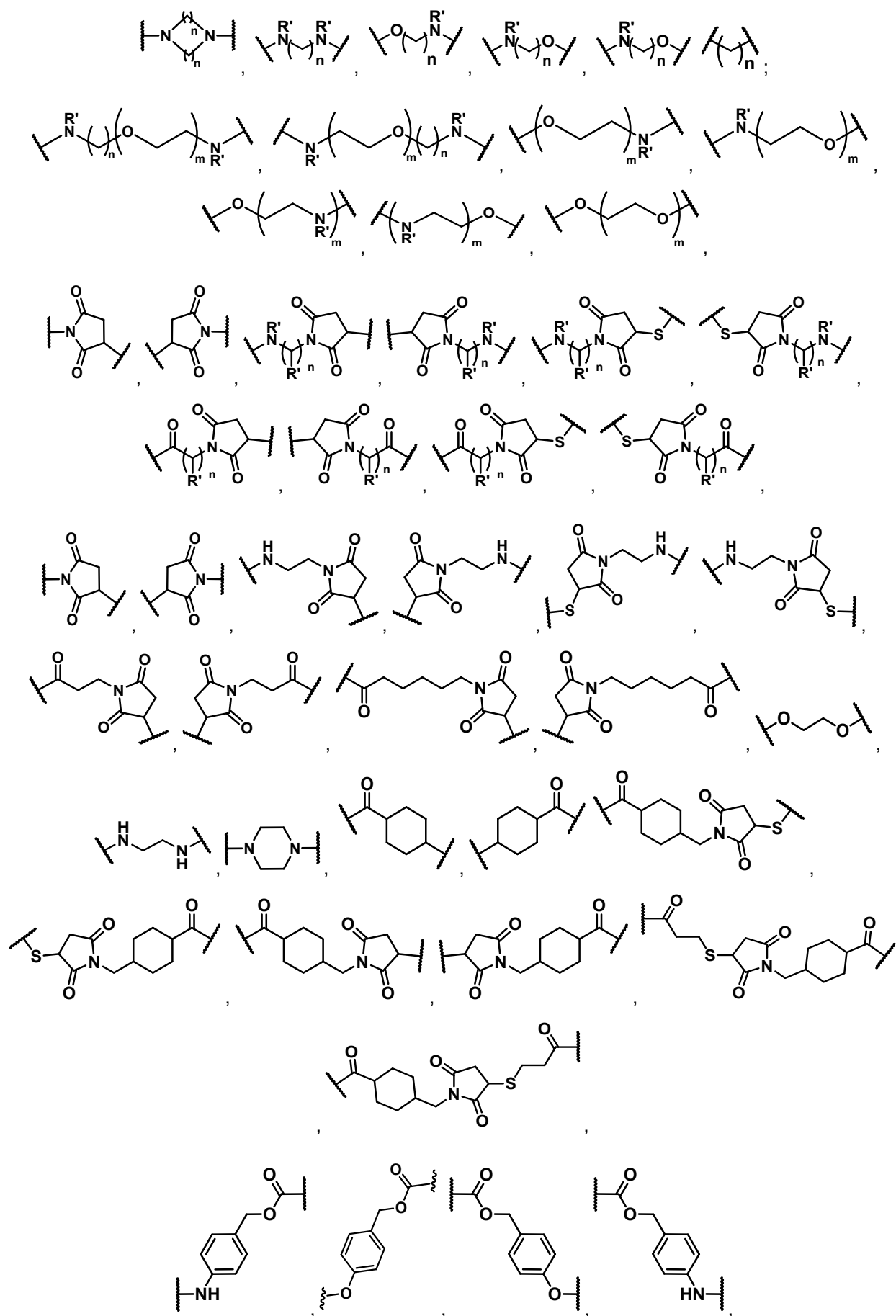
cada x se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 y 10;

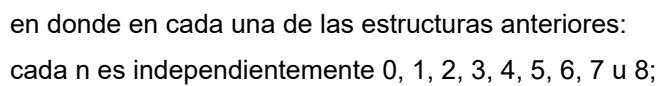
cada B_S se selecciona independientemente del grupo que consiste en alquileo, cicloalquileo, arilalquileo, heteroarilalquileo, heteroalquileo, heterocicloalquileo,

alquenileno, cicloalquenileno, arilalquenileno, heteroarilalquenileno, heteroalquenileno, heterocicloalquenileno, alquinileno, heteroalquinileno, arileno, heteroarileno, aminoacilo, oxialquileno, aminoalquileno, éster diácido, dialquilsiloxano, amida, tioamida, tioéter, tioéster, éster, carbamato, hidrazona, tiazolidina, metilencocarbamato, disulfuro, vinileno, imina, imidamida, fosforamida, sacárido, éster de fosfato, fosforamida, carbamato, dipéptido, tripéptido, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido.

59. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 56 a 58, en donde cada **BS** y **BL** se selecciona independientemente de:







cada n es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

cada m es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4;

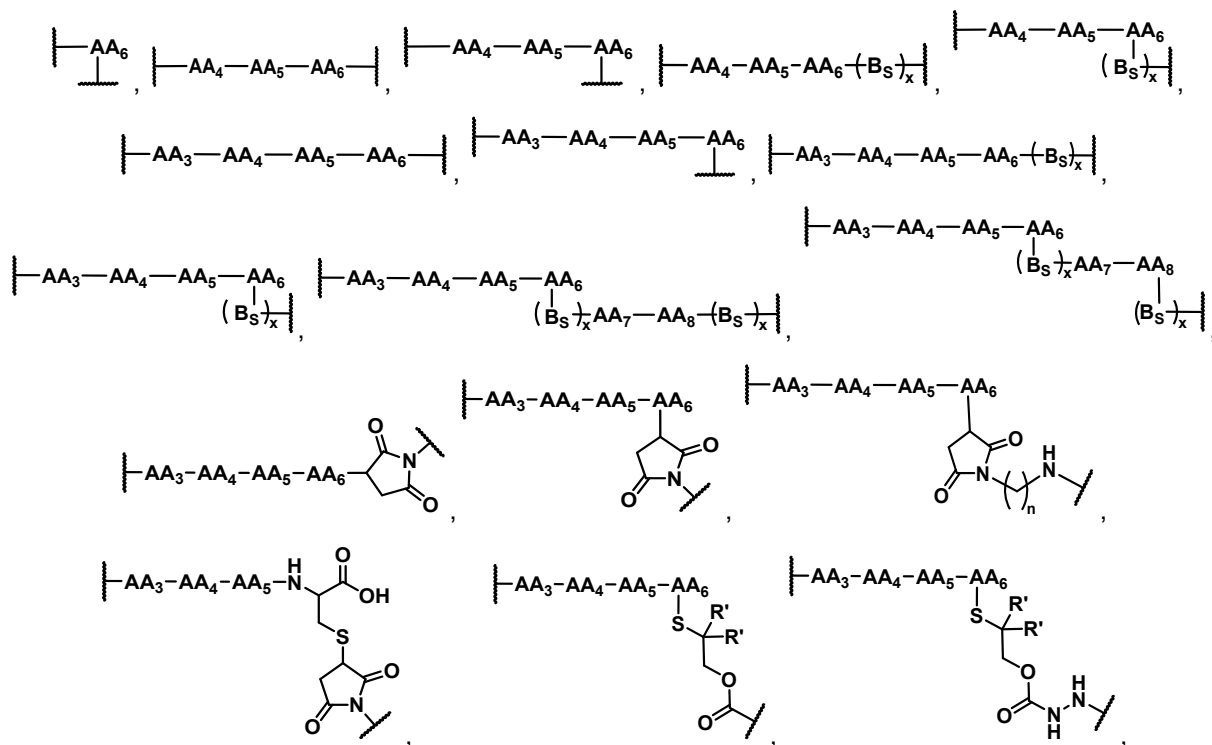
cada Rc, Rd y Re se selecciona independientemente de H, alquilo C1-6 opcionalmente sustituido, (carbociclilo C3-10)alquilo C1-6, (arilo C6-10) alquilo C1-6, (heterociclilo C1-10)alquilo C1-6, alqueno C2-6, alquino C2-6 y arilo C6-10, en cada uno de los cuales opcionalmente uno o más de los átomos de carbono pueden ser reemplazados por heteroátomos; preferiblemente seleccionados de residuos de cadenas laterales de aminoácidos proteinogénicos o no proteinogénicos;

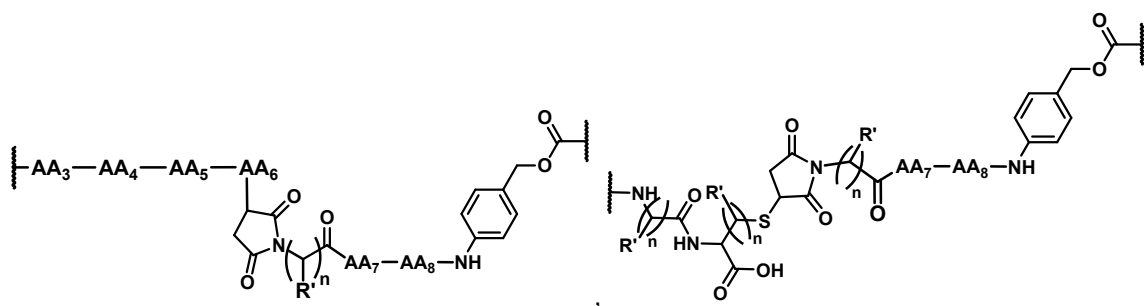
cada ocurrencia de R y R' es independientemente H o seleccionada de -alquiloC1-6, O(alquiloC1-6), S(-alquiloC1-6), cicloalquilo C3-10, O(cicloalquilo C3-10), S(cicloalquiloC3-10), alqueno C2-6, alquino C2-6, heteroalqueno C1-6, heteroalquino C1-6, cicloalqueno C3-10, cicloheteroalqueno C1-10, arilo C6-10, heteroarilo C1-10, (ariloC6-10)alquilo C1-6 y (heteroariloC1-10)alquiloC1-6, cada uno de los cuales puede ser sustituido opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados de -alquiloC1-6, OH, oxo y halógeno, o de OH, oxo y halógeno.

cada * representa un punto de unión para el cual el camino más corto a una fracción **R¹-Y-** o **R¹-** comprende menos átomos que el de •; y cada • representa un punto de unión para el cual el camino más corto a una fracción **C** comprende menos átomos que el de *, con la condición de que cuando n es > 1 y un punto de unión respectivo se indica en cualquiera de Rc, Rd y Re, entonces puede estar presente independientemente en una o más de las unidades monoméricas del péptido; preferiblemente en una unidad monomérica peptídica más alejada del otro punto de unión indicado en la estructura respectiva.

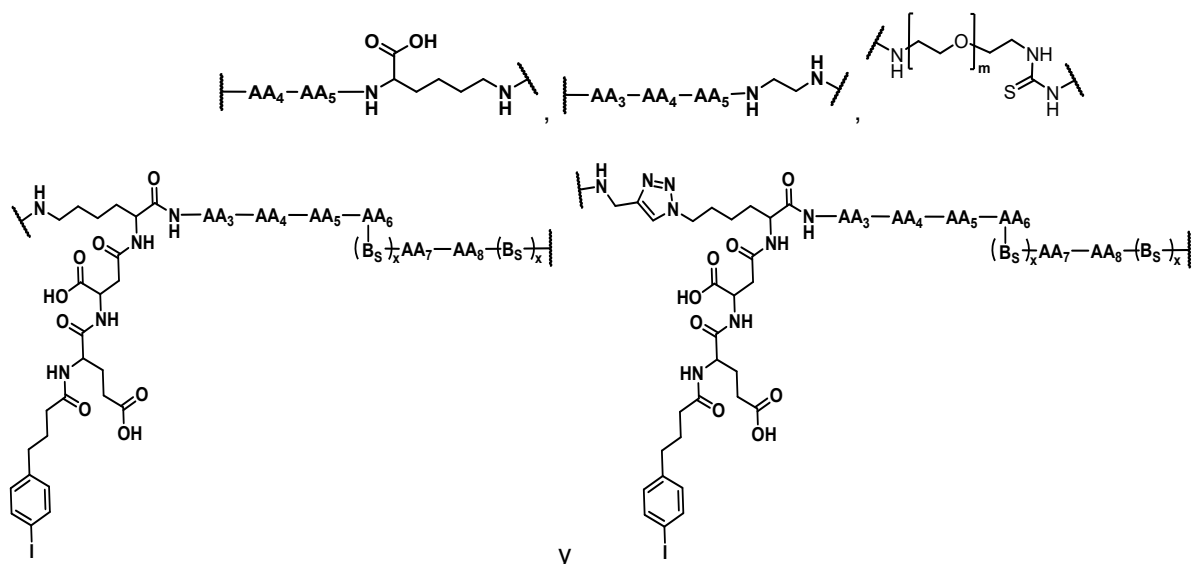
60. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 59, en donde la fracción **B** tiene una de las siguientes estructuras:

enlace simple, (BS)_x,









cada n es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8;

cada m es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4;

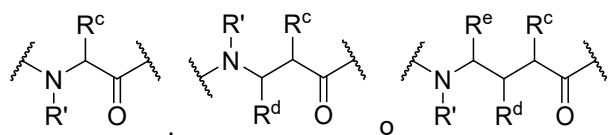
cada Rc, Rd y Re se selecciona independientemente de H, alquilo C1-6 opcionalmente sustituido, (carbociclilo C3-10)alquilo C1-6, (arilo C6-10) alquilo C1-6, (heterociclilo C1-10)alquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6 y arilo C6-10, en cada uno de los cuales opcionalmente uno o más de los átomos de carbono pueden ser reemplazados por heteroátomos; preferiblemente seleccionados de residuos de cadenas laterales de aminoácidos proteínogénicos o no proteínogénicos;

cada ocurrencia de R y R' es independientemente H o seleccionada de -alquiloC1-6, O(alquiloC1-6), S(-alquiloC1-6), cicloalquilo C3-10, O(cicloalquilo C3-10), S(cicloalquiloC3-10), alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, heteroalquenilo C1-6, heteroalquinilo C1-6, cicloalquenilo C3-10, cicloheteroalquenilo C1-10, arilo C6-10, heteroarilo C1-10, (ariloC6-10)alquilo C1-6 y (heteroariloC1-10)alquiloC1-6, cada uno de los cuales puede ser sustituido opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados de -alquiloC1-6, OH, oxo y halógeno, o de OH, oxo y halógeno;

en donde cada uno de AA3, AA4, AA5, AA6, AA7 y AA8 representa un aminoácido proteínogénico o no proteínogénico, o está ausente;

en donde preferiblemente:

cada aminoácido proteínogénico o no proteínogénico preferiblemente se representa independientemente mediante una de las siguientes estructuras:



y/o AA4 es un aminoácido con una cadena lateral cargada, y AA7 es un aminoácido con una cadena lateral alifática;

en donde más preferiblemente:

AA3 se selecciona de Asp, Glu y Lys, o está ausente; preferiblemente Asp;

AA4 se selecciona de Arg, HomoArg, Lys, Asp y Glu, o está ausente; preferiblemente Lys o Arg;

AA5 se selecciona de Asp, Glu y Lys; preferiblemente Asp;

AA6 se selecciona de Cys, Lys, Gly y Val; preferiblemente Cys o Lys;

AA7 se selecciona de Gly, Ala, Val, Arg, Ile, Pro; preferiblemente Gly o Val; y

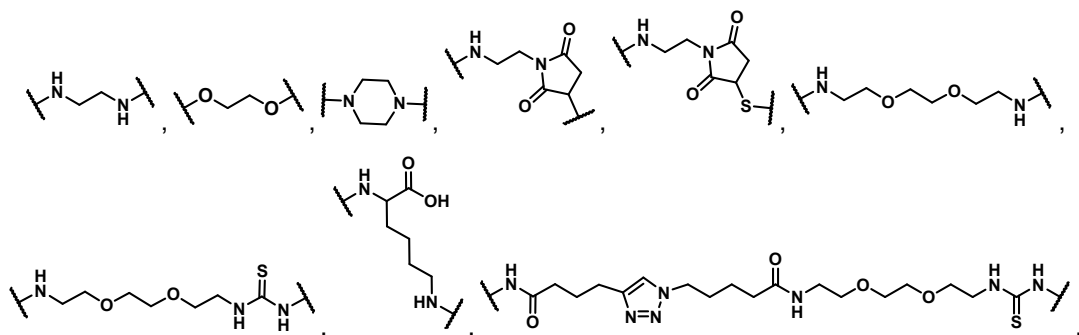
AA8 se selecciona a partir de Pro y citrulina (Cit); preferiblemente Pro

