

Y representa NR*, O, CN, o S(O)p;



representa arilo o heteroarilo, o heterociclo, heterociclilo o heterocíclico;

R₃ representa NR(C=X₂)R₁₂, NR*R₁₂, C₆₋₁₀ arilo, o -(O)_nC₅₋₁₀ heterocicliol que puede estar unido a través de un carbono o un heteroátomo; dichos arilo y heterocicliol opcionalmente sustituidos con 1-3 grupos de R₇,

R₄, R_{4a}, R_{4b}, y R_{4c} independientemente representan

- i) hidrógeno,
- ii) halógeno,
- iii) C₁₋₆ alcoxi, o
- iv) C₁₋₆ alquilo;

r y s son independientemente 1-3, con la provisión de cuando (R_{4a})_s y (R₄)_r o (R_{4b}) y (R_{4c})_s son unidos a un anillo Ar o HAr la suma de r y s es menor o igual a 4;

R5 y R6 independientemente representan

i) hidrógeno,

ii) C₁₋₆ alquilo opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de halógeno, CN, OH, C₁₋₆ alcoxi, amino, imino, hidroxiamino, alcóxiamino, C₁₋₆ aciloxi, C₁₋₆ alquilosulfenil, C₁₋₆ alquilosulfinil, C₁₋₆ alquilosulfonil, aminosulfonil, C₁₋₆ alquiloaminosulfonil, C₁₋₆ dialquiloaminosulfonil, 4-morfolinilsulfonil, fenil, piridina, 5-isoxazolil, etileniloxi, o etinil, dichos fenil y piridina opcionalmente sustituidos con 1-3 halógeno, CN, OH, CF₃, C₁₋₆ alquilo o C₁₋₆ alcoxi;

iii) C₁₋₆ acilo opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de halógeno, OH, SH, C₁₋₆ alcoxi, naftalenoxi, fenoxi, amino, C₁₋₆ acilamino, hidroxilamino, alcóxilamino, C₁₋₆ aciloxi, aralquilooxi, fenil, piridina, C₁₋₆ alquilocarbonil, C₁₋₆ alquiloamino, C₁₋₆ dialquiloamino, C₁₋₆ hidroxiaciloxi, C₁₋₆ alquilosulfenilo, ftalimido, maleimido, succinimido, dichos fenoxi, fenil y piridina opcionalmente sustituidos con grupos 1-3 de halo, OH, CN, C₁₋₆ alcoxi, amino, C₁₋₆ acilamino, CF₃ o C₁₋₆ alquilo;

- iv) C1-6 alquilosulfonil opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de halógeno, OH, C1-6 alcoxi, amino, hidroxilamino, alcoxilamino, C1-6 aciloxi, o fenilo; dicho fenilo opcionalmente sustituido con grupos 1-3 de halo, OH, C1-6 alcoxi, amino, C1-6 acilamino, CF₃ or C1-6 alquilo;
- v) arilosulfonil opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de halógeno, C1-6 alcoxi, OH o C1-6 alquilo;
- vi) C1-6 alcóxicarbonil opcionalmente sustituido con 1-3 de halógeno, OH, C1-6 alcoxi, C1-6 aciloxi, o fenilo, dicho fenilo opcionalmente sustituido con grupos 1-3 de halo, OH, C1-6 alcoxi, amino, C1-6 acilamino, CF₃ o C1-6 alquilo;
- vii) aminocarbonil, C1-6 alquiloaminocarbonil o C1-6 dialquiloaminocarbonil, dichos grupos alquilo opcionalmente sustituidos con grupos 1-3 de halógeno, OH, C1-6 alcoxi o fenilo
- viii) cinco a seis heterociclos membrados opcionalmente sustituidos con 1-3 grupos de halógeno, OH, CN, amino, C1-6 acilamino, C1-6 alquilosulfonilamino, C1-6 alcóxicarbonilamino, C1-6 alcoxi, C1-6 aciloxi o C1-6

alquilo, dicho alquilo opcionalmente sustituido con grupos 1-3 de halógeno, o C1-6 alcoxi;

- ix) C3-6 cicloalquilocarbonil opcionalmente sustituido con grupos 1-3 de halógeno, OH, C1-6 alcoxi o CN;
- x) benzoil opcionalmente sustituido con grupos 1-3 de halógeno, OH, C1-6 alcoxi, C1-6 alquilo, CF₃, C1-6 alcanoil, amino o C1-6 acilamino;
- xi) pirrolilcarbonil opcionalmente sustituido con 1-3 de C1-6 alquilo;
- xii) C1-2 aciloxiacetil donde el acil es opcionalmente sustituido con amino, C1-6 alquiloamino, C1-6 dialquiloamino, 4-morfolino, 4-aminofenil, 4-(dialquiloamino)fenil, 4-(glicilamino)fenil; o

