

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y CC
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-112530- -00005-0000

Fecha: 2010-10-04 17:20:21 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 29

Re: Expediente No. 06-112.530

Solicitud de patente de invención titulada: “DERIVADOS DE PIRIMIDINA PARA TRATAR EL CRECIMIENTO CEULAR ANÓMALO”

Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC.

N. Ref.: P2006/000220

RESPUESTA AL OFICIO No.08812 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA No. 242
DE FECHA 09 DE JULIO DE 2010
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, y con el ánimo de brindar mayor claridad a la presente solicitud, me permito adjuntar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar esta solicitud.

Así las cosas, con el fin de dar mayor claridad a la materia reivindicada, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto se han realizado los siguientes cambios:

- Se ha eliminado la Reivindicación 11;
- Se ha introducido un “hidrógeno” en el sustituyente “NSO₂-alquilo (C₁.C₆)” en las definiciones (c) y (d) de R³ en la Reivindicación 1, de tal forma que ahora se lee “NHSO₂-alquilo (C₁.C₆)”;
- Se ha eliminado el término repetido “-O-SO₂-alquilo(C₁-C₆)” en la definición (c) del sustituyente R³ en la Reivindicación 1;



2

- Se ha introducido una nueva Reivindicación 2 independiente, que reivindica la misma materia de la Reivindicación 1, con la diferencia de que se excluye de su alcance las sales, hidratos, solvatos y profármacos de los compuestos de Fórmula I;
- Se ha introducido un “hidrógeno” en el sustituyente “NSO₂-alquilo (C₁-C₆)” en la definición de R³ en la Reivindicación 5, de tal forma que ahora se lee “NHSO₂-alquilo (C₁-C₆)”;
- Se ha eliminado el término repetido “-O-SO₂-alquilo(C₁-C₆)” en la definición del sustituyente R³ en la Reivindicación 5;
- Las Reivindicaciones 7, 8 y 9 ahora son dependientes de las Reivindicaciones 1 y 2;
- A la Reivindicación 7 se le ha adicionado la frase “R¹, R² y R⁴ son como se ha definido en la Reivindicación 1” y se han eliminado los sustituyentes “O-cicloalquilo (C₃-C₆)”, “N(cicloalquilo(C₃-C₇))(SO₂-alquilo(C₁-C₆))”, “CF₃” y “N(cicloalquilo(C₃-C₇))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₇))” de la definición de R¹³;
- En la Reivindicación 8 se han introducido las definiciones de “m”, “R¹³”, y la frase “R¹, R² y R⁴ son como se ha definido en la Reivindicación 1”;
- Las definiciones de “m”, “R¹³”, “q” y la frase “R¹, R² y R⁴ son como se ha definido en la Reivindicación 1”, se han introducido en las Reivindicaciones 9 y 10;
- Se han eliminado de la Reivindicación 9 las últimas 12 estructuras en la definición del grupo “D”;
- Se introducen las nuevas Reivindicaciones 13 a 15, que encuentran soporte en la Reivindicación 10 (nueva Reivindicación 11) y en la página 53, líneas 21 y 22, y Tabla 1, página 113, sexto compuesto del Capítulo Descriptivo.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

2. a- El Examinador establece que la Reivindicación 11 no es patentable puesto que reclama un método de tratamiento.

b- Considero superada la anterior objeción, en tanto que la Reivindicación 11 fue eliminada del Capítulo Reivindicatorio Modificado.

3. a- El Examinador señala que la Reivindicación 1 contiene términos imprecisos como “profármaco”, “solvato” e “hidrato”, ya que no se especifican con exactitud el (los) compuesto(s) a los cuales se refiere.

3

b- En relación con los términos “solvato”, “hidrato” y “profármaco”, deseo subrayar que un inventor está en su derecho de reclamar protección para la totalidad de un concepto inventivo desarrollado, siempre y cuando éste guarde unidad de invención a lo largo de la solicitud. Así las cosas, considero errónea la objeción que el Examinador presenta en relación con dichos términos, pues éstos indican claramente y de manera directa, que las moléculas de la invención, por ejemplo, en estado sólido, pueden conservar restos de solventes, sean estos acuosos o no. Esto es, dentro del concepto inventivo desarrollado se contemplan modalidades en las que las moléculas de interés pueden o no incluir moléculas de solvente en su estado sólido. De nuevo, una persona versada en la materia puede entender perfectamente el alcance y los límites de la protección solicitada, entendiendo qué modalidades presentan solvente intersticial en el estado sólido y cuáles no.

Por lo demás, vale la pena anotar que el uso de estos términos y otros análogos que indican la posibilidad de obtener la invención en diversas modalidades, es una práctica aceptada a nivel mundial en el ámbito de las patentes, ya que como el Examinador debe saberlo, una patente de invención no se limita a una única modalidad, sino que cubre un concepto inventivo global que abarca diferentes modalidades (diversas materializaciones de la invención) ligadas por un efecto técnico común que finalmente delimita el alcance de la invención. De hecho, la misma SIC ha concedido repetidamente el privilegio de patente para solicitudes que incluyen el término “solvato” (por ejemplo las patentes: CO05-023.068, CO04-076.757, CO03-032.395, CO06-070.683, CO04-022.055, CO04-022.055B, CO04-115.486, CO02-101.292, CO05-040.051, CO03064.030A, CO04-012.905, CO04-079.404, CO05-020.516), el término hidrato (CO05-040.051 y CO05-127.734) y el término profármaco (CO05-127.734) en las reivindicaciones. Así las cosas, insisto respetuosamente que los términos “solvato”, “hidrato” y “profármaco” son perfectamente entendibles por cualquier persona medianamente versada en la materia, de tal manera que a la luz del Capítulo Descriptivo es perfectamente claro el alcance y los límites de la protección solicitada, entendiendo qué moléculas están cobijadas por las reivindicaciones y cuáles no.

De cualquier manera, y con el ánimo de facilitar el trámite de la presente invención el Capítulo Reivindicatorio Modificado contiene una nueva Reivindicación independiente (nueva Reivindicación 2) que reclama el compuesto de Fórmula I de la presente invención sin hacer mención a sus posibles solvatos, hidratos o profármacos.