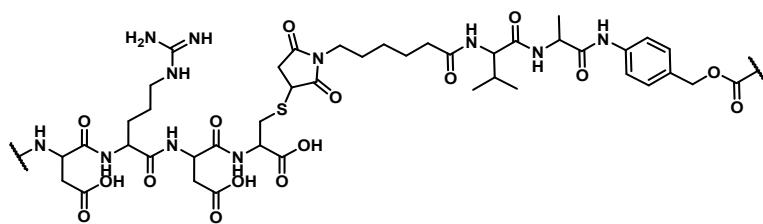
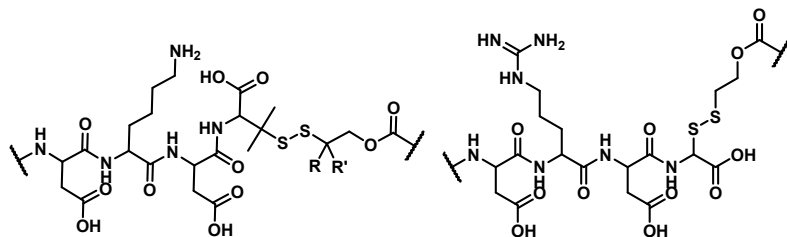
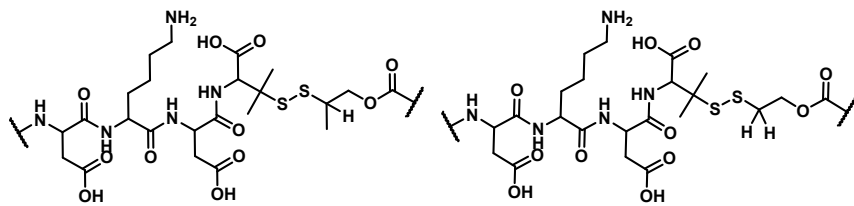
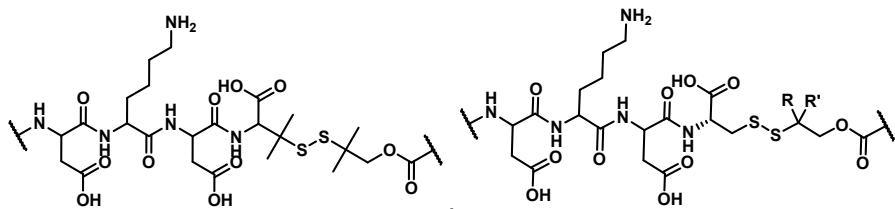
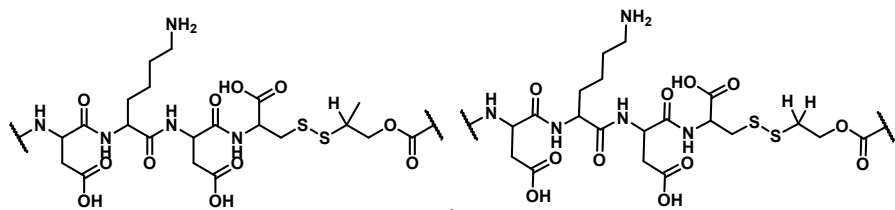
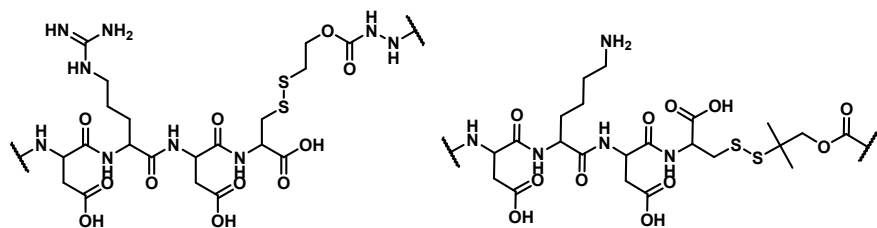
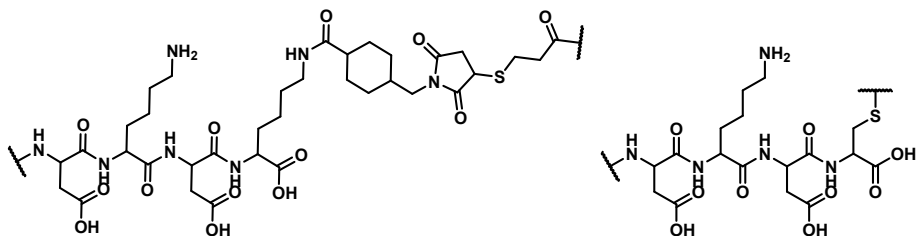
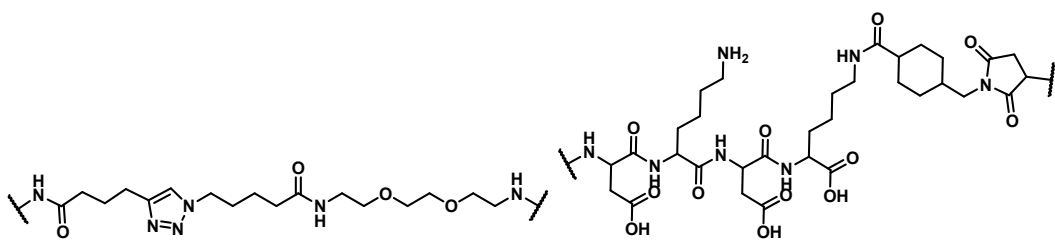
aún más preferiblemente, de acuerdo con una de las secuencias que se muestran en la tabla:

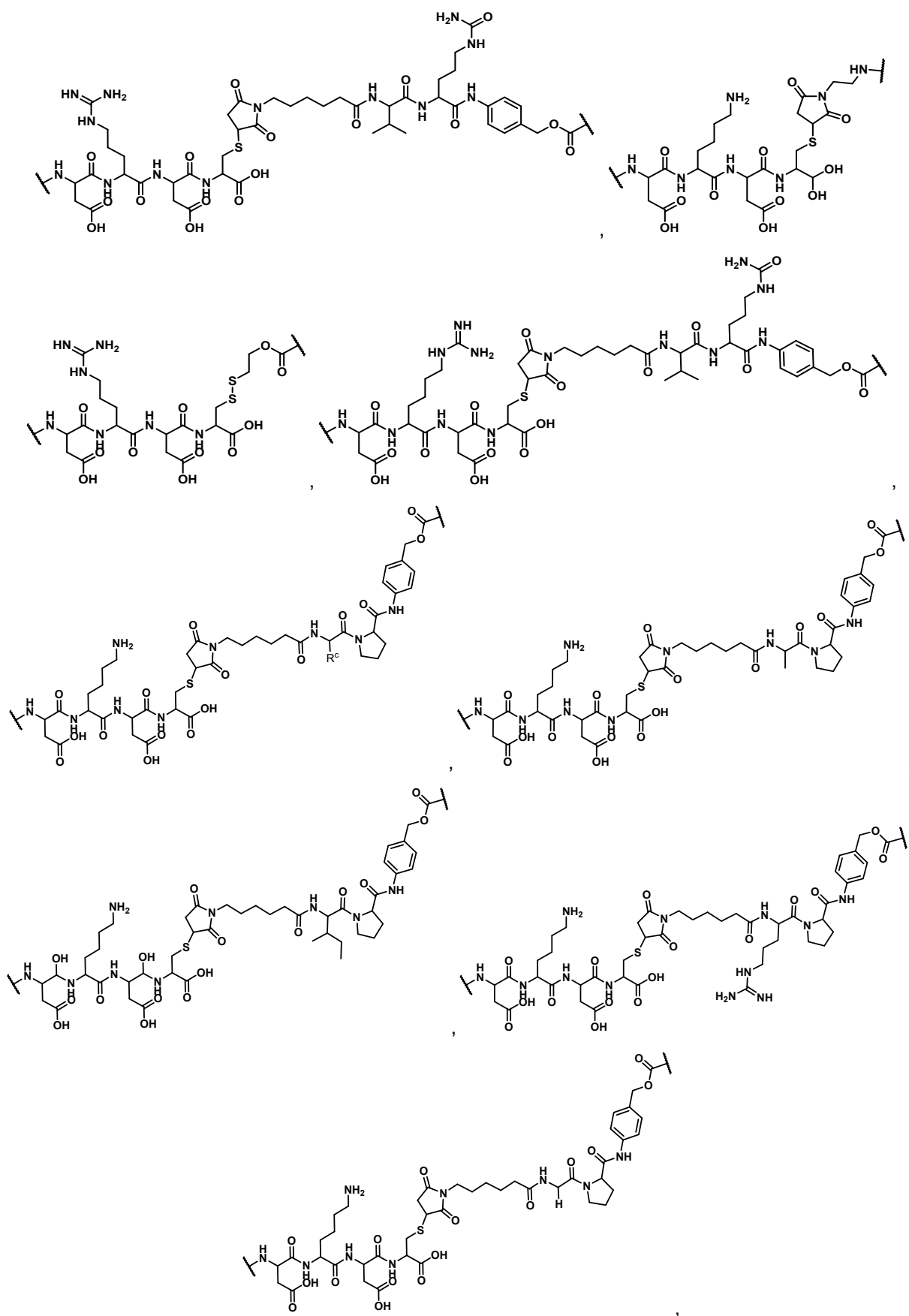
AA3	AA4	AA5	AA6	AA7	AA8	AA3	AA4	AA5	AA6	AA7	AA8
-	-	-	Lys	-	-						
Asp	Arg	Asp	Cys	-	-	Asp	Lys	Asp	Cys	Ala	Pro
Asp	Arg	Asp	Gly	-	-	Asp	Lys	Asp	Cys	Ala	Val
Asp	Lys	Asp	Lys	-	-	Asp	Lys	Asp	Cys	Arg	Pro
Asp	Lys	Asp	Val	-	-	Asp	Lys	Asp	Cys	Gly	Pro
Asp	Arg	Asp	Cys	Val	Ala	Asp	Lys	Asp	Cys	Ile	Pro
Asp	Arg	Asp	Cys	Val	Cit	Asp	Lys	Asp	Cys	Pro	Pro
Asp	HomoArg	Asp	Cys	Val	Cit	Asp	Lys	Asp	Cys	Val	Cit
Asp	Lys	Asp	Cys	cualquier AA	Pro	Asp	Lys	Asp	Cys	Val	Pro
				cualquier AA	Pro					cualquier AA	Cit
				Gly	Pro					Val	Cit
				Val	Pro						

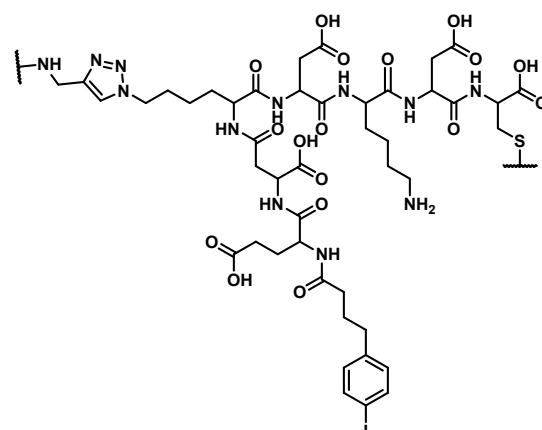
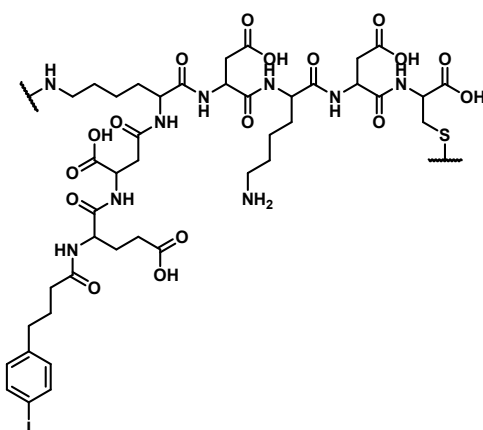
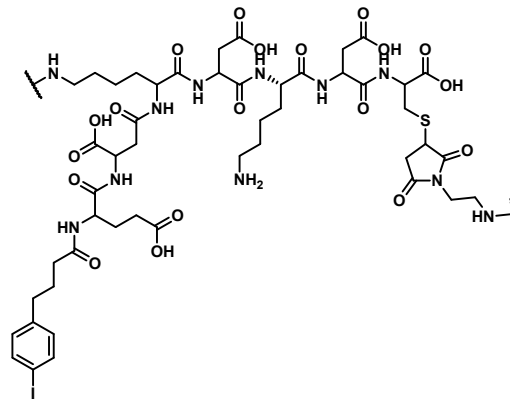
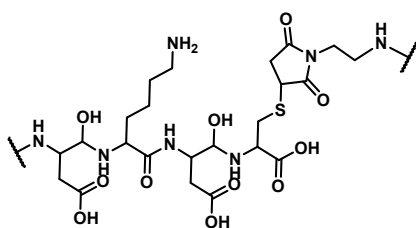
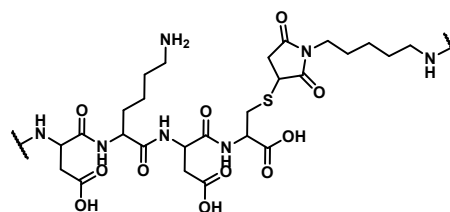
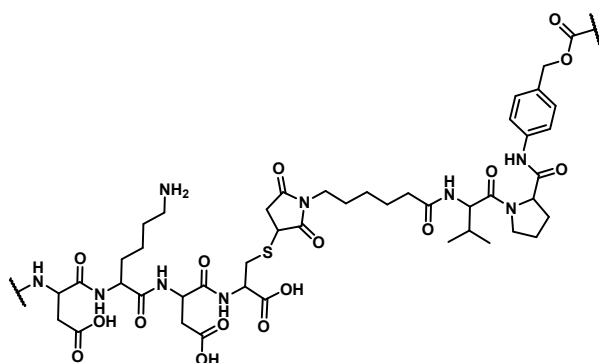
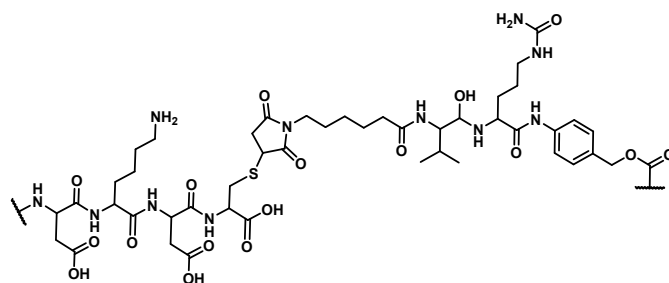
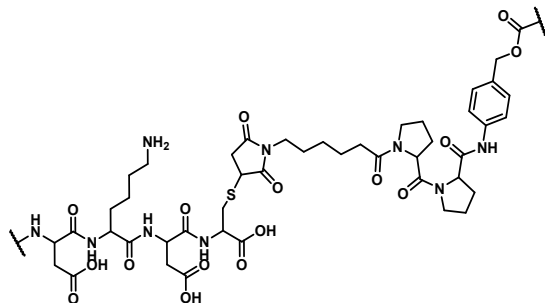
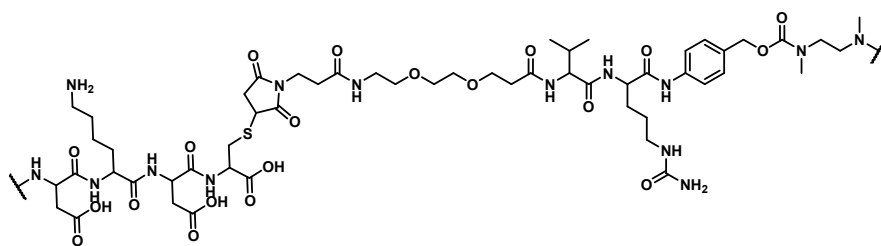
61. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 60, en donde la fracción **B** tiene una de las siguientes estructuras:

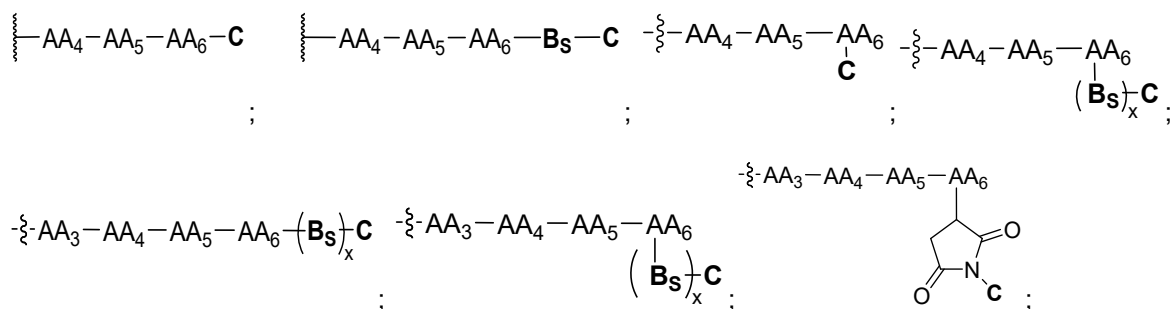
enlace simple,

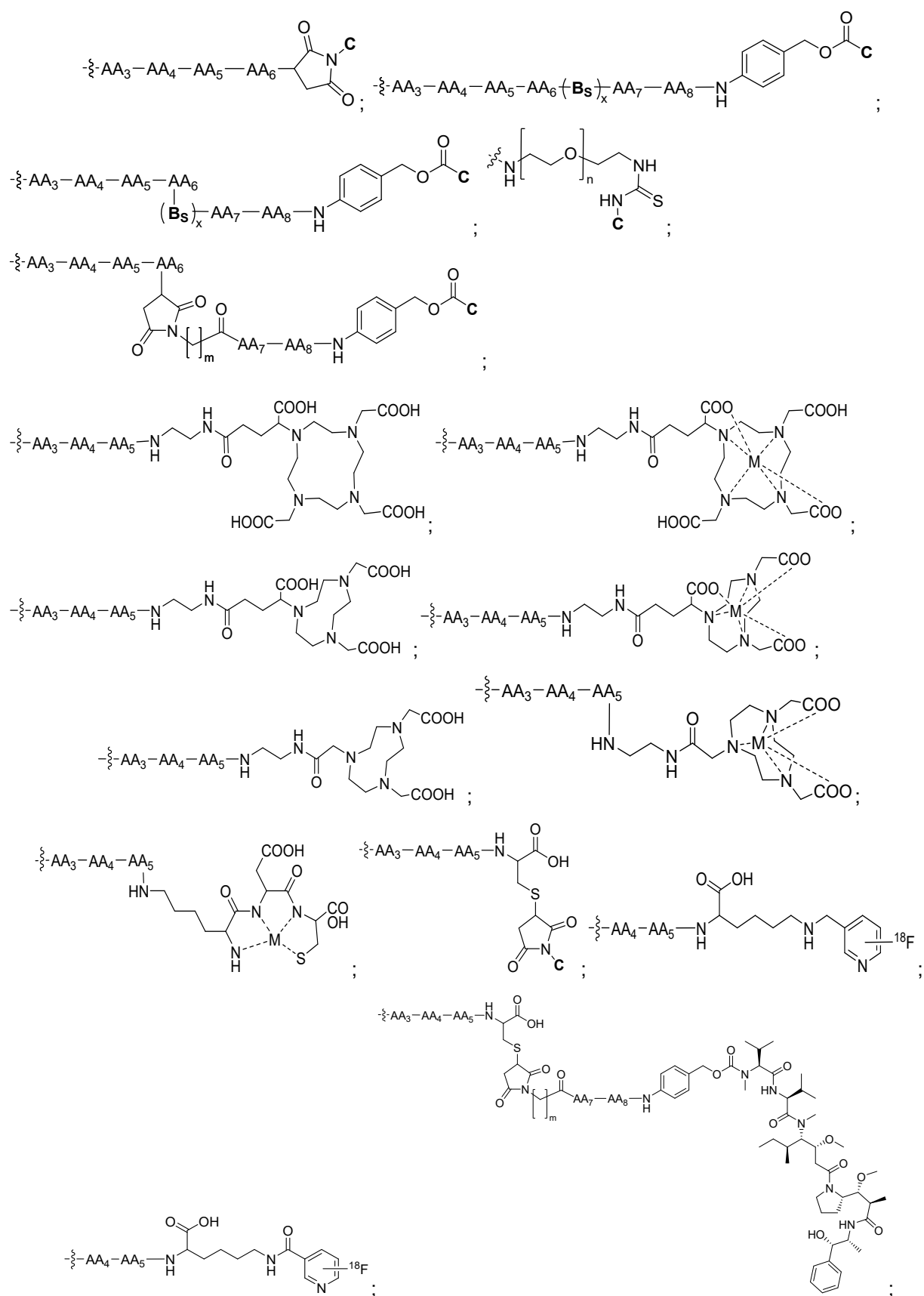


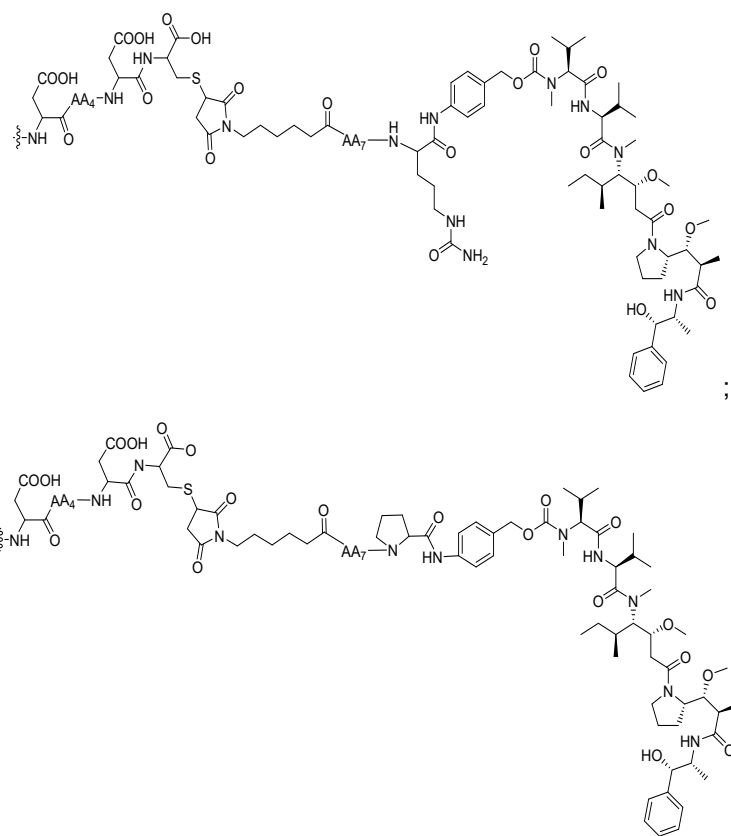




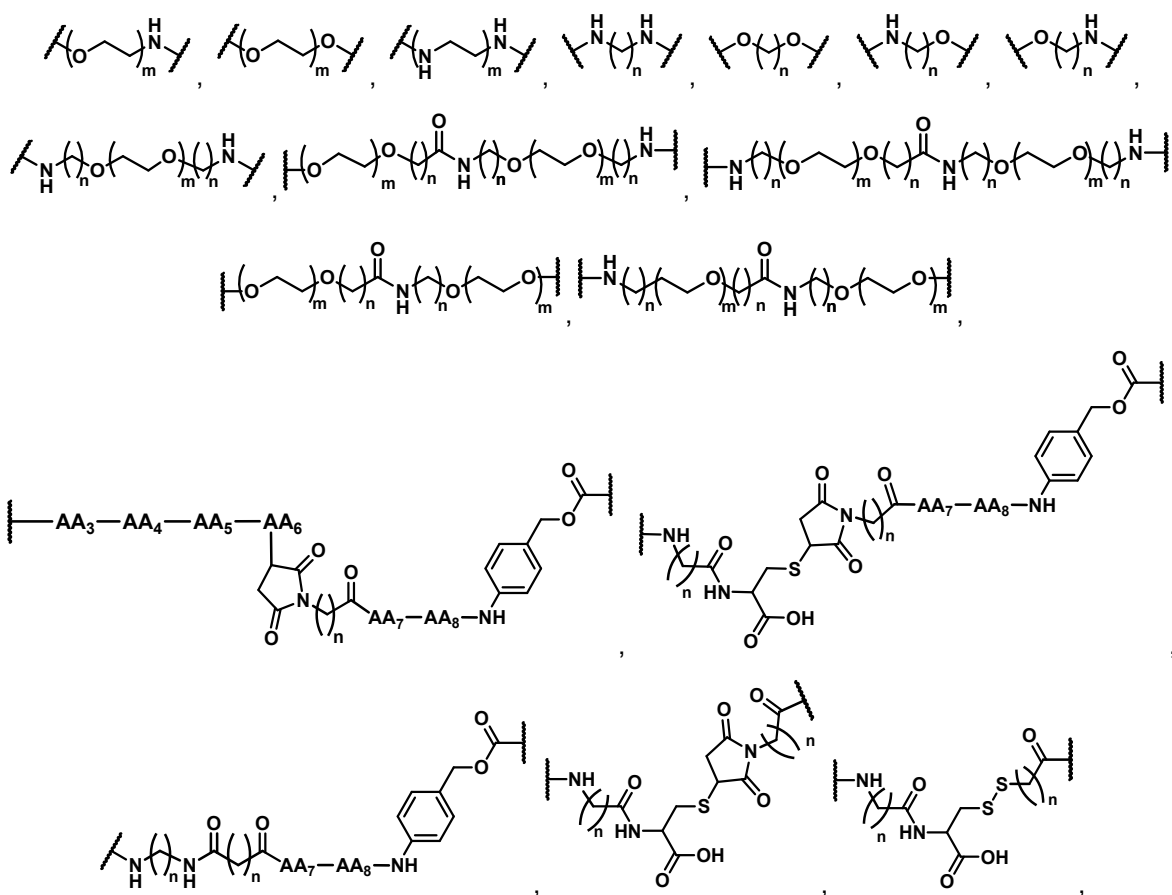


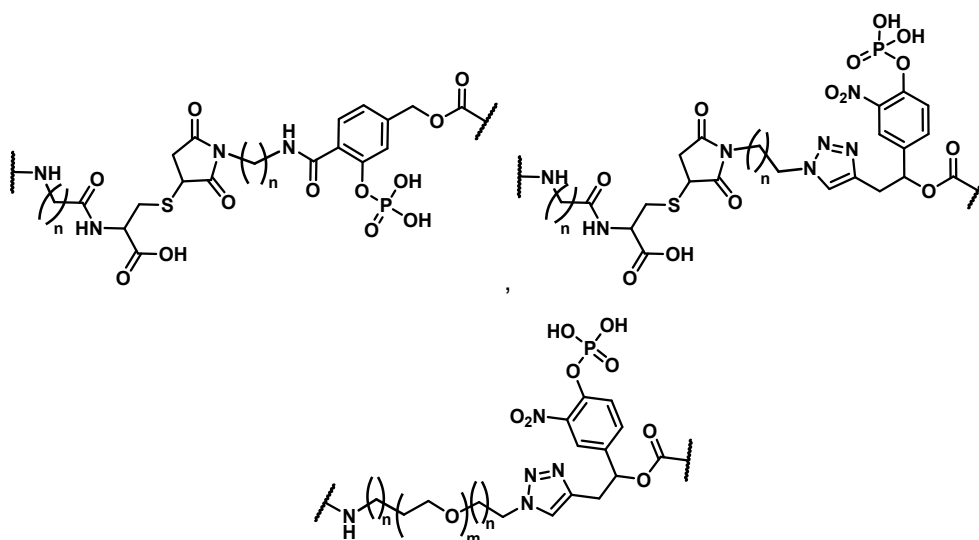






64. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 63, en donde B se selecciona de:





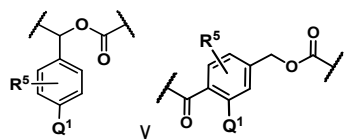
en donde:

cada uno de AA3, AA4, AA5, AA6, AA7 y AA8 representa un aminoácido proteinogénico o no proteinogénico, o está ausente; preferiblemente en donde AA3 se selecciona de Asp, Glu y Lys, o está ausente; más preferiblemente Asp; preferiblemente en donde AA4 se selecciona de Arg, HomoArg, Lys, Asp y Glu, o está ausente; más preferiblemente Lys o Arg; preferiblemente en donde AA5 se selecciona de Asp, Glu y Lys; más preferiblemente Asp; preferiblemente en donde AA6 se selecciona de Cys, Lys, Gly y Val; más preferiblemente Cys o Lys; preferiblemente en donde AA7 se selecciona de Gly, Ala, Val, Arg, Ile, Pro; más preferiblemente Gly o Val; preferiblemente en donde AA8 se selecciona de Pro y y Cit; más preferiblemente Pro;

cada n es independientemente 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8; y

cada m es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4.

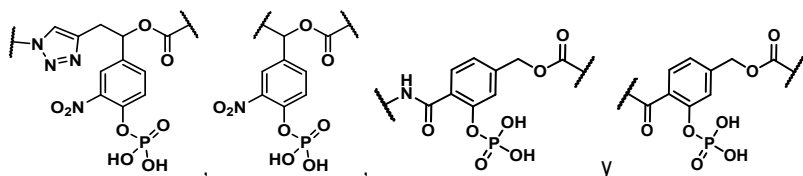
65. El compuesto de la reivindicación 52 o 58, en donde **B** es como se define en la reivindicación 64.
66. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 65, en donde **B** es un enlazador escindible, preferiblemente un enlazador enzimáticamente escindible.
67. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 66, en donde **B** comprende una unidad peptídica escindible capaz de ser escindida enzimáticamente por una o más proteasas en la superficie celular o las regiones extracelulares del tejido objetivo.
68. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 67, en donde **B** comprende una unidad peptídica escindible seleccionada de Gly-Pro, Ala-Pro, Val-Pro, Arg-Pro, Ile-Pro, Pro-Pro, Gly-Cit, Ala-Cit, Val-Cit, Arg-Cit, Ile-Cit y Pro-Cit; preferiblemente Gly-Pro o Val-Cit.
69. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 68, en donde comprende una unidad escindible que puede ser escindida enzimáticamente por una o más fosfatasa, sulfatasa o esterasas.
70. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 51 a 69, en donde **B** comprende una unidad escindible seleccionada de:



en donde Q^1 se selecciona independientemente de OPO_3H_2 , $OPO_2N(R)_2$, OPO_2NH_2 , $OPO(OH)F$, $OC(O)OR$, $OC(O)R$, OSO_3H , $OSO_2N(R)_2$ y OSO_2NH_2 ; preferiblemente OPO_3H_2 , $OC(O)OH$ o OSO_3H , más preferiblemente OPO_3H_2 ; lo más preferiblemente OPO_3H_2 ;

R_5 se selecciona independientemente de H, un grupo atractor de electrones, preferiblemente de H, NO_2 , CN, halógeno, $C(O)R$, CF_3 y SO_3H , más preferiblemente de H y NO_2 .

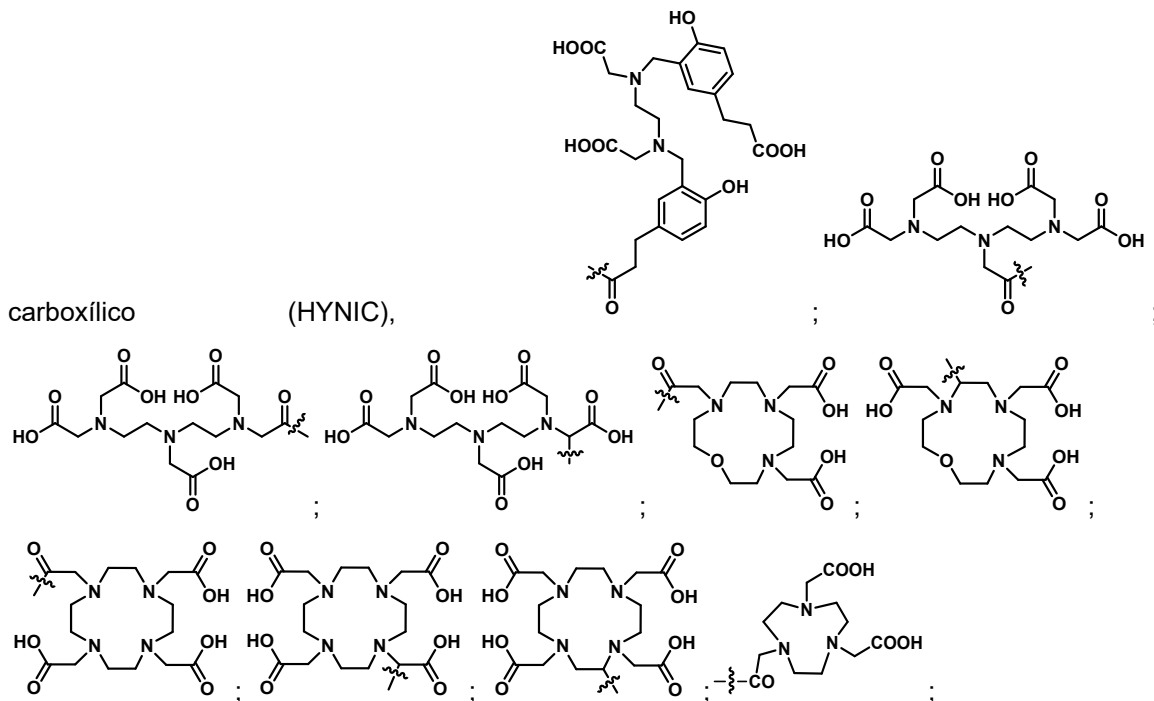
71. El compuesto de la reivindicación 70, en donde **B** comprende una unidad escindible seleccionada de:

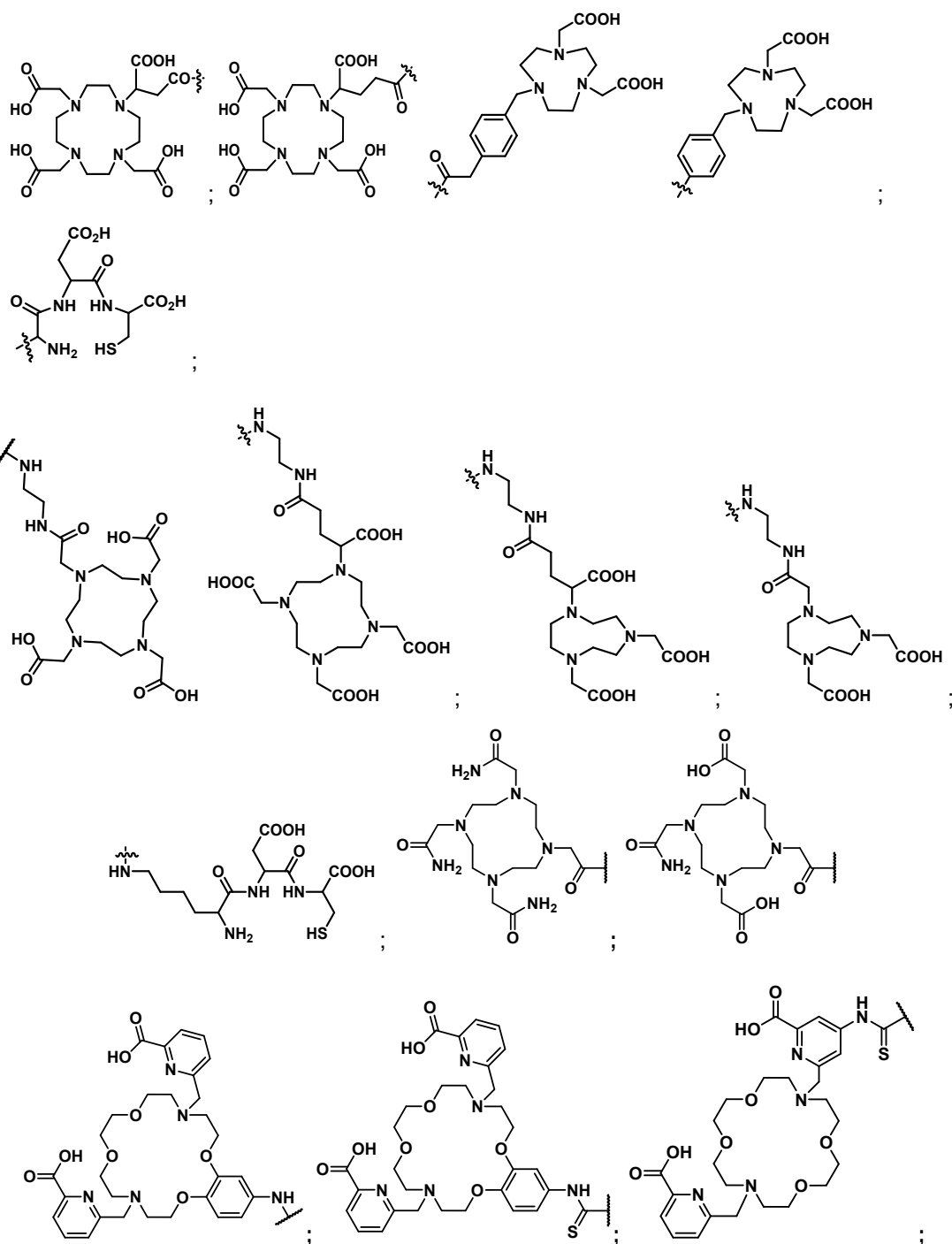


72. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 71, en donde la fracción **C** es un grupo agente quelante adecuado para el marcaje radiactivo; un grupo radiactivo que comprende un radioisótopo; un quelato de un isótopo radiactivo con un agente quelante; un grupo fluoróforo; un agente citotóxico y/o un agente citostático; un agente inmunomodulador; o una proteína,

en donde preferiblemente:

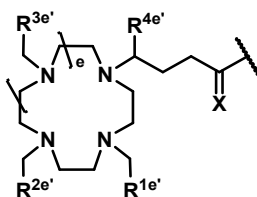
(a) el grupo de agentes quelantes adecuados para el radiomarcaje se selecciona de coloide de azufre, ácido dietilentriaminopentaacético (DTPA), ácido etilendiaminotetraacético (EDTA), ácido 1,4,7,10-tetraazaciclododecano-N,N',N'',N'''-tetraacético (DOTA), ácido 1,4,7-triazaciclononano-N,N',N''-triácético (NOTA), ácido 1,4,8,11-tetraazaciclotetradecano-N,N',N'',N'''-tetraacético (TETA), ácido iminodiacético, bis(carboximetilimidazol)glicina, ácido 6-hidrazinopiridina-3-





O

tiene una estructura de acuerdo con la siguiente fórmula:



en donde:

e es 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 1;

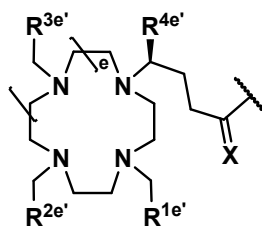
R1e' es independientemente H, COOH, CONH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

R2e' es independientemente H, COOH, CONH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

cada R3e' es independientemente H, CONH₂, COOH, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

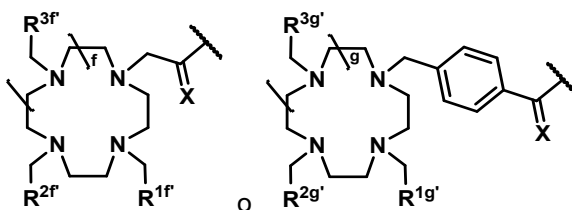
R4e' es independientemente H, COOH, CONH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH; y

X es O, NH o S; preferiblemente O;



preferiblemente que tiene la configuración ; o

tiene una estructura de acuerdo con las siguientes fórmulas:



en donde:

cada uno de f y g es independientemente 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 1;

R1f' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

R2f' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

R3f' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH; y

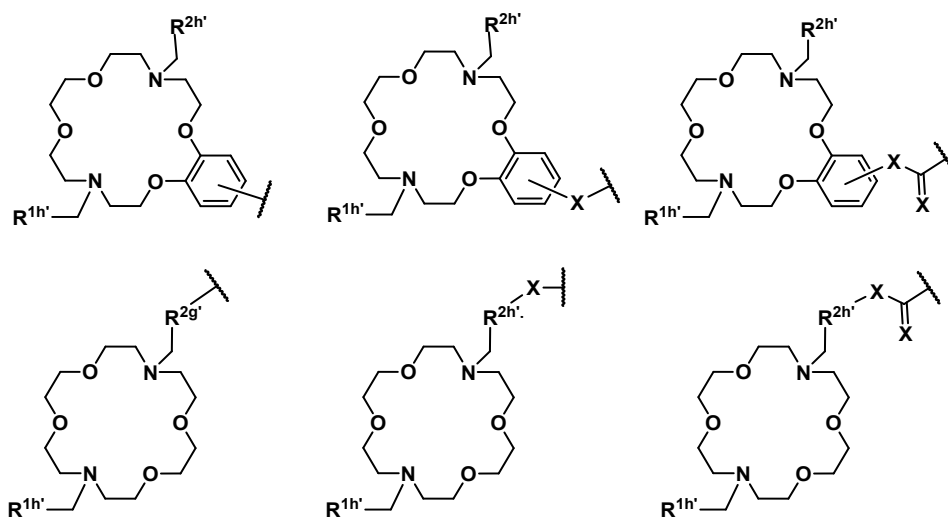
R1g' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

R2g' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH;

R3g' es independientemente H, COOH, C(O)NH₂, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH; y

X es O, NH o S; preferiblemente O; o

tiene una estructura que se ajusta a cualquiera de las siguientes fórmulas:

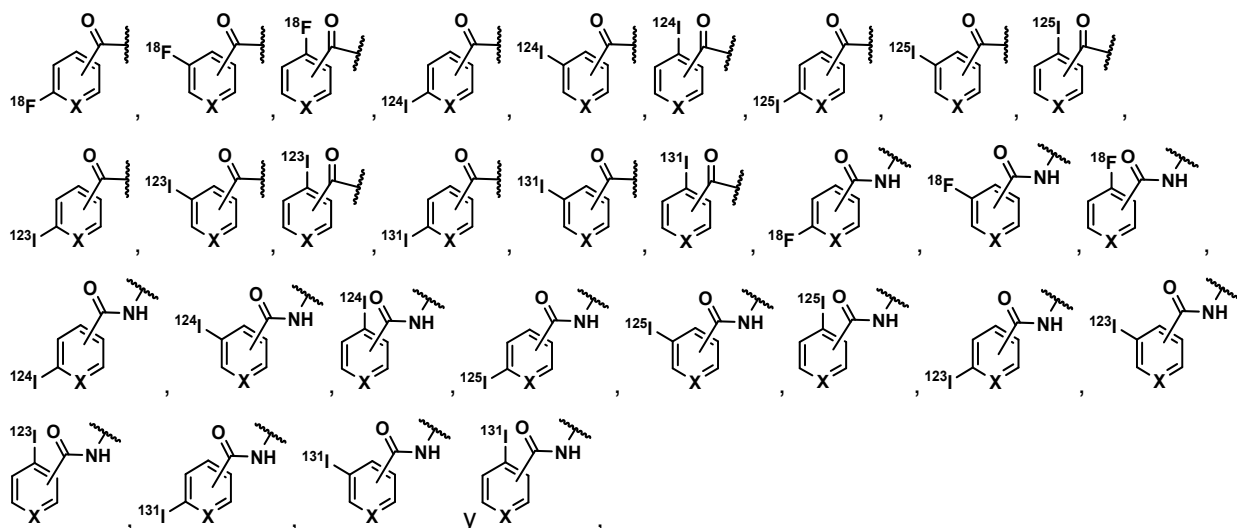


en donde:

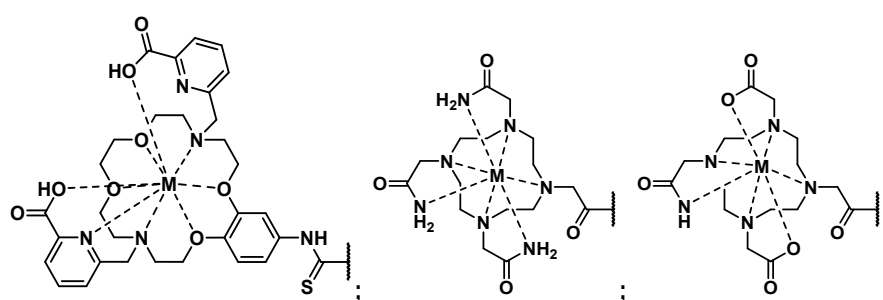
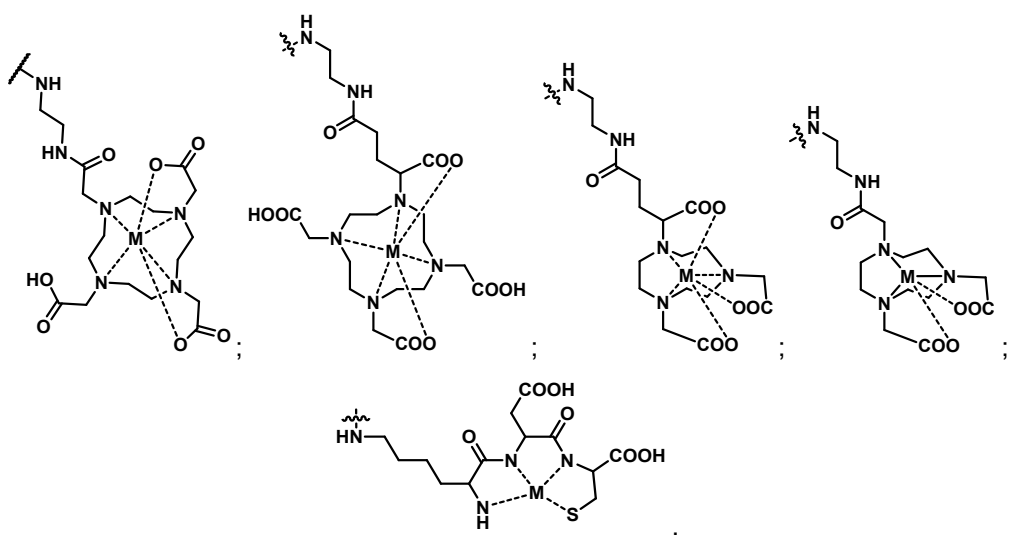
R1h' y R2h' se seleccionan independientemente de COOH, CONH₂, aril-COOH, heteroaril-COOH, heteroaril-CH₂COOH, en donde el heteroarilo es preferiblemente piridinilo; y cada X es independientemente O, NH o S; o

- (b) el grupo radiactivo que comprende un radioisótopo se selecciona de ²²³Ra, ⁸⁹Sr, ^{94m}Tc, ^{99m}Tc, ¹⁸⁶Re, ¹⁸⁸Re, ²⁰³Pb, ²¹²Pb, ⁶⁷Ga, ⁶⁸Ga, ⁴⁷Sc, ¹¹¹In, ⁹⁷Ru, ⁶²Cu, ⁶⁴Cu, ⁶⁵Cu, ⁶⁷Cu, ⁵⁴Cu, ⁸⁶Y, ⁸⁸Y, ⁹⁰Y, ¹²¹Sn, Al¹⁸F, ¹⁴⁹Tb, ¹⁵²Tb, ¹⁵⁵Tb, ¹⁶¹Tb, ¹⁵³Sm, ¹⁶⁶Ho, ¹⁰⁵Rh, ¹⁷⁷Lu, ¹²³I, ¹²⁴I, ¹²⁵I, ¹³¹I, ¹⁶F, ¹⁸F, ²¹¹At, ²²⁵Ac, ⁸⁹Sr, ²²⁵Ac, ^{117m}Sn, ¹⁶⁹Er, ²²⁷Th, ³H, ¹¹C, ^{11m}N, ¹³N, ⁸²Rb, ⁸⁹Zr y ³²P, o un nucleido seleccionado de ¹³⁹La, ⁶⁹Ga y ¹⁷⁵Lu; o

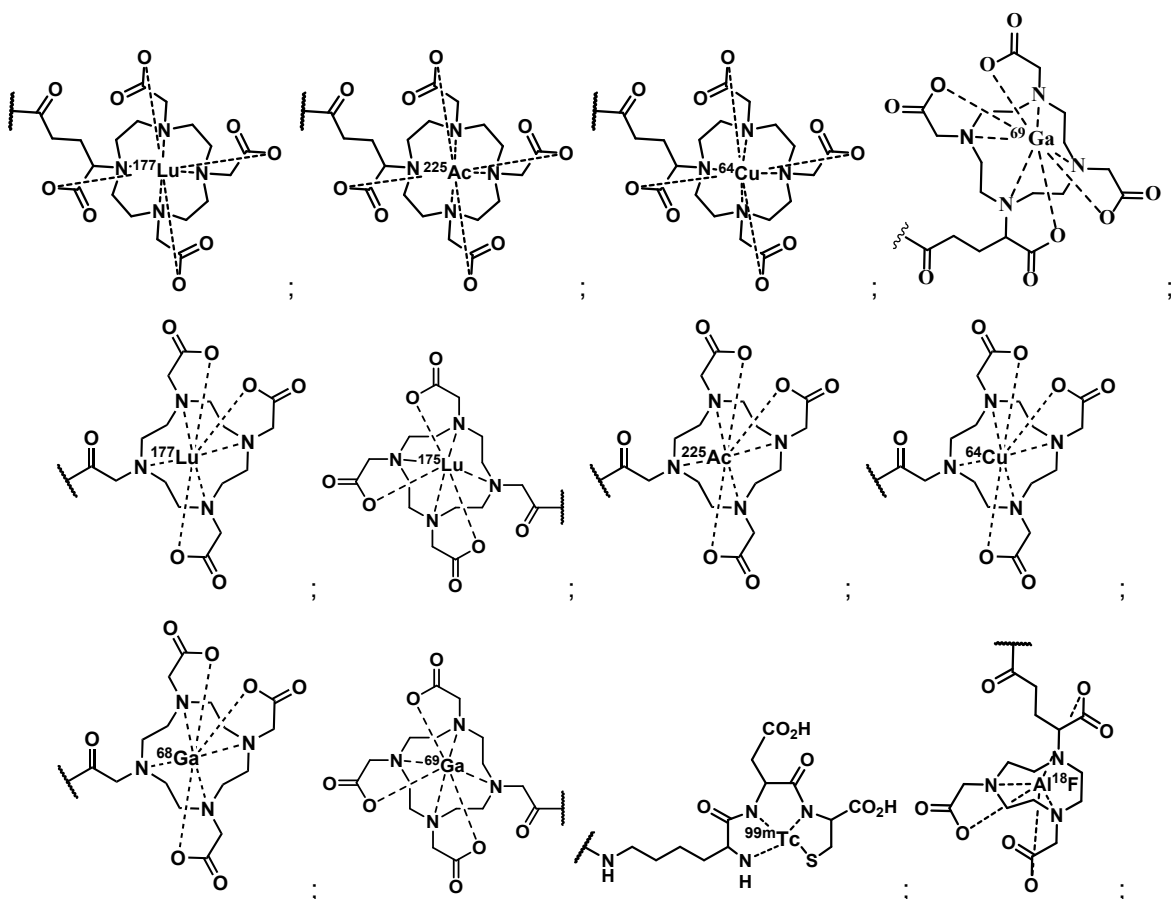
- (c) el quelato de un isótopo radiactivo es un quelato de un isótopo incluido en el apartado (b) anterior y/o con un agente quelante incluido en el apartado (a) anterior; o la fracción **C** es un grupo seleccionado de cualquiera de las siguientes estructuras:

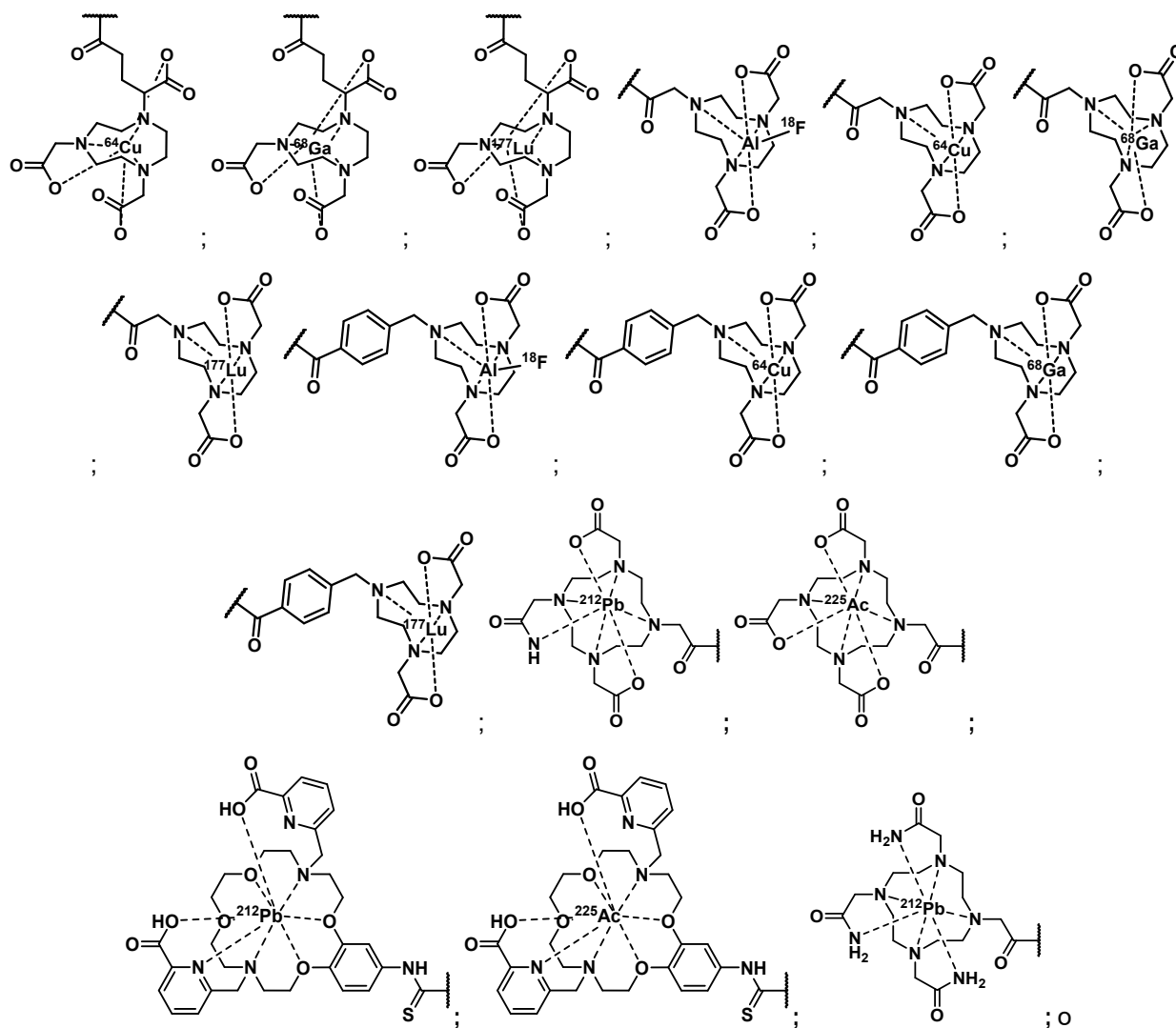


en donde X es CH o N;

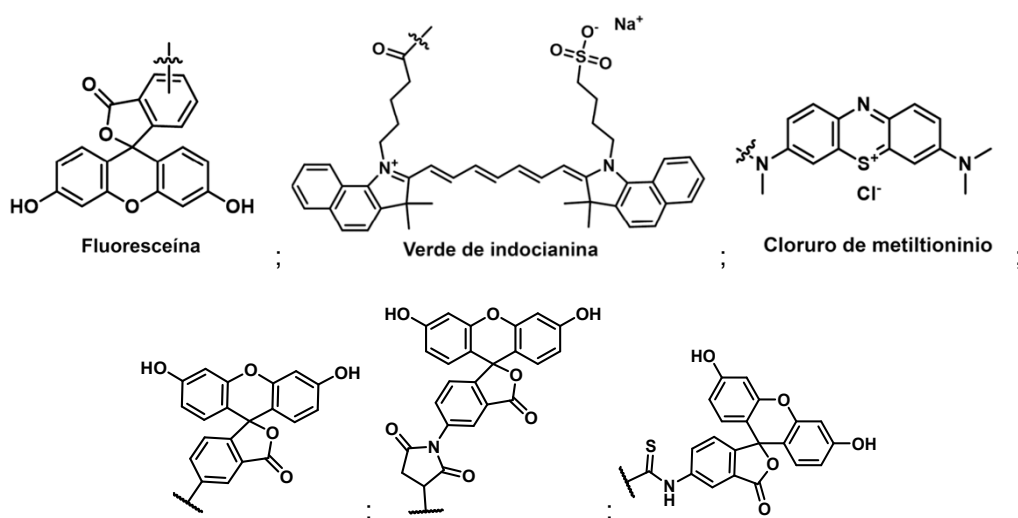


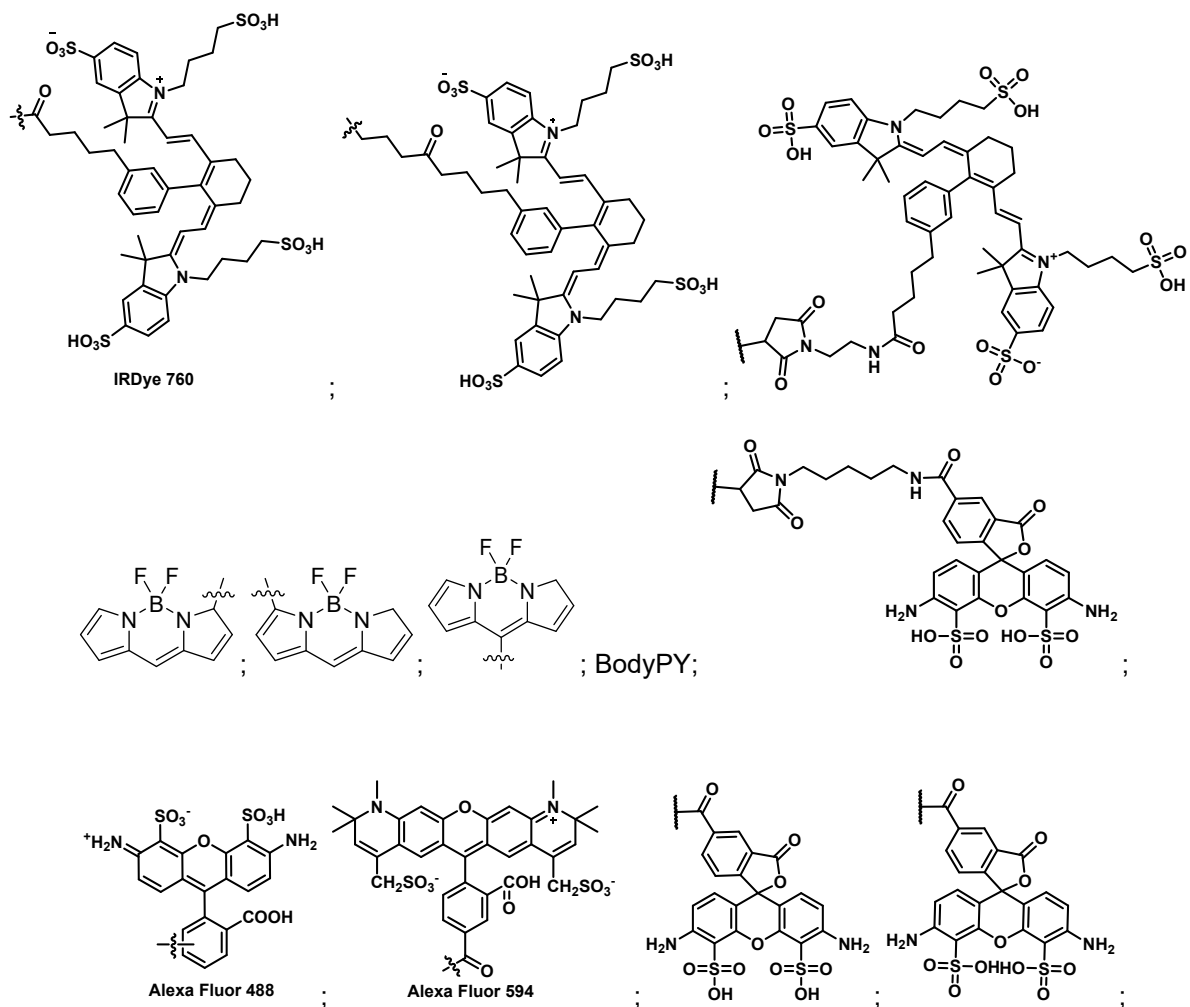
en donde M es un isótopo radiactivo; preferiblemente seleccionado de la lista del apartado (b) anterior; más preferiblemente:



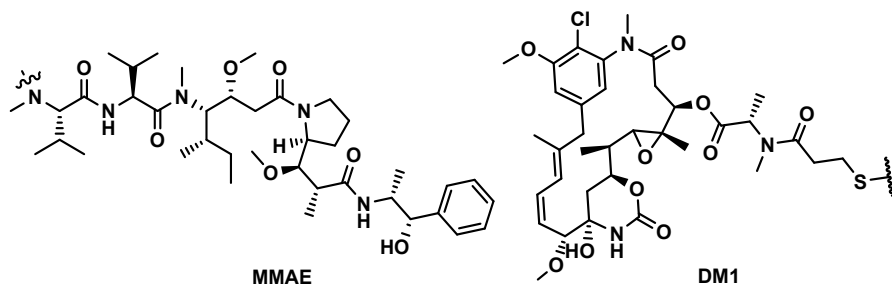


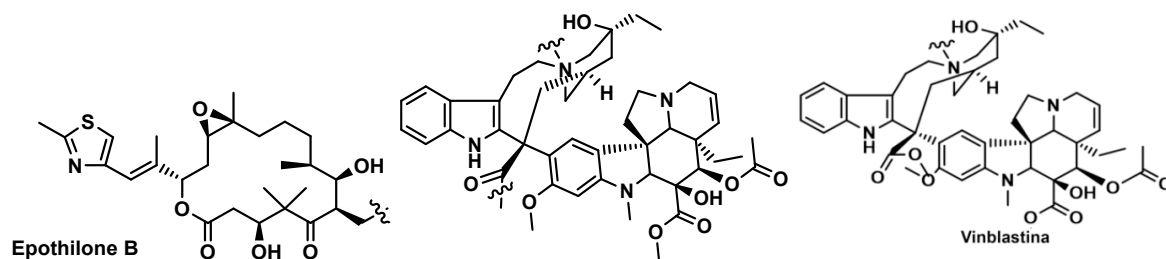
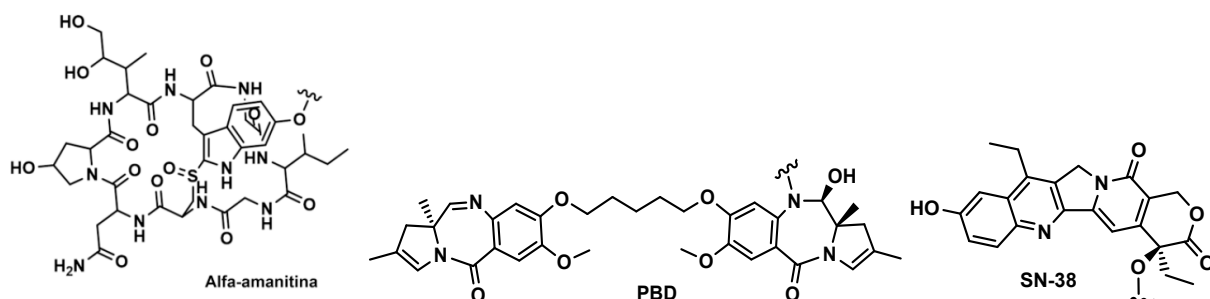
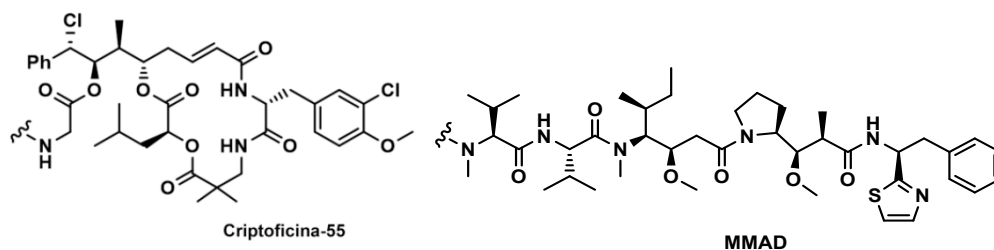
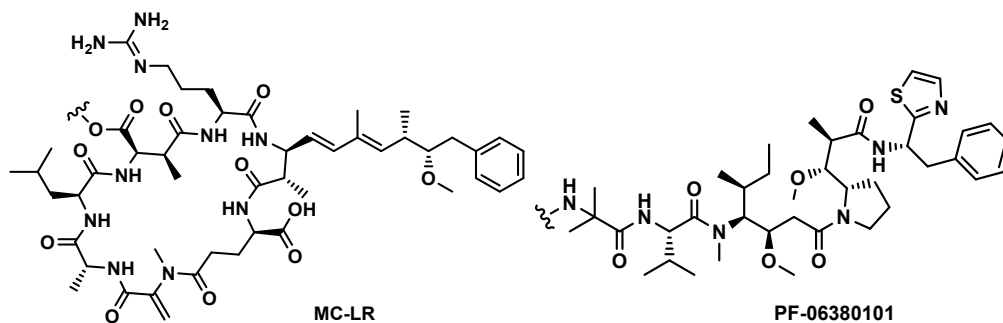
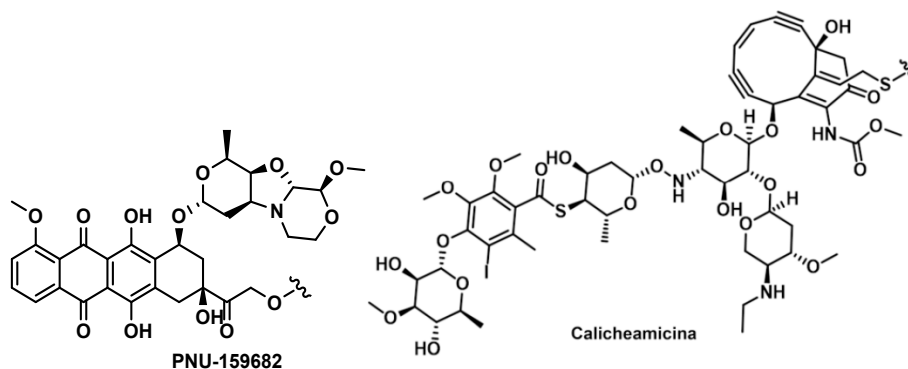
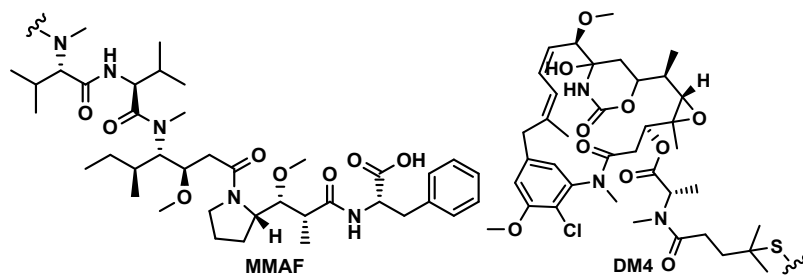
(d) el grupo fluoróforo se selecciona de un colorante de xanteno, un colorante de acridina, un colorante de oxazina, un colorante de cianina, un colorante de estililo, un colorante de cumarina, un colorante de porfina, un complejo metal-ligando fluorescente, una proteína fluorescente, nanocristales, un colorante de perileno, un colorante de borodipirrometeno y un colorante de ftalocianina; preferiblemente seleccionado de las siguientes estructuras:

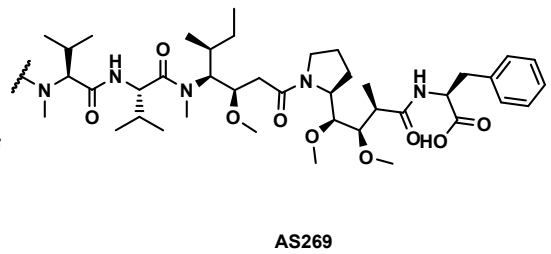
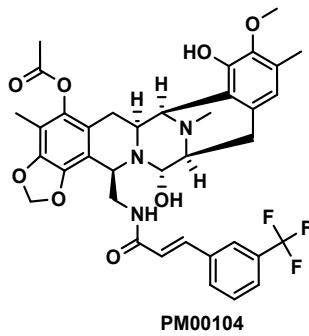
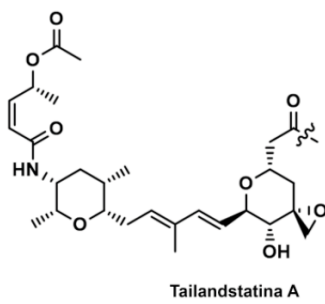
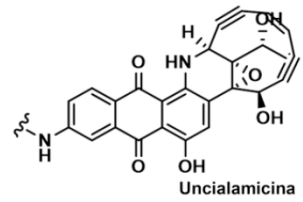
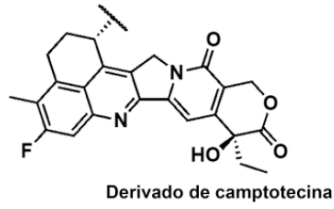
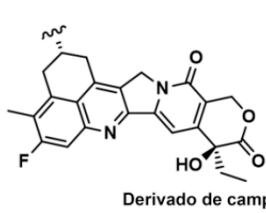
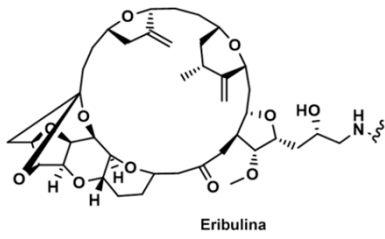
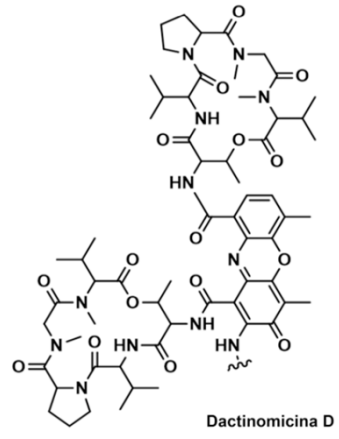
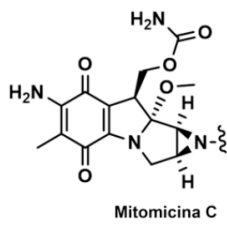
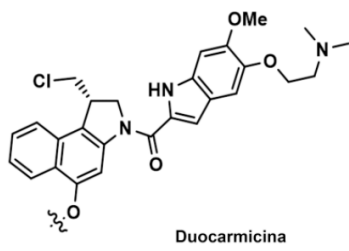
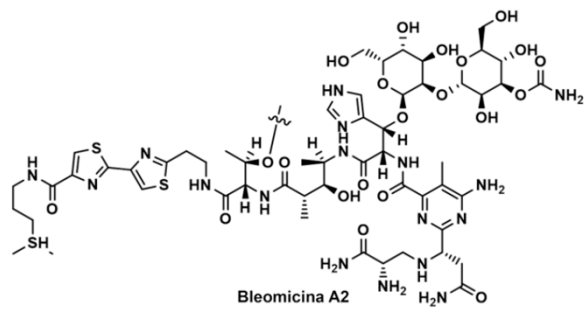
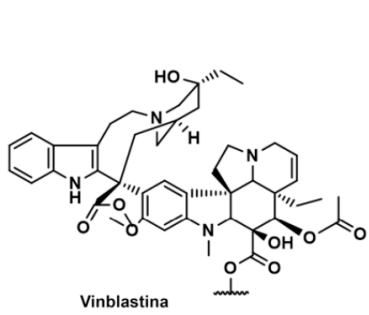


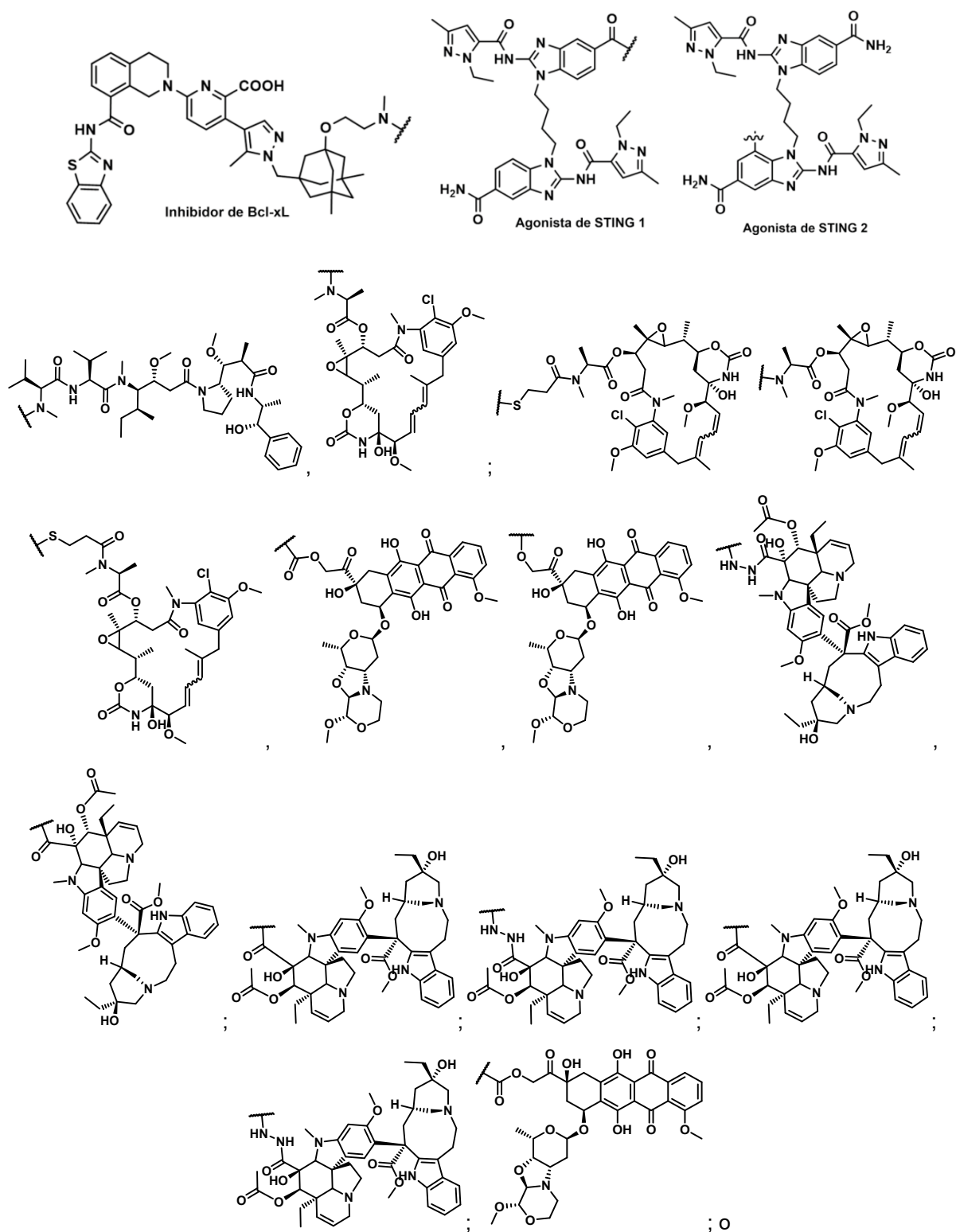


- (e) el agente citotóxico y/o citostático se selecciona de los agentes quimioterapéuticos seleccionados del grupo que consiste en inhibidores de la topoisomerasa, agentes alquilantes, antimetabolitos, antibióticos, disruptores mitóticos, agentes intercalantes del ADN, inhibidores de la síntesis de ADN, reguladores de la transcripción de ADN-ARN, inhibidores enzimáticos, reguladores genéticos, modificadores de la respuesta hormonal, citotoxinas selectivas para la hipoxia, inhibidores del factor de crecimiento epidérmico, agentes antivascuales y una combinación de dos o más de estos; preferiblemente seleccionado de las siguientes estructuras:

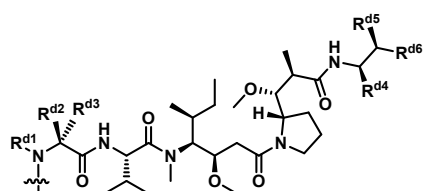








la fracción **C** es un derivado de la auristatina; preferiblemente que tiene una estructura de acuerdo con la siguiente fórmula:



en donde:

Rd1 es independientemente H o alquilo C1-C6; preferiblemente H o CH₃;

Rd2 es independientemente alquilo C1-C6; preferiblemente CH₃ o iPr;

Rd3 es independientemente H o alquilo C1-C6; preferiblemente H o CH₃;

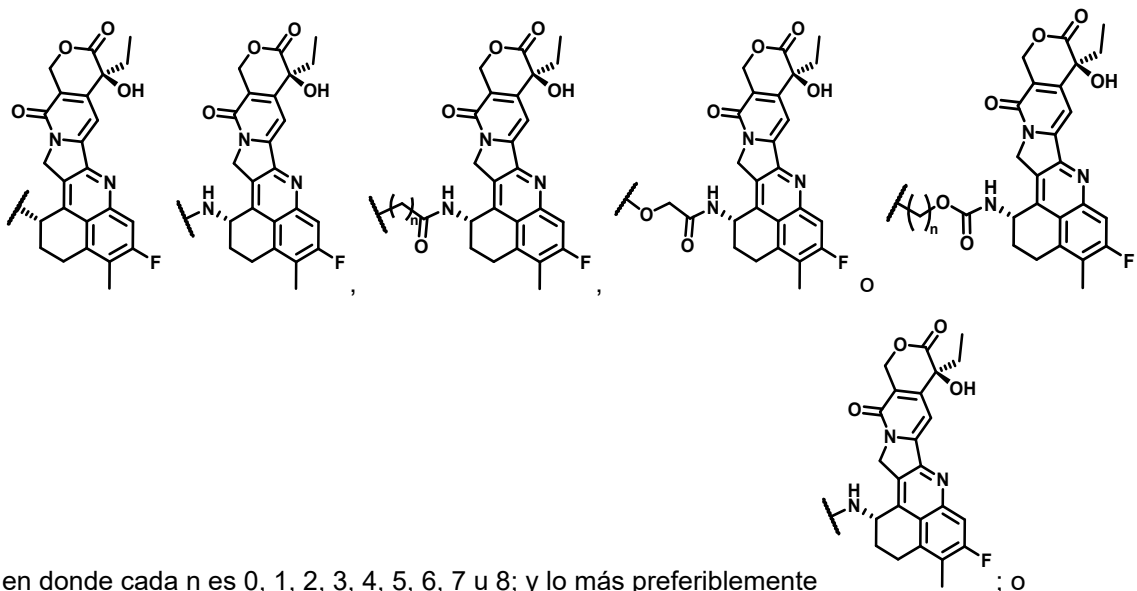
Rd4 es independientemente H, alquilo C1-C6, COO(alquilo C1-C6), CON(H o alquilo C1-C6), arilo C3-C10 o heteroarilo C3-C10; preferiblemente H, CH₃, COOH, COOCH₃ o tiazolilo;

Rd5 es independientemente H, OH, alquilo C1-C6; preferiblemente H u OH; y

Rd6 es independientemente arilo C3-C10 o heteroarilo C3-C10; preferiblemente fenilo o piridilo opcionalmente sustituidos,

en donde, preferiblemente, la fracción **C** se deriva de MMAE o MMAF; o

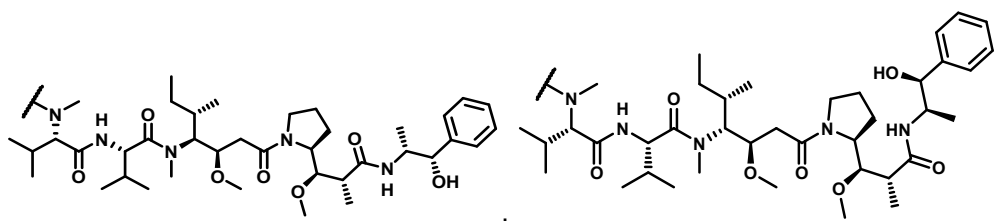
un inhibidor de la topoisomerasa; preferiblemente camptotecina (CPT) o uno de sus derivados; preferiblemente derivado (p. ej., mediante la sustitución de un átomo de hidrógeno) de topotecán, irinotecán, silatecán, cositecán, exatecán, lurtotecán, gimatecán, belotecán, rubitecán, deruxtecán, DXd; aún más preferiblemente exatecán; aún más preferiblemente