R5 y R6 tomados junto con cualquier átomo pueden formar un anillo heterocíclico de 7 miembros que contiene átomos de carbono y 1-2 heteroátomos independientemente elegidos de O, S, SO, SO₂, N, o NR_g;

R7 representa

- i) hidrógeno, halógeno, $(CH_2)_pC_{5-10}$ heterocicliol, CN, CO_2R , $CON(R)_2$, CHO, $(CH_2)_{0-3}NHAc$, $C(=NOR)$, OH, C1-6 alcoxi, C1-6 alquilo, alqueno, hidroxil C1-6 alquilo, $(CH_2)_{1-3}NHC(O)C_{1-6}$ alquilo, $(CH_2)_{0-3}N(C_{1-6} \text{ alquilo})_2$, $NHCO_2R$, $-OCOC_{1-6}$ alquilo;
- ii) $(CH_2)_n$ amino, $(CH_2)_n$ C1-6 alquiloamino, C1-6 acilamino, C1-6 dialquiloamino, hidroxilamino o C1-2 alcóxiamino los cuales pueden todos ser opcionalmente sustituidos en el nitrógeno con C1-6 acil, C1-6 alquilosulfonil o C1-6 alcóxicarbonil, dicho acil y alquilosulfonil opcionalmente sustituidos con 1-2 de halógeno o OH;

R₈ y R₉ independientemente representa

- i) H, CN,
- ii) C1-6 alquilo opcionalmente sustituido con 1-3 halógeno, CN, OH, C1-6 alcoxi, C1-6 aciloxi, o amino,
- iii) fenilo opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de halógeno, OH, C1-6 alcoxi; o

R7 y R8 tomados juntos pueden formar un anillo de carbono de 3-7 miembros opcionalmente interrumpido con 1-2 heteroátomos elegidos de O, S, SO, SO₂, NH, y NR₈;

X1 representa O, S or NR₁₃, NCN, NCO₂R₁₆, o NSO₂R₁₄

X2 representa O, S, NH o NSO₂R₁₄;

R10 representa hidrógeno, C₁₋₆ alquilo o CO₂R₁₅;

R12 representa hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, NH₂, OR, CHF₂, CHCl₂, C(R)₂Cl, (CH₂)_nSR, (CH₂)_nCN, (CH₂)_nSO₂R, (CH₂)_nS(O)R, C₁₋₆ alquiloamino, C₃₋₆ cicloalquilo, C₅₋₁₀ heterocicliol o C₁₋₆ dialquiloamino, donde dichos alquilo, y cicloalquilo pueden ser sustituidos con 1-3 grupos de halo, CN, OH o C₁₋₆ alcoxi, dicho heterocicliol opcionalmente sustituido con 1-3 grupos de R₇;

Cada R₁₃ representa independientemente hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₆₋₁₀ arilo, NR₅R₆, SR₈, S(O)R₈, S(O)₂ R₈, CN, OH, C₁₋₆ alquiloS(O)R, C₁₋₆ alcoxicarbonil, hidroxicarbonil, -OCOarilo,

C₁₋₆ acil, C₃₋₇ anillo de carbono membrado opcionalmente interrumpido con 1-4 heteroátomos elegidos de O, S, SO, SO₂, NH y NR₈ donde dichos grupos C₁₋₆ alquilo, arilo o C₁₋₆ acil pueden ser independientemente sustituidos con 0-3 grupos halógenos, hidroxí, N(R)₂, CO₂R, C₆₋₁₀ arilo, C₅₋₁₀ heteroarilo, o C₁₋₆ alcoxi;

Cuando dos grupos R₁₃ se unen al mismo átomo o a dos átomos adyacentes pueden estar juntos para formar un anillo de carbono de 3-7 miembros opcionalmente interrumpido con 1-2 heteroátomos elegidos de O, S, SO, SO₂, NH, y NR₈;

R representa hidrógeno o C₁₋₆ alquilo;

R* representa hidrógeno, CN, C(=O)R₁₄, (CH₂)_pCO₂C₁₋₆ alquilo, (CH₂)_pC₅₋₁₀heterocicliol, o C₁₋₆ alquilo, dicho alquilo y heterocicliol opcionalmente sustituidos con 1 a 3 grupos de R₇;

R₁₄ representa amino, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₆ cicloalquilo, (CH₂)_pC₅₋₁₀heterocicliol, C₁₋₆ haloalquilo, fenilo, dicho alquilo, cicloalquilo, fenilo, heterocicliol opcionalmente sustituidos con