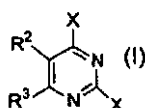
4. a- El Examinador establece que las reivindicaciones de la presente solicitud son demasiado amplias y solicita una restricción del alcance a la materia ilustrada en los ejemplos.

b- Llamo respetuosamente la atención del Examinador al hecho que si bien la legislación en materia de patentes (Decisión 486) establece claramente en su artículo 28(e) que la solicitud debe incluir una descripción de la mejor manera conocida por el solicitante para ejecutar o llevar a la práctica la invención (lo cual se realiza tradicionalmente mediante el uso de ejemplos), esto no implica de ninguna manera que el alcance de la invención se limita a dicha ilustración de cómo se puede llevar a la práctica la invención (los ejemplos), pues una invención se limita por el concepto inventivo desarrollado y no por las posibles modalidades independientes en que éste se puede materializar. Exigir restringir el alcance de la invención exclusivamente a los ejemplos dejaría sin protección a compuestos de la invención estructural y funcionalmente relacionados, pero no incluidos en los ejemplos. En el presente caso, todos los términos utilizados en las Reivindicaciones y el Capítulo Descriptivo incluyen número de átomos, y longitud de las cadenas, por lo que se considera que la generalización realizada es suficiente.

De hecho, el Examinador en conocimiento de la ley tiene claro que las objeciones realizadas por la administración en cualquiera de sus actos administrativos deben encontrarse completamente motivadas y que para exigir una restricción de la materia reivindicada, como lo pretende aquí, únicamente a los ejemplos, tendría que demostrar técnicamente que algunos de los compuestos comprendidos en la presente invención no estarían cubiertos por el mismo concepto inventivo.

5. a- El Examinador argumenta que la patente WO03/030909 (D1) afecta el nivel inventivo de la presente invención.

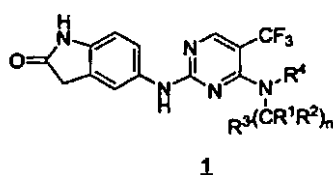
El Examinador señala que D1 enseña compuestos útiles en el tratamiento de cáncer e infecciones virales, de Fórmula (I):



indicando que la única diferencia frente a los compuestos de la presente invención es la presencia de los sustituyentes CF₃ y -N(R⁴)-(CR¹R²)_n-R³. Adicionalmente, el Examinador establece que es imposible determinar un efecto técnico, ya que el Capítulo Descriptivo no presenta datos demostrando mejoras o ventajas derivadas de dicha diferencia estructural.

El Examinador concluye que cualquier persona medianamente versada en la materia a la luz de los conocimientos de D1, habría modificado los compuestos allí divulgados, y habría obtenido los compuestos de la presente invención.

b- i) En primer lugar, me permito resaltar que la presente invención reclama compuestos derivados de pirimidina de Fórmula 1:



útiles en el tratamiento del crecimiento celular anómalo, al ser inhibidores selectivos de quinasa y tirosina quinasa no receptores (FAK).

Es decir, los compuestos de la presente invención comprenden un núcleo 2,4-diamino-5-trifluorometilpirimidina, en los que la amina en posición 2 se encuentra sustituida por un grupo 5-(2-oxo-1,3-dihidro-1H-indolilo) y la amina en posición 4, como bien lo señaló el Examinador, se encuentra sustituida por el radical R^4 y el grupo $(CR^1R^2)_n-R^3$.

Por el contrario, los compuestos divulgados en D1, por demás una gran familia de derivados de pirimidina, se encuentran sustituidos por un radical X en posición 2 y 4 del anillo pirimidina, que comprenden los grupos NR^1R^6 , NR^4R^5 y R^4 . Dichos sustituyentes abarcan una gran cantidad de grupos químicos diversos, dentro de los cuales se encuentran particularmente ilustrados en los 375 ejemplos, los grupos quinolina y 2,3-dihidro-1H indazol solos o sustituido por uno o varios grupos metilo.

Así entonces, nada en D1 habría motivado a la persona medianamente versada en la materia a incluir específicamente un grupo 5-(2-oxo-1,3-dihidro-1H-indolilo) en la posición 2 del núcleo pirimidina. A lo sumo, y teniendo en cuenta las sugerencias brindadas por los ejemplos de D1, la persona medianamente versada en la materia se habría encontrado inclinado a incluir en la posición 2 del anillo pirimidina un grupo 2,3-dihidro-1H indazol no sustituido o sustituido por uno o más grupos metilo, y no un grupo 2,3-dihidro-indeno sustituido en posición 2 por un carbonilo, para obtener un grupo 5-(2-oxo-1,3-dihidro-1H-indolilo).

Adicionalmente, y como bien lo señala el Examinador, el grupo $-N(R^4)-(CR^1R^2)_n-R^3$ que se encuentra sustituyendo el anillo pirimidina en posición 4, no se encuentra siquiera sugerido por D1. De hecho, existe una gran variedad de posibles significados en los 375 ejemplos presentados

6

en D1, y ninguno habría motivado a la persona medianamente versada en la materia a incluir específicamente una amina sustituida por los grupos R^4 y $(CR^1R^2)_n-R^3$.

Claramente, las diferencias estructurales de los compuestos de la presente invención proporcionan ventajas en la actividad farmacológica, por ejemplo, al compararlos con los compuestos de D1 que proporcionan un IC_{50} entre 0.24 y 3.56 μM (páginas 88 y 89, Tabla 8), ya que los compuestos aquí reivindicados exhiben en un ensayo de quinasa (página 86 líneas 28-30) una actividad in vitro determinada por un $IC_{50} < 500 nM$, preferiblemente un $IC_{50} < 25 nM$, y más preferiblemente un $IC_{50} < 10 nM$, y en el ensayo basado en células FAK (páginas 86, líneas 31-33) presentan un $IC_{50} < 1 \mu M$, más preferiblemente un $IC_{50} < 100 nM$, y más preferiblemente un $IC_{50} < 25 nM$ (por lo menos 10 veces más potente).