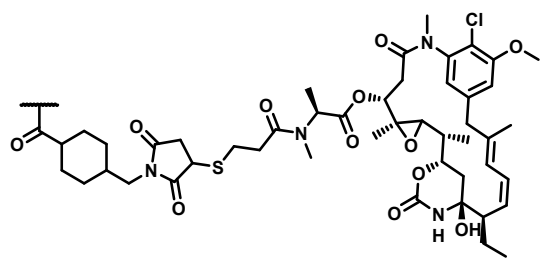
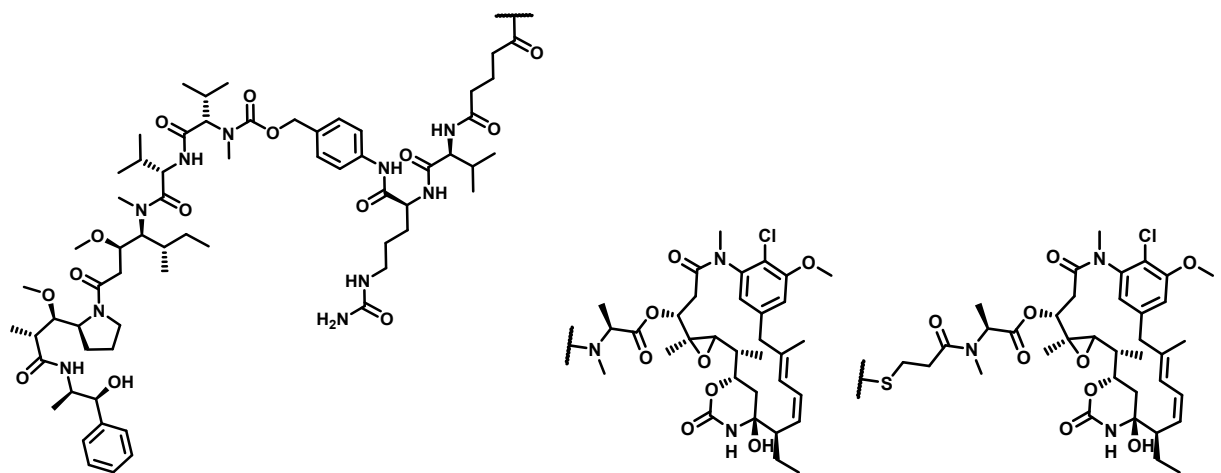
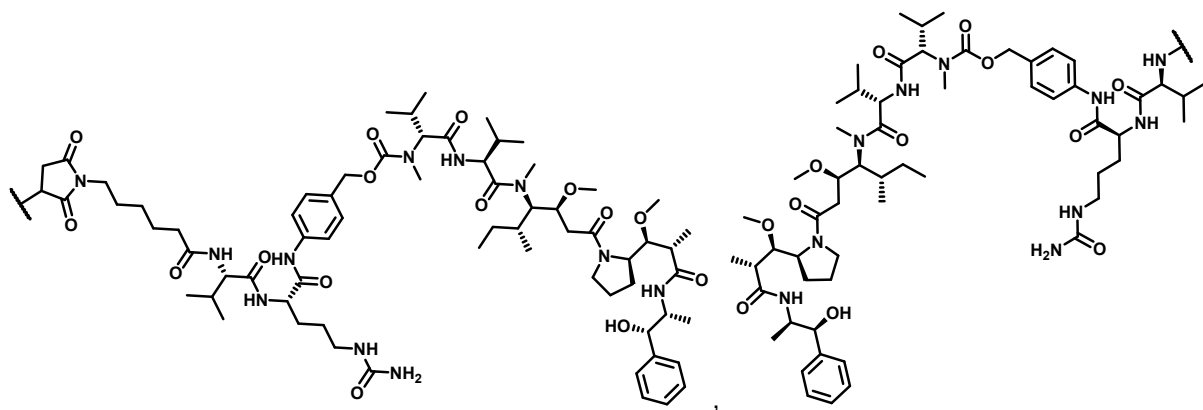
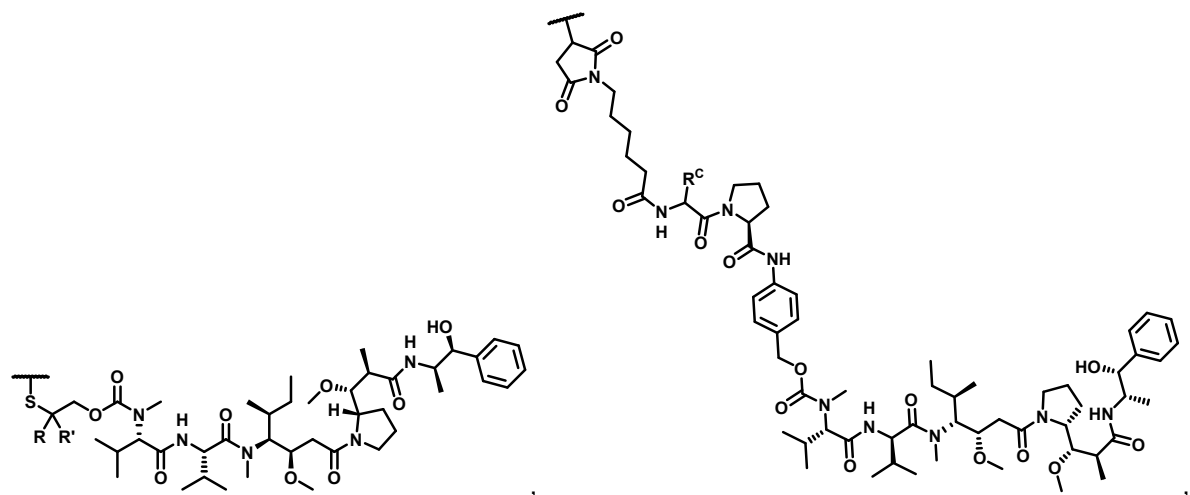


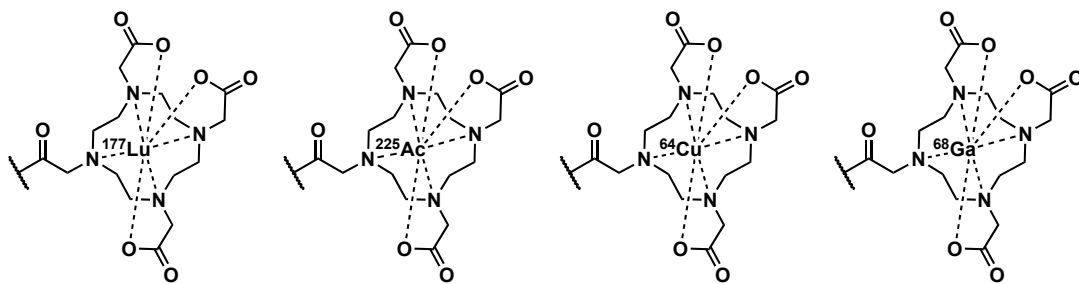
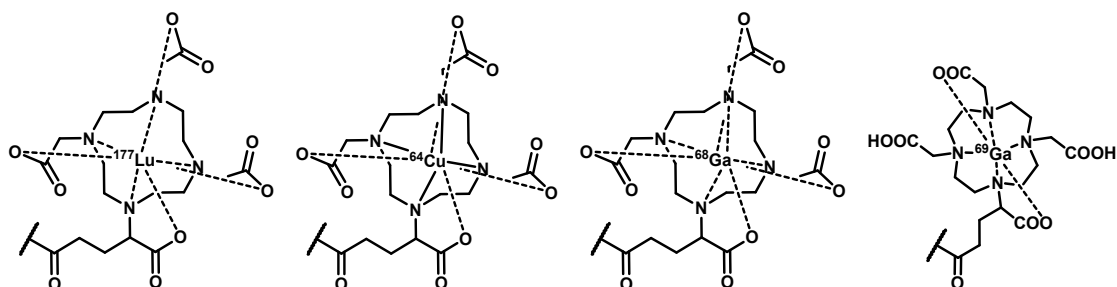
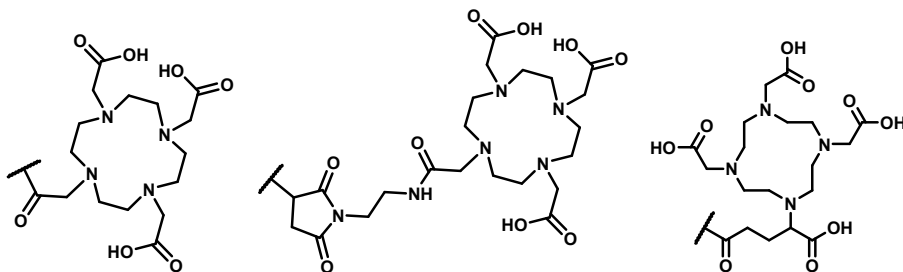
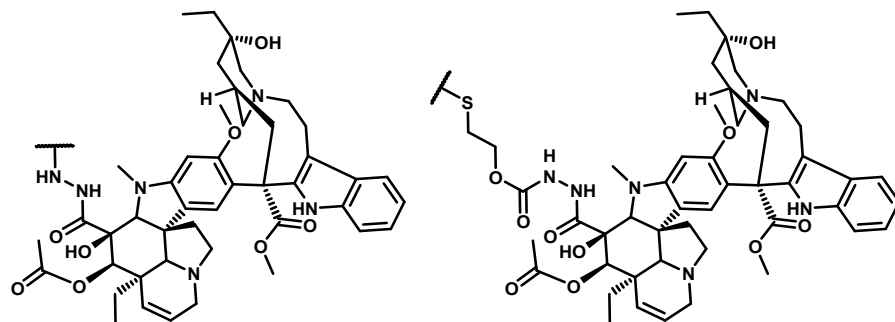
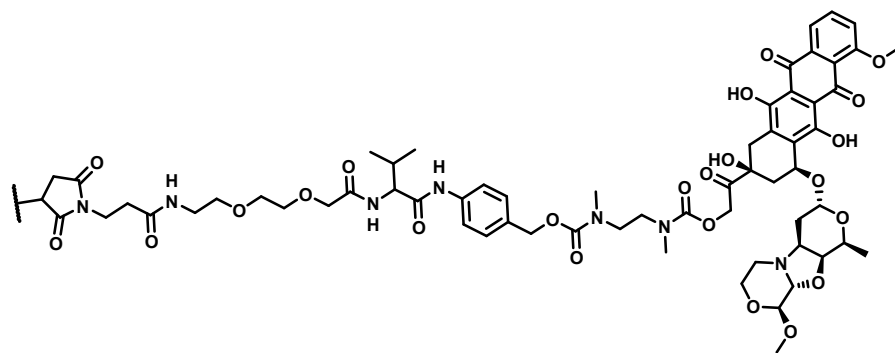
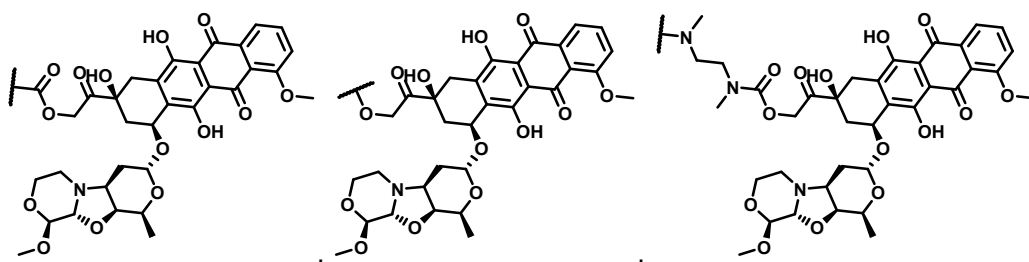
(f) el agente inmunomodulador se selecciona de moléculas conocidas por su capacidad para modular el sistema inmunitario, como ligandos de CD3, CD25, TLR, STING, 4-1BBL, 4-1BB, PD-1, mTor, PDL-1, NKG-2D IMiDs, en donde los ligandos pueden ser agonistas y/o antagonistas; o

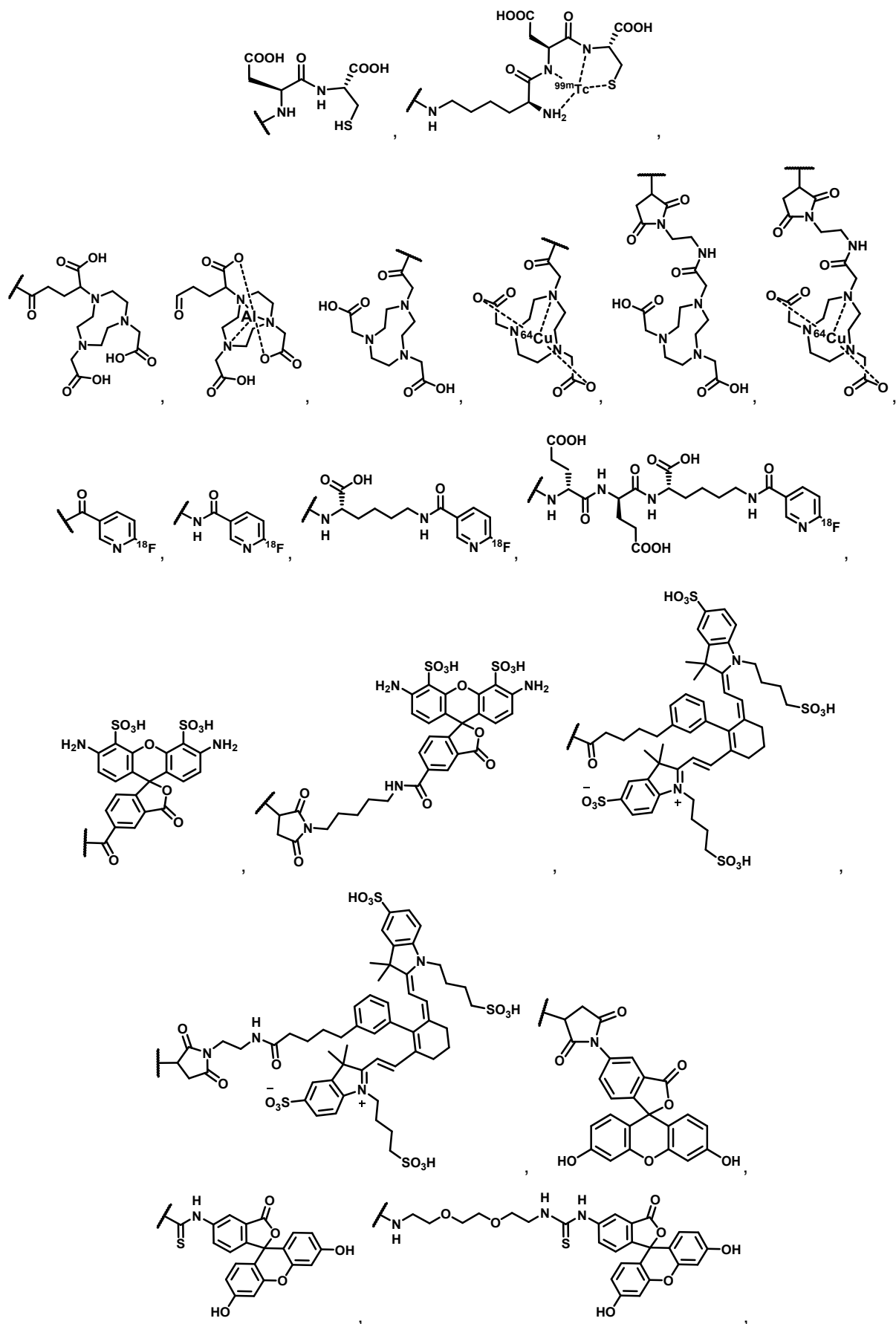
(g) la proteína se selecciona de citocinas, como IL2, IL10, IL12, IL15, TNF, interferón gamma, quimiocinas, anticuerpos y fragmentos de anticuerpos.

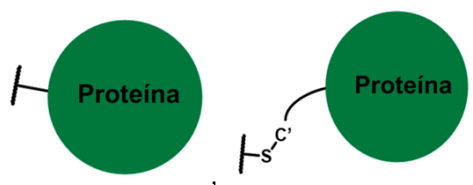
73. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 72, en donde **C** está representado por una estructura seleccionada de:





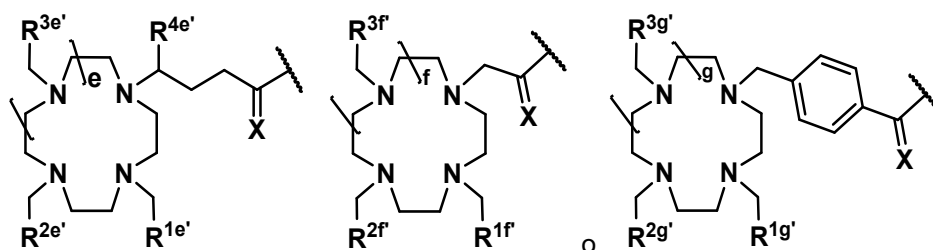






en donde la combinación de **A--B** y **C** se selecciona preferiblemente de tal manera que el enlace covalente — que conecta **B** con **C** está representado por S—S, S—C, C—S, C(O)—R^a, C(O)—N, C(O)—O, C(O)—N, N—C(O), N—C(O)O, N—C(S) o OC(O)—N.

74. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 73, en donde la fracción **C** es
- (a) un grupo agente quelante adecuado para radiomarcaje seleccionado tiene una estructura de acuerdo con una de las siguientes fórmulas:



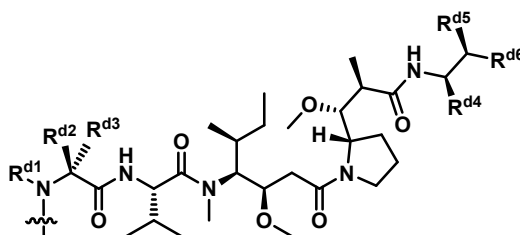
en donde:

cada uno de e, f y g es independientemente 0, 1, 2, 3, 4 o 5; preferiblemente 1;

cada uno de R1e', R2e', R3e', R4e', R1f', R2f', R3f', R1g', R2g' y R3g' es independientemente H, COOH, aril-COOH o heteroaril-COOH; preferiblemente COOH; y

X es O, NH o S; preferiblemente O; o

- (b) un grupo radiactivo que comprende un radioisótopo seleccionado de ²²³Ra, ⁸⁹Sr, ^{94m}Tc, ^{99m}Tc, ¹⁸⁶Re, ¹⁸⁸Re, ²⁰³Pb, ⁶⁷Ga, ⁶⁸Ga, ⁴⁷Sc, ¹¹¹In, ⁹⁷Ru, ⁶²Cu, ⁶⁴Cu, ⁶⁵Cu, ⁶⁷Cu, ⁵⁴Cu, ⁸⁶Y, ⁸⁸Y, ⁹⁰Y, ¹²¹Sn, ^{Al}¹⁸F, ¹⁴⁹Tb, ¹⁵²Tb, ¹⁵⁵Tb, ¹⁶¹Tb, ¹⁵³Sm, ¹⁶⁶Ho, ¹⁰⁵Rh, ¹⁷⁷Lu, ¹²³I, ¹²⁴I, ¹²⁵I, ¹³¹I, ¹⁶F, ¹⁸F, ²¹¹At, ²²⁵Ac, ⁸⁹Sr, ²²⁵Ac, ^{117m}Sn, ¹⁶⁹Er, ²²⁷Th, ³H, ¹¹C, ^{11m}N, ¹³N, ⁸²Rb, ⁸⁹Zr y ³²P; o
- (c) un quelato de un isótopo enumerado en el anterior apartado (b) con un agente quelante enumerado en el anterior apartado (a); o
- (d) un derivado de auristatina que tiene una estructura de acuerdo con la siguiente fórmula:



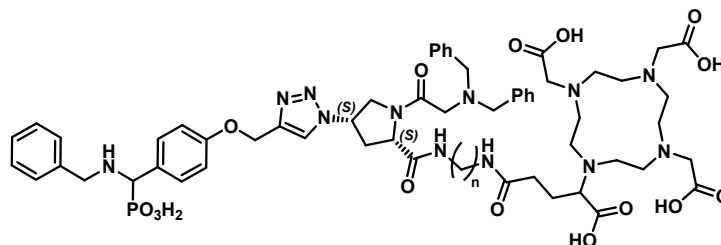
en donde:

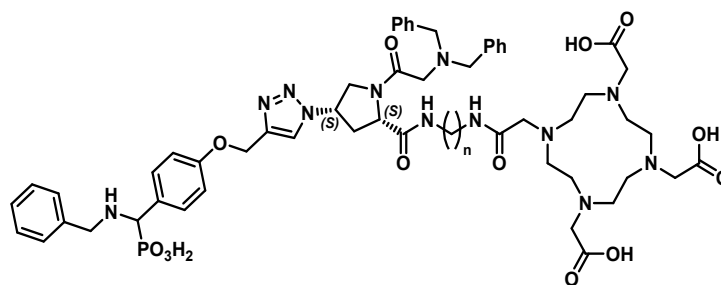
Rd1 es independientemente H o alquilo C1-C6; preferiblemente H o CH3;

Rd2 es independientemente alquilo C1-C6; preferiblemente CH3 o iPr;

Rd3 es independientemente H o alquilo C1-C6; preferiblemente H o CH₃;
 Rd4 es independientemente H, alquilo C1-C6, COO(alquilo C1-C6), CON(H o alquilo C1-C6), arilo C3-C10 o heteroarilo C3-C10; preferiblemente H, CH₃, COOH, COOCH₃ o tiazolilo;
 Rd5 es independientemente H, OH, alquilo C1-C6; preferiblemente H u OH; y
 Rd6 es independientemente arilo C3-C10 o heteroarilo C3-C10; preferiblemente fenilo o piridilo opcionalmente sustituido;
 más preferiblemente derivado de MMAE o MMAF.

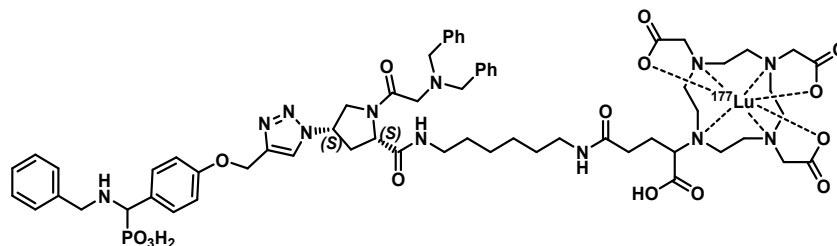
75. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 52, 58 y 65, en donde **C** es tal como se define en la reivindicación 74.
76. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 75, en donde **C** se selecciona independientemente de las estructuras **C-1** a **C-55** tal como se definen en la descripción.
77. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 76, en donde **C** se selecciona independientemente de las estructuras **C-1** a **C-47** tal como se definen en la descripción.
78. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 77, en donde A se selecciona independientemente de las estructuras **A-1** a **A-42**, B se selecciona independientemente de las estructuras **B-1** a **B-50**, y C se selecciona independientemente de las estructuras **C-1** a **C-55** tal como se definen en la descripción.
79. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 78, en donde A se selecciona independientemente de las estructuras **A-1** a **A-30**, B se selecciona independientemente de las estructuras **B-1** a **B-50**, y C se selecciona independientemente de las estructuras **C-1** a **C-47** tal como se definen en la descripción.
80. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 79, que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en la **Tabla 1** en la descripción.
81. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 80, que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en las **Tablas 3.1 a 3.7** en la descripción.
82. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 81, que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en las **Tablas 3.1, 3.2, 3.3, 3.4 y 3.5** en la descripción.
83. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 82, que tiene una estructura representada por una fórmula a continuación, o uno de sus quelatos con un isótopo radiactivo; preferiblemente un radioisótopo como se enumera en la reivindicación 72 o 74; más preferiblemente ¹⁷⁷Lu o ⁶⁸Ga:



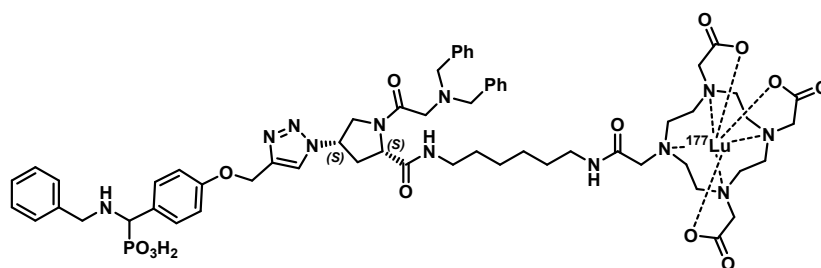


en donde n es 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8.

84. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 83, que tiene una estructura representada por la siguiente fórmula **20a** o **28a**:



20a



28a

85. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 84, que tiene un peso molecular de 5000 Da o menos; preferiblemente 4000 Da o menos; más preferiblemente 3000 Da o menos.
86. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 85, que tiene un peso molecular de 500 Da o más; preferiblemente 600 Da o más; más preferiblemente 800 Da o más.
87. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 86, que tiene un peso molecular de 500 a 5000 Da; preferiblemente de 600 a 4000 Da; más preferiblemente de 800 a 3000 Da.
88. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 87, en donde al menos un átomo de la estructura representada por R^1 o $\text{R}^1\text{-Y}$ es un radioisótopo.
89. El compuesto de la reivindicación 88, en donde el radioisótopo es un isótopo de un elemento seleccionado de C, N, F, P, H e I; preferiblemente seleccionado de ^{11}C , $^{11\text{m}}\text{N}$, ^{16}F , ^{18}F , ^{32}P , ^3H , ^{123}I , ^{124}I , ^{125}I y ^{131}I .
90. Un compuesto obtenido mediante la funcionalización adicional del compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 89 con un grupo radiactivo que comprende o consiste en un radioisótopo.
91. El compuesto de la reivindicación 90, en donde el grupo radiactivo comprende o consiste en un radioisótopo de un elemento seleccionado de C, N, F, P, H e I; preferiblemente seleccionado de ^{11}C , $^{11\text{m}}\text{N}$, ^{16}F , ^{18}F , ^{32}P , ^3H , ^{123}I , ^{124}I , ^{125}I y ^{131}I ; más preferiblemente, en donde el grupo radiactivo se selecciona de ^{16}F , ^3H , ^{123}I y ^{125}I ; o un radioisótopo seleccionado de ^{23}Ra , ^{89}Sr , $^{94\text{m}}\text{Tc}$, $^{99\text{m}}\text{Tc}$, ^{186}Re , ^{188}Re , ^{203}Pb , ^{212}Pb , ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{47}Sc , ^{111}In , ^{97}Ru , ^{62}Cu , ^{64}Cu , ^{65}Cu , ^{67}Cu , ^{54}Cu , ^{86}Y , ^{88}Y , ^{90}Y ,

¹²¹Sn, ^{Al}¹⁸F, ¹⁴⁹Tb, ¹⁵²Tb, ¹⁵⁵Tb, ¹⁶¹Tb, ¹⁵³Sm, ¹⁶⁶Ho, ¹⁰⁵Rh, ¹⁷⁷Lu, ¹²³I, ¹²⁴I, ¹²⁵I, ¹³¹I, ¹⁶F, ¹⁸F, ²¹¹At, ²²⁵Ac, ⁸⁹Sr, ^{117m}Sn, ¹⁶⁹Er, ²²⁷Th, ³H, ¹¹C, ^{11m}N, ¹³N, ⁸²Rb, ⁸⁹Zr y ³²P; o un nucleido seleccionado de ¹³⁹La, ⁶⁹Ga, and ¹⁷⁵Lu.

92. El compuesto que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en las **Tablas 1, 3.1, 3.2, 3.3, 3.4, 3.5, 3.6 y 3.7**, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
93. El de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 92, que se une específicamente a la Fosfatasa Ácida 3 (ACP3), tiene un peso molecular de 5000 Da o menos y una constante de disociación de ACP3 (Kd) de 50 nM o menos.
94. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 93, que se une específicamente a la ACP3 en la membrana de las células tumorales.
95. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 93 o 94, que no se internaliza de forma significativa.
96. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 93 a 95 que presenta una mayor captación en uno o más tumores que en uno o más órganos sanos tras su administración.
97. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 93 a 96 que no se acumula de forma significativa en los riñones, las glándulas salivales ni la próstata sana tras su administración.
98. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde la estructura del compuesto comprende **C**,
en donde **C** es un agente terapéutico o de diagnóstico tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.
99. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde la estructura del compuesto comprende **-B-C**, en donde **B** es un conector tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.
100. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la estructura del compuesto comprende **C**,
en donde **C** es un agente terapéutico o de diagnóstico tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.
101. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 y 101, en donde la estructura del compuesto comprende **-B-C**, en donde **B** es un conector tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.
102. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.
103. El compuesto o la composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores para su uso en:
 - (a) un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia o un método de diagnóstico practicado en el cuerpo humano o animal; o
 - (b) un método para la terapia o profilaxis de un sujeto que padece o tiene riesgo de padecer una enfermedad o trastorno; o
 - (c) un método para cirugía guiada practicado en un sujeto que padece o tiene riesgo de padecer una enfermedad o trastorno; o
 - (d) un método para el diagnóstico de una enfermedad o trastorno, en donde el método se practica

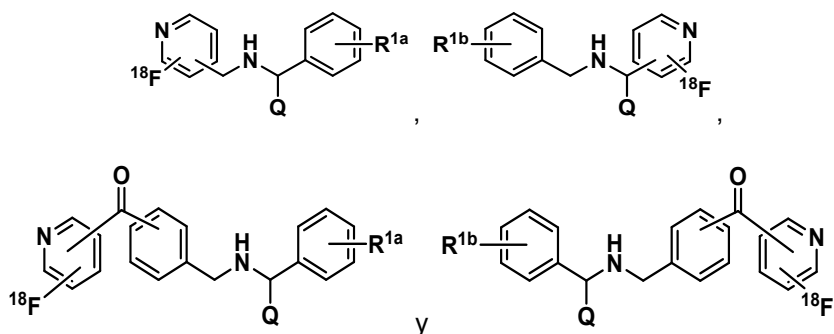
en el cuerpo humano o animal e implica una técnica de imagen de medicina nuclear, tal como tomografía por emisión de positrones (PET) o tomografía computarizada por emisión de fotón único (SPECT); o

(e) un método para la administración dirigida de un agente terapéutico o de diagnóstico a un sujeto que padece o tiene riesgo de padecer una enfermedad o trastorno.

104. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 103, en donde la enfermedad o trastorno es cáncer.
105. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 104, en donde el cáncer está asociado con la expresión de ACPP.
106. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 104 o 105, en donde el cáncer es cáncer de próstata.
107. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 104 a 106, en donde el cáncer se selecciona de adenocarcinoma de próstata, cáncer de próstata ductal, adenocarcinoma ductal, adenocarcinoma de células claras, adenocarcinoma acinar, cáncer urotelial, cáncer de próstata neuroendocrino, cáncer de próstata de células pequeñas, mieloma múltiple.
108. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 103, en donde la enfermedad o trastorno está asociado con la expresión de ACPP.
109. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 103, en donde la enfermedad o trastorno se selecciona de pancreatitis, enfermedad de Paget, anemia de células falciformes, enfermedades de almacenamiento lisosómico y enfermedad de Gaucher.
110. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 103 a 109, en donde el compuesto comprende un grupo radiactivo que comprende un radioisótopo; preferiblemente en donde la fracción C es un quelato de un isótopo radiactivo con un agente quelante; más preferiblemente un emisor beta; lo más preferiblemente ^{177}Lu .
111. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 110, en donde el compuesto se administra a un sujeto a una dosis de $\geq 250 \text{ MBq/kg}$, expresada como una dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, por ejemplo, $\geq 20,3 \text{ MBq/kg}$; preferiblemente $\geq 500 \text{ MBq/kg}$, expresada como una dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, p. ej., $\geq 40,6 \text{ MBq/kg}$.
112. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 111, en donde $\text{R}^1\text{-Y-Z}$ está representado por una estructura tal como se define en la reivindicación 13 o 14; preferiblemente **A-7** tal como se define en la descripción.
113. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 111 o 112, en donde el compuesto es **20a** o **28a**.
114. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 110 a 113, en donde el compuesto se administra a un sujeto a una dosis de $\leq 1 \mu\text{mol/kg}$, preferiblemente expresada como una dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, p. ej., $\leq 0,08 \mu\text{mol/kg}$.
115. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 110, en donde el compuesto se administra a un sujeto a una dosis de $\geq 500 \text{ MBq/kg}$, expresada como una

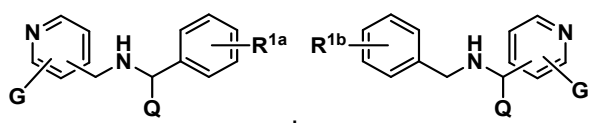
dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, p. ej., $\geq 40,6$ MBq/kg; preferiblemente ≥ 1000 MBq/kg, expresada como una dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, p. ej., $\geq 81,3$ MBq/kg.

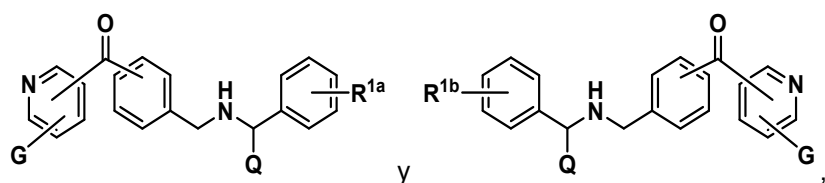
116. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 115, en donde R^1 -Y-Z está representado por una estructura tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 15, 16 y 17; preferiblemente **A-23** tal como se define en la descripción.
117. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con la reivindicación 115 o 116, en donde el compuesto es **22a**.
118. El compuesto o la composición farmacéutica para su uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 115 a 117, en donde el compuesto se administra a un sujeto a una dosis de ≤ 1 $\mu\text{mol/kg}$, preferiblemente expresada como una dosis para ratón, o una dosis humana equivalente, p. ej., $\leq 0,08$ $\mu\text{mol/kg}$.
119. Un compuesto que tiene una estructura seleccionada de aquellas a continuación, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables:



en donde R^{1a} , R^{1b} , Q son tal como se definen en la reivindicación 7.

120. El compuesto de la reivindicación 119, que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en la **Tabla 2.1** o **2.2**.
121. El compuesto de la reivindicación 119 o 120 para su uso en un método para el diagnóstico de una enfermedad o trastorno, en donde el método se practica en el cuerpo humano o animal e implica una técnica de imagen de medicina nuclear, tal como tomografía por emisión de positrones (PET); o un método para la administración dirigida de un agente de diagnóstico a un sujeto que padece o tiene riesgo de padecer una enfermedad o trastorno.
122. El compuesto para su uso de la reivindicación 121, en donde la enfermedad o trastorno es tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 104 a 109.
123. Un compuesto que tiene una estructura seleccionada de aquellas a continuación, sus diastereoisómeros individuales, sus hidratos, sus solvatos, sus formas cristalinas, sus tautómeros individuales o una de sus sales farmacéuticamente aceptables:





en donde R^{1a} , R^{1b} , Q son tal como se definen en la reivindicación 7,

y cada G se selecciona independientemente de NO_2 y (alquilo C_{1-3}) N^+ .

124. El compuesto de la reivindicación 123, que tiene una estructura seleccionada de aquellas enumeradas en la **Tabla 2.3**.
125. Un método de fabricación de un agente de diagnóstico adecuado para una técnica de imagen de medicina nuclear, tal como tomografía por emisión de positrones (PET), en donde el método implica el uso de un compuesto tal como se define en la reivindicación 123 o 124 como material de partida, precursor o intermedio.
126. El método de la reivindicación 125, en donde el agente de diagnóstico es un compuesto de acuerdo con la reivindicación 119 o 120, o una composición que comprende dicho compuesto.