Lo anterior permite concluir que, tal como lo establece el Manual Andino de Patentes (MAP), las invenciones en el campo de la química deben ser consideradas como inventivas cuando los compuestos reclamados tienen una estructura inesperada (no predecible por la persona medianamente versada en la materia) y proporcionan efectos mejorados o inesperados¹, condiciones, que como lo demostré anteriormente, son cumplidas a cabalidad por los compuestos reivindicados en la presente solicitud.²

ii) De otra parte, es importante resaltar en este punto que como lo establecen las directrices del MAP, “la cuestión para el Examinador es si la invención reivindicada es o no evidente para un técnico en la materia”³. Ahora bien, en el análisis de nivel inventivo, el Examinador debe proporcionar argumentos claros e inequívocos que expliquen las motivaciones expresamente contenidas en el arte previo que necesariamente conduzcan a la persona medianamente versada en la materia a la invención reivindicada, sin necesidad de experimentación adicional alguna, y con una expectativa de éxito indudable sobre los resultados a alcanzar. En su estudio de fondo No. 1138, el Examinador no explica claramente las motivaciones para modificar la estructura de los compuestos de D1 y utilizar específicamente un grupo -5-(2-oxo-1,3-dihidro-1H-indolilo) sustituyendo el anillo primidina en posición 2, en lugar de los diferentes grupos químicos sugeridos en los ejemplos como son quinolina y 2,3-dihidro-1H indazol, y adicionalmente, incluir en la posición 4 un grupo $-N(R^4)-(CR^1R^2)_n-R^3$, plenamente identificado por el Examinador, con la expectativa de obtener una mejor actividad farmacológica como lo demuestran los datos ilustrados en el Capítulo Descriptivo.

¹ Manual Andino de Patentes. OMPI, EPO, Secretaría de la Comunidad Andina. 2003. Sección 10.8.1.

² Manual Andino de Patentes. OMPI, EPO, Secretaría de la Comunidad Andina. 2003. Sección 10.4.

³ Manual Andino de Patentes. OMPI, EPO, Secretaría de la Comunidad Andina, 2004. ISBN 9978-43-855-6. Secciones 10.1.

Como lo ha determinado el Tribunal Andino de Justicia, “lo obvio es aquello que salta a la vista de manera clara y directa; lo “que se encuentra o pone delante de los ojos, muy claro o que no tiene dificultad”. Lo evidente consiste en la “certeza clara y manifiesta de la que no se puede dudar, cierto, claro, patente y sin la menor duda”. Continúa el Tribunal diciendo que “una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no es consecuencia clara y directa de dicho estado.”⁴

Teniendo en cuenta lo anterior, nada en D1 motivaría de forma evidente a la persona medianamente versada en la materia a incluir específicamente los grupos sustituyentes en posición 2 y 4 del anillo pirimidina desarrollados en la presente invención con la expectativa de tener una mejor actividad sin necesidad de llevar a cabo experimentación adicional. Por el contrario, las enseñanzas y sugerencias de D1 inducirían a la persona versada en la materia a incluir grupos estructurales diferentes (grupos quinolina y 2,3-dihidro-1H indazol), lo que permite concluir que la presente invención ostenta nivel inventivo frente a lo divulgado en D1.

6. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente se tengan por cumplidos los requisitos de patentabilidad y se proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295
Anexos:

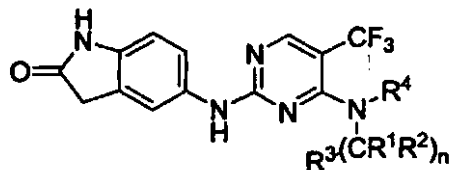
- Capítulo Reivindicatorio Modificado

⁴ Proceso 10-IP-2009, página 12, párrafos 5 y 6.

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto de Fórmula 1



1

o una de sus sales, solvatos, hidratos o profármacos farmacéuticamente aceptable, en la que

n es un número entero de 1 a 3;

cada R^1 es un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -Oalquilo (C_1-C_6), -Ocicloalquilo (C_3-C_7), -Oheterociclilo (C_2-C_9), $-NR^5R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^5R^6$, y $-NR^{12}SO_2R^7$; en la que dichos sustituyentes R^1 , -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -Oalquilo (C_1-C_6), -Ocicloalquilo (C_3-C_7), -Oheterociclilo (C_2-C_9), $-NR^5R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^5R^6$, y $-NR^{12}SO_2R^7$, están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CF_3$, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), $-NR^5R^6$, $-OR^{12}$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$ y $-CONR^5R^8$;

cada R^2 es un sustituyentes independientemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, y $-CONR^5R^6$; en la que dichos sustituyentes R^2 , -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, y $-CONR^5R^6$, están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CF_3$, $-NO_2$, $-CN$, -alquilo(C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), $-C=N-OH$, $-C=N-O$ (alquilo(C_1-C_6))), $-NR^5R^6$, $-OR^{12}$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$, $-CONR^5R^8$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^5R^6$, y $-NR^{12}SO_2R^7$, en los que dichos restos de R^2 -alquenilo (C_2-C_6) y -alquinilo (C_2-C_6) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno a tres grupos R^{12} ;

R^1 y R^2 se pueden considerar junto con el(los) átomo(s) al(los) que está(n) unido(s) para formar un grupo cíclico, -cicloalquilo (C_3-C_{10}) o -heterociclilo (C_2-C_9), en el que dicho grupo cíclico está opcionalmente sustituido con uno a tres restos independientemente

seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-\text{CF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), -alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), $-\text{C}=\text{N-OH}$, $-\text{C}=\text{N-O}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{OR}^{12}$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$, $-\text{SR}^7$, $-\text{SOR}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHCOR}^{12}$, $-\text{NR}^{12}\text{CONR}^5\text{R}^6$, y $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$, en los que dichos restos -alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) y -alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) de dicho grupo cíclico puede estar opcionalmente sustituido con uno a tres grupos R^{12} , y dicho grupo cíclico está opcionalmente interrumpido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en $-(\text{C}=\text{O})$, $-\text{SO}_2$, $-\text{S-}$, $-\text{O-}$, $-\text{N-}$, $-\text{NH-}$ y $-\text{NR}^{12}$;

R^3 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en:

(a) hidrógeno;

(b) -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$) o -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{P}(\text{O})(\text{Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))_2$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_{10}$), arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHSO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{NHSO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-\text{N}(\text{alquil}(\text{C}_1\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{alquil}(\text{C}_1\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{cicloalquil}(\text{C}_3\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{cicloalquil}(\text{C}_3\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))$, -Oalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -O-alquilo($\text{C}_1\text{-C}_6$), -O- $\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{CF}_3$, $-(\text{CO})\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{-arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{-heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{-heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{O-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{O-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{O-arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{O-heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{O-heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{NH-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))(\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))_2$ y $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, en el que dichos -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$) o -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en $-\text{S-}$, $-\text{O-}$, $-\text{N-}$, $-\text{NH-}$ y $-\text{NR}^{12}$;

(c) -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_{10}$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), y -alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-heterociclilo($\text{C}_2\text{-C}_9$), opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)- $\text{P}(\text{O})(\text{Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))_2$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_{10}$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHSO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{NHSO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-\text{N}(\text{alquil}(\text{C}_1\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{alquil}(\text{C}_1\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{cicloalquil}(\text{C}_3\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{N}(\text{cicloalquil}(\text{C}_3\text{-C}_6))(\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6))$, -O-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -O- $\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, -O- $\text{SO}_2\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{CF}_3$, $-(\text{CO})\text{-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{-arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{-heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{-heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{O-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-(\text{CO})\text{O-cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{O-arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-(\text{CO})\text{O-heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{O-heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, $-(\text{CO})\text{-alquil}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{SO}_2\text{-alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$,

-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂CF₃, -SO₂NH₂, -SO₂NH-alquilo(C₁-C₆), -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, -SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dichos -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), y -alquil(C₁-C₆)-heterociclilo(C₂-C₉) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹²; y

(d) -alquilo (C₁-C₆) opcionalmente sustituido con uno a tres restos seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -alquil(C₁-C₆)-P(O)(Oalquilo(C₁-C₆))₂, -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -arilo (C₆-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -Oalquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-O-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂CF₃, -SO₂NH₂, -SO₂NH(C₁-C₆)alquilo, -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, -SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dicho -alquilo (C₁-C₆) está opcionalmente sustituido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹²;

y en la que cada sustituyente, resto o elemento R³ (b)-(d) está opcionalmente sustituido con uno a tres radicales independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CF₃, -NO₂, -CN, -alquilo (C₁-C₆), -alqueno (C₂-C₆), -alquino (C₂-C₆), -cicloalquilo (C₃-C₇), -heterociclilo (C₂-C₉), -arilo (C₆-C₁₀), -heteroarilo (C₁-C₉), -Oalquilo (C₁-C₆), -Ocicloalquilo (C₃-C₇), -Oheterociclilo (C₂-C₉), -C=N-OH, -C=N-Oalquilo(C₁-C₆), -NR⁵R⁶, -SR⁷, -SOR⁷, -SO₂R⁷, -CO₂R¹², -CONR⁵R⁶, -SO₂NR⁵R⁶, -NHCOR⁵, -NR¹²CONR⁵R⁶, y -NR¹²SO₂R⁷;

R⁴ es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C₁-C₆), -cicloalquilo (C₃-C₇), y -heterociclilo (C₂-C₉); en el que dichos sustituyentes R⁴ -alquilo (C₁-C₆), -cicloalquilo (C₃-C₇) y -heterociclilo (C₂-C₉) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -CN, -NR⁵R⁸, -OR⁵, -cicloalquilo (C₃-C₇), -heterociclilo (C₂-C₉), -CO₂R¹², -SO₂NR⁵R⁸, -NR¹²SO₂R⁷, -SO₂R⁷ y -CONR⁵R⁸; en los que dichos R⁵ y R⁸ de dicho grupo -CONR⁵R⁸ se pueden considerar junto con los átomos a los que están unidos para formar un -heterociclilo (C₂-C₉);

R^5 y R^6 son cada uno sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), -heteroarilo (C_1-C_9), $-COR^{12}$ y $-SO_2R^{12}$; en los que dichos sustituyentes R^5 o R^6 -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), -eteroarilo (C_1-C_9), $-COR^{12}$ y $-SO_2R^{12}$ están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, $-CF_3$, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), $-NH$ -alquilo (C_1-C_6), $-NH$ -cicloalquilo (C_3-C_7), $-NH$ -heterociclilo (C_2-C_9), $-NH$ -arilo (C_6-C_{10}), $-NH$ -heteroarilo (C_1-C_9), $-N$ (alquilo(C_1-C_6))₂, $-N$ (cicloalquilo(C_3-C_7))₂, $-N$ (heterociclilo(C_2-C_9))₂, $-N$ (arilo(C_6-C_{10}))₂, $-N$ (heteroarilo(C_1-C_9))₂, -Oalquilo (C_1-C_6), -Ocicloalquilo (C_3-C_7), -Oheterociclilo (C_2-C_9), -Oarilo (C_6-C_{10}), -Oheteroarilo (C_1-C_9), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^7$, $SO_2NR^5R^6$, $NR^{12}SO_2R^7$, $-SO_2R^7$, $-CONH_2$, $-CONHR^7$, y $-CONR^7R^8$; en los que R^7 y R^8 de dicho grupo $-CONR^7R^8$ se pueden considerar junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un -heterociclilo (C_2-C_9);

R^5 y R^6 se pueden considerar junto con el(los) átomo(s) al(los) que está(n) unido(s) para formar un -heterociclilo (C_2-C_9), en el que dicho grupo -heterociclilo (C_2-C_9) está opcionalmente sustituido con uno a tres restos seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CF_3$, $-NO_2$, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), -alqueno (C_2-C_6), -alquino (C_2-C_6), $-C=N-OH$, $-C=N-O$ (alquilo(C_1-C_6))), $-NR^7R^8$, $-OR^{12}$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, $-CONR^7R^8$, $-CONR^5R^8$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-SO_2NR^7R^8$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^7R^8$, y $-NR^{12}SO_2R^7$, en los que dichos restos -alqueno (C_2-C_6) y -alquino (C_2-C_6) de dicho grupo -heterociclilo (C_2-C_9) puede estar opcionalmente sustituidos con uno a tres grupos R^7 , y dicho grupo -heterociclilo (C_2-C_9) está opcionalmente interrumpido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en $-(C=O)$, $-SO_2$, $-S-$, $-O-$, $-N-$, $-NH-$ y $-NR^{12}$;

R^7 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9); en el que dichos sustituyentes R^7 -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), $-NR^{12}_2$, y -Oalquilo (C_1-C_6);

R^8 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9); en el que dichos sustituyentes R^8 -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), $-NH_2$, $-NHR^9$, $-NR^9_2$, OR^9 , -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{10}$, $-CONH_2$, $-CONHR^{10}$, y $-CONR^{10}R^{11}$ en los que R^{10} y R^{11}

12

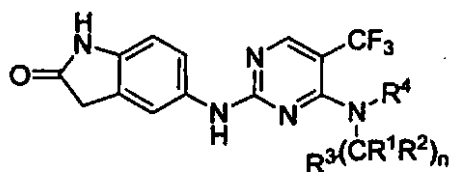
de $-\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$ se pueden considerar junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$);

R^9 y R^{10} son cada uno -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$);

R^{11} es hidrógeno o -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$); y

R^{12} es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), y -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$); en el que dicho sustituyente R^{12} alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), y -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$) está opcionalmente sustituido con tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{NH}$ -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{NH}$ -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), $-\text{NH}$ -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{NH}$ -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), $-\text{NH}$ -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))_2$, $-\text{N}(\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7))_2$, $-\text{N}(\text{heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9))_2$, $-\text{N}(\text{arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10}))_2$, $-\text{N}(\text{heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9))_2$, $-\text{Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{Ocicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{Oheterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-\text{Oarilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-\text{Oheteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^7$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}^7$, y $-\text{CONR}^7\text{R}^8$; en los que R^7 y R^8 de dicho grupo $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ se pueden considerar junto con los átomos a los que están unidos para formar un -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$).

2. Un compuesto de Fórmula 1



1

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en el que:

n es un número entero de 1 a 3;

cada R^1 es un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -Oalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{Ocicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{Oheterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{SR}^7$, $-\text{SOR}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHCOR}^{12}$, $-\text{NR}^{12}\text{CONR}^5\text{R}^6$, y $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$; en la que dichos sustituyentes R^1 , -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -Oalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{Ocicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{Oheterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{SR}^7$, $-\text{SOR}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHCOR}^{12}$, $-\text{NR}^{12}\text{CONR}^5\text{R}^6$, y $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$, están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{OR}^{12}$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$ y $-\text{CONR}^5\text{R}^8$;

3

cada R^2 es un sustituyentes independientemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, y $-CONR^5R^6$; en la que dichos sustituyentes R^2 , -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, y $-CONR^5R^6$, están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CF_3$, $-NO_2$, $-CN$, -alquilo(C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), $-C=N-OH$, $-C=N-O$ (alquilo(C_1-C_6))), $-NR^5R^6$, $-OR^{12}$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$, $-CONR^5R^8$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^5R^6$, y $-NR^{12}SO_2R^7$, en los que dichos restos de R^2 -alquenilo (C_2-C_6) y -alquinilo (C_2-C_6) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno a tres grupos R^{12} ;

R^1 y R^2 se pueden considerar junto con el(los) átomo(s) al(los) que está(n) unido(s) para formar un grupo cíclico, -cicloalquilo (C_3-C_{10}) o -heterociclilo (C_2-C_9), en el que dicho grupo cíclico está opcionalmente sustituido con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-CF_3$, $-NO_2$, $-CN$, -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), $-C=N-OH$, $-C=N-O$ (alquilo(C_1-C_6))), $-NR^5R^6$, $-OR^{12}$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^{12}$, $-CONR^5R^6$, $-CONR^5R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^{12}$, $-NR^{12}CONR^5R^6$, y $-NR^{12}SO_2R^7$, en los que dichos restos -alquenilo (C_2-C_6) y -alquinilo (C_2-C_6) de dicho grupo cíclico puede estar opcionalmente sustituido con uno a tres grupos R^{12} , y dicho grupo cíclico está opcionalmente interrumpido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en $-(C=O)$, $-SO_2$, $-S-$, $-O-$, $-N-$, $-NH-$ y $-NR^{12}$;

R^3 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en:

- (a) hidrógeno;
- (b) -arilo (C_6-C_{10}) o -heteroarilo (C_1-C_9), opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C_1-C_6), -alquil(C_1-C_6)- $P(O)$ (Oalquilo(C_1-C_6))₂, -cicloalquilo (C_3-C_{10}), arilo (C_6-C_{10}), heterociclilo (C_2-C_9), -heteroarilo (C_1-C_9), $-NR^5R^6$, $-NHSO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $-NHSO_2$ -cicloalquilo(C_3-C_6), $-N$ (alquil(C_1-C_6))(SO₂-alquilo(C_1-C_6))), $-N$ (alquil(C_1-C_6))(SO₂-cicloalquilo(C_3-C_6))), $-N$ (cicloalquil(C_3-C_6))(SO₂-alquilo(C_1-C_6))), $-N$ (cicloalquil(C_3-C_6))(SO₂-cicloalquilo(C_3-C_6))), -Oalquilo (C_1-C_6), -O-alquilo(C_1-C_6), -O-SO₂-cicloalquilo(C_3-C_6), $-(CO)$ -alquilo(C_1-C_6), $-(CO)CF_3$, $-(CO)$ -cicloalquilo(C_3-C_{10}), $-(CO)$ -arilo(C_6-C_{10}), $-(CO)$ -heterociclilo(C_2-C_9), $-(CO)$ -heteroarilo(C_1-C_9), $-(CO)O$ -alquilo(C_1-C_6), $-(CO)O$ -cicloalquilo(C_3-C_{10}), $-(CO)O$ -arilo(C_6-C_{10}), $-(CO)O$ -heterociclilo(C_2-C_9), $-(CO)O$ -heteroarilo(C_1-C_9), $-(CO)$ -alquilo(C_1-C_6)-Oalquilo(C_1-C_6), $-SO_2$ -alquilo (C_1-C_6), $-SO_2$ -cicloalquilo (C_3-C_6), $-SO_2CF_3$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH$ -alquilo (C_1-C_6), $-SO_2NH$ -cicloalquilo(C_3-C_6), $-SO_2N$ (alquilo(C_1-C_6))₂, $-SO_2N$ (alquilo(C_1-C_6))(cicloalquilo(C_3-C_6))), $-SO_2N$ (cicloalquilo(C_3-C_6))₂ y $-SO_2NR^5R^6$, en el que dichos

-arilo (C₆-C₁₀) o -heteroarilo (C₁-C₉) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹²;

(c) -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), y -alquil(C₁-C₆)-heterociclilo(C₂-C₉), opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -alquil(C₁-C₆)-P(O)(Oalquilo(C₁-C₆))₂, -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -arilo (C₆-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -O-alquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-Oalquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo (C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂CF₃, -SO₂NH₂, -SO₂NH-alquilo(C₁-C₆), -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, -SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dichos -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), y -alquil(C₁-C₆)-heterociclilo(C₂-C₉) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹²; y

(d) -alquilo (C₁-C₆) opcionalmente sustituido con uno a tres restos seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -alquil(C₁-C₆)-P(O)(Oalquilo(C₁-C₆))₂, -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -arilo (C₆-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -Oalquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-O-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂CF₃, -SO₂NH₂, -SO₂NH(C₁-C₆)alquilo, -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, -SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dicho -alquilo (C₁-C₆) está opcionalmente sustituido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹²;

y en la que cada sustituyente, resto o elemento R³ (b)-(d) está opcionalmente sustituido con uno a tres radicales independientemente seleccionados del grupo que

consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-\text{CF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), -alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), -Oalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -Ocicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -Oheterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{C}=\text{N}-\text{OH}$, $-\text{C}=\text{N}-\text{Oalquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{SR}^7$, $-\text{SOR}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^5\text{R}^6$, $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $-\text{NHCOR}^5$, $-\text{NR}^{12}\text{CONR}^5\text{R}^6$, y $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$;

R^4 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), y -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$); en el que dichos sustituyentes R^4 -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$) y -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{CN}$, $-\text{NR}^5\text{R}^8$, $-\text{OR}^5$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^8$, $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$ y $-\text{CONR}^5\text{R}^8$; en los que dichos R^5 y R^8 de dicho grupo $-\text{CONR}^5\text{R}^8$ se pueden considerar junto con los átomos a los que están unidos para formar un -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$);

R^5 y R^6 son cada uno sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), $-\text{COR}^{12}$ y $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$; en los que dichos sustituyentes R^5 o R^6 -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -arilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), -heteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), $-\text{COR}^{12}$ y $-\text{SO}_2\text{R}^{12}$ están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), $-\text{NH}-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{NH}-\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{NH}-\text{heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9)$, $-\text{NH}-\text{arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10})$, $-\text{NH}-\text{heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9)$, $-\text{N}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))_2$, $-\text{N}(\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7))_2$, $-\text{N}(\text{heterociclilo}(\text{C}_2\text{-C}_9))_2$, $-\text{N}(\text{arilo}(\text{C}_6\text{-C}_{10}))_2$, $-\text{N}(\text{heteroarilo}(\text{C}_1\text{-C}_9))_2$, -Oalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -Ocicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -Oheterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), -Oarilo ($\text{C}_6\text{-C}_{10}$), -Oheteroarilo ($\text{C}_1\text{-C}_9$), -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^7$, $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHR}^7$, y $-\text{CONR}^7\text{R}^8$; en los que R^7 y R^8 de dicho grupo $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ se pueden considerar junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$);

R^5 y R^6 se pueden considerar junto con el(los) átomo(s) al(los) que está(n) unido(s) para formar un -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), en el que dicho grupo -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$) está opcionalmente sustituido con uno a tres restos seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, $-\text{CF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, -alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), -alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$), -alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$), $-\text{C}=\text{N}-\text{OH}$, $-\text{C}=\text{N}-\text{O}(\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6))$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{OR}^{12}$, -cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_7$), -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$), $-\text{CO}_2\text{R}^{12}$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, $-\text{CONR}^5\text{R}^8$, $-\text{SR}^7$, $-\text{SOR}^7$, $-\text{SO}_2\text{R}^7$, $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NHCOR}^{12}$, $-\text{NR}^{12}\text{CONR}^7\text{R}^8$, y $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^7$; en los que dichos restos -alqueno ($\text{C}_2\text{-C}_6$) y -alquino ($\text{C}_2\text{-C}_6$) de dicho grupo -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$) puede estar opcionalmente sustituidos con uno a tres grupos R^7 , y dicho grupo -heterociclilo ($\text{C}_2\text{-C}_9$) está opcionalmente interrumpido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en $-(\text{C}=\text{O})$, $-\text{SO}_2$, $-\text{S}-$, $-\text{O}-$, $-\text{N}-$, $-\text{NH}-$ y $-\text{NR}^{12}$;

R^7 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9); en el que dichos sustituyentes R^7 -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CN, -alquilo (C_1-C_6), -NR¹²₂, y -Oalquilo (C_1-C_6);

R^8 es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9); en el que dichos sustituyentes R^8 -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9) están opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CN, -alquilo (C_1-C_6), -NH₂, -NHR⁹, -NR⁹₂, OR⁹, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -CO₂R¹⁰, -CONH₂, -CONHR¹⁰, y -CONR¹⁰R¹¹ en los que R¹⁰ y R¹¹ de -CONR¹⁰R¹¹ se pueden considerar junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un -heterociclilo (C_2-C_9);

R⁹ y R¹⁰ son cada uno -alquilo (C_1-C_6);

R¹¹ es hidrógeno o -alquilo (C_1-C_6); y

R¹² es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9); en el que dicho sustituyente R¹² -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -arilo (C_6-C_{10}), y -heteroarilo (C_1-C_9) está opcionalmente sustituido con tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, -CF₃, -CN, -alquilo (C_1-C_6), -NH-alquilo (C_1-C_6), -NH-cicloalquilo (C_3-C_7), -NH-heterociclilo (C_2-C_9), -NH-arilo (C_6-C_{10}), -NH-heteroarilo (C_1-C_9), -N(alquilo(C_1-C_6))₂, -N(cicloalquilo(C_3-C_7))₂, -N(heterociclilo(C_2-C_9))₂, -N(arilo(C_6-C_{10}))₂, -N(heteroarilo(C_1-C_9))₂, -Oalquilo (C_1-C_6), -Ocicloalquilo (C_3-C_7), -Oheterociclilo (C_2-C_9), -Oarilo (C_6-C_{10}), -Oheteroarilo (C_1-C_9), -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), -CO₂R⁷, -CONH₂, -CONHR⁷, y -CONR⁷R⁸; en los que R⁷ y R⁸ de dicho grupo -CONR⁷R⁸ se pueden considerar junto con los átomos a los que están unidos para formar un -heterociclilo (C_2-C_9).

3. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, en el que R³ es hidrógeno.

4. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, en el que R³ se selecciona del grupo que consiste en -arilo (C_6-C_{10}) y -heteroarilo (C_1-C_9), opcionalmente sustituido con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C_1-C_6), -alquil(C_1-C_6)-P(O)(Oalquilo(C_1-C_6))₂, -cicloalquilo

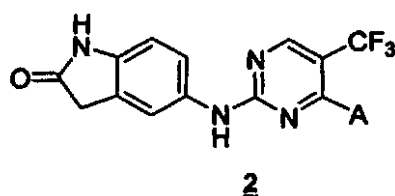
(C₃-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀), heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -Oalquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-Oalquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), SO₂CF₃, SO₂NH₂, SO₂NH-alquilo(C₁-C₆), -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dicho -arilo (C₆-C₁₀) o -heteroarilo (C₁-C₉) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹².

5. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, en el que R³ se selecciona del grupo que consiste en -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), y -alquil(C₁-C₈)-heterociclilo(C₂-C₉), opcionalmente sustituidos con uno a tres restos independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -alquil(C₁-C₆)-P(O)(Oalquilo(C₁-C₆))₂, -cicloalquilo (C₃-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀), heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -Oalquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₁₀), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-Oalquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), SO₂CF₃, SO₂NH₂, SO₂NH-alquilo(C₁-C₆), -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dicho -cicloalquilo (C₃-C₁₀), -heterociclilo (C₂-C₉), y -alquil(C₁-C₆)-heterociclilo(C₂-C₉) están opcionalmente interrumpidos con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹².

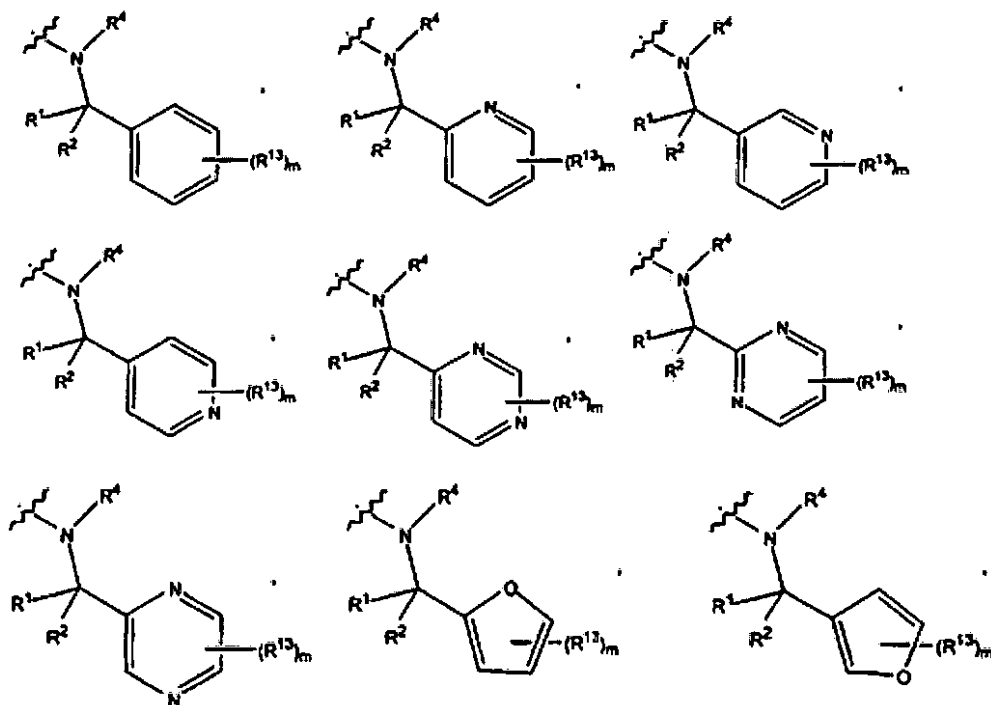
6. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, en el que R³ es -alquilo (C₁-C₆) opcionalmente sustituido con uno a tres restos seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, -alquilo (C₁-C₆), -alquil(C₁-C₆)-P(O)(Oalquilo(C₁-C₆))₂, -cicloalquilo (C₃-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀), heterociclilo (C₂-C₉), -heteroarilo (C₁-C₉), -NR⁵R⁶, -NHSO₂-

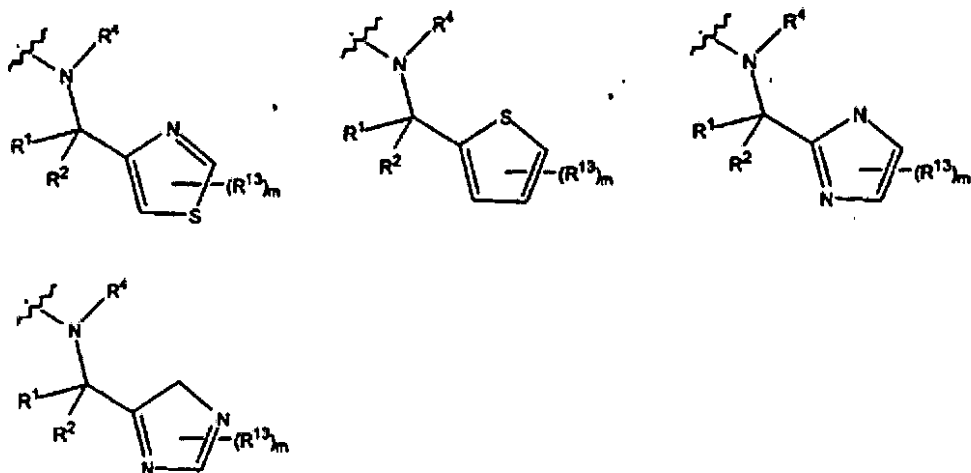
alquilo(C₁-C₆), -NHSO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(alquil(C₁-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-alquilo(C₁-C₆)), -N(cicloalquil(C₃-C₆))(SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆)), -Oalquilo (C₁-C₆), -O-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -O-SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-alquilo(C₁-C₆), -(CO)CF₃, -(CO)-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)O-alquilo(C₁-C₆), -(CO)O-cicloalquilo(C₃-C₆), -(CO)O-arilo(C₆-C₁₀), -(CO)O-heterociclilo(C₂-C₉), -(CO)O-heteroarilo(C₁-C₉), -(CO)-alquil(C₁-C₆)-Oalquilo(C₁-C₆), -SO₂-alquilo(C₁-C₆), -SO₂-cicloalquilo(C₃-C₆), SO₂CF₃, SO₂NH₂, SO₂NH-alquilo(C₁-C₆), -SO₂NH-cicloalquilo(C₃-C₆), -SO₂N(alquilo(C₁-C₆))₂, SO₂N(alquil(C₁-C₆))(cicloalquilo(C₃-C₆)), -SO₂N(cicloalquilo(C₃-C₆))₂ y -SO₂NR⁵R⁶, en el que dicho -alquilo (C₁-C₆) está opcionalmente interrumpido con uno a tres elementos seleccionados del grupo que consiste en -(C=O), -SO₂, -S-, -O-, -N-, -NH- y -NR¹².

7. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, de Fórmula 2



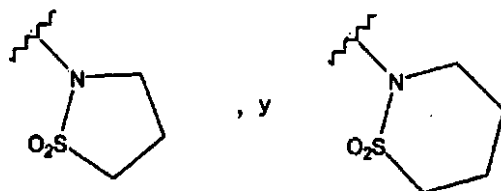
en la que A se selecciona del grupo que consiste en:



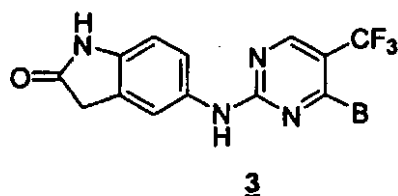


en los que R^1 , R^2 y R^4 son como se ha definido en la Reivindicación 1,

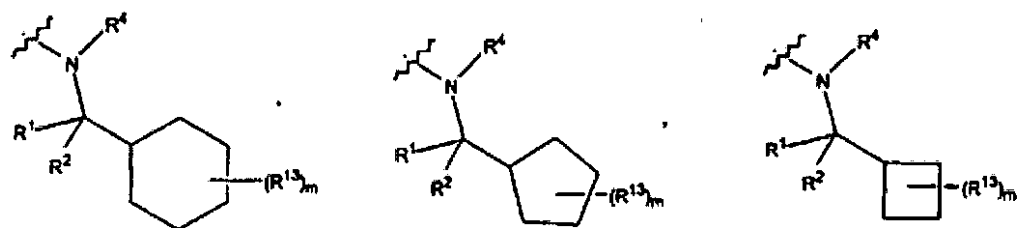
m es un número entero de 0 a 3 y R^{13} es un sustituyente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -arilo (C_6-C_{10}), -heteroarilo (C_1-C_9), -heterociclilo (C_2-C_9), O-alquilo (C_1-C_6), SO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7), $NHSO_2$ -alquilo (C_1-C_6), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 -alquilo (C_1-C_6)), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7)), OSO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2CF_3 , SO_2NH_2 , SO_2NH -alquilo (C_1-C_6), SO_2NH -cicloalquilo (C_3-C_7), $SO_2NR^5R^6$, SO_2N (alquilo (C_1-C_6))₂, CO -alquilo (C_1-C_6), CO -cicloalquilo (C_3-C_7), $COCF_3$, CO_2 -alquilo (C_1-C_6),



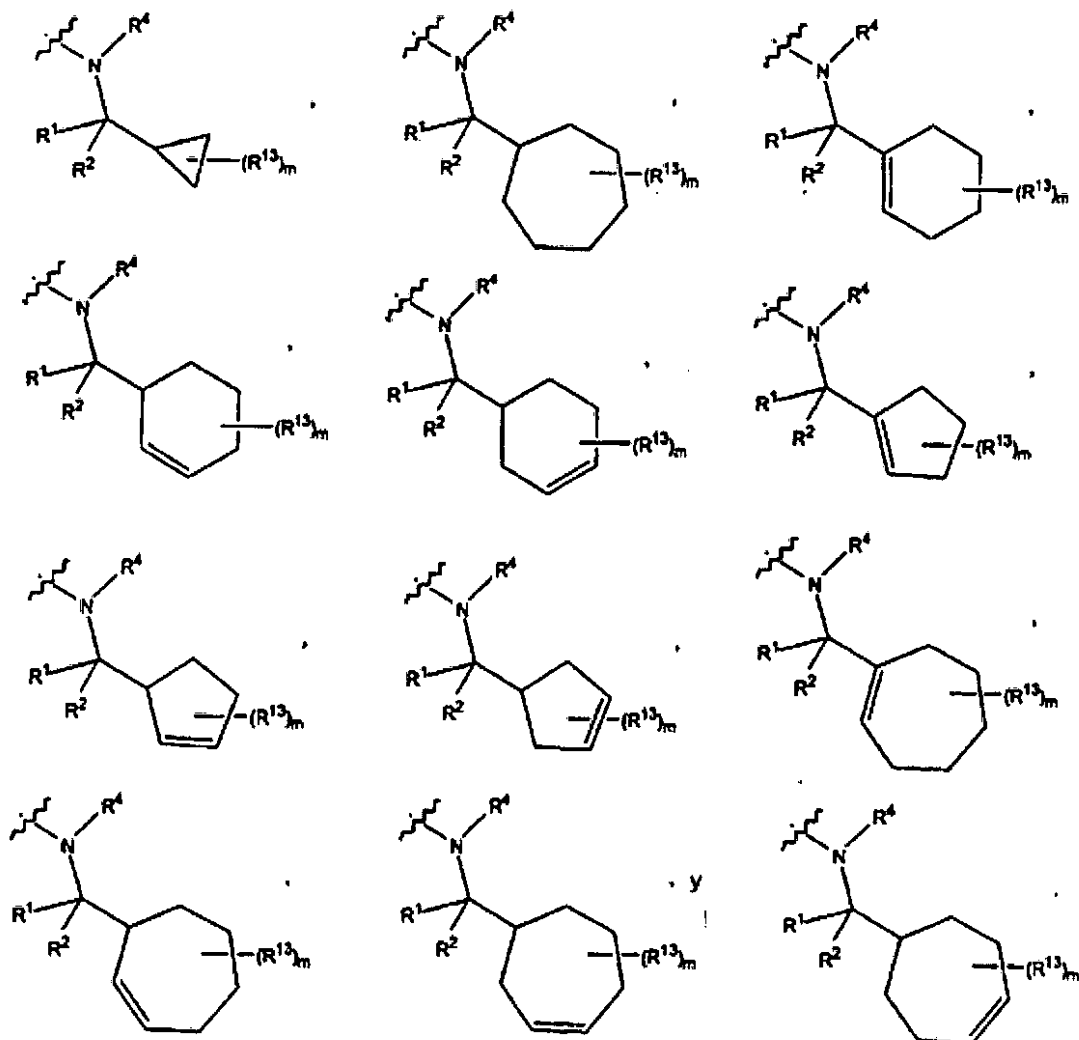
8. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, de Fórmula 3



en la que B se selecciona del grupo que consiste en:



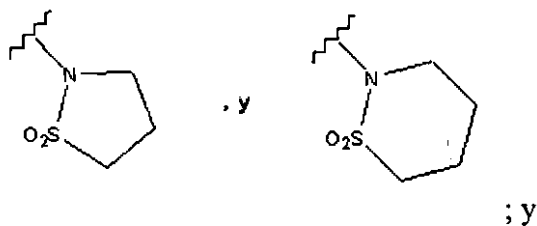
20



en donde:

m es un entero entre 0-3;

R^{13} es un sustituyente seleccionado entre el grupo que comprende hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -arilo (C_6-C_{10}), heteroarilo (C_1-C_9), -heterociclilo (C_2-C_9), O-alquilo (C_1-C_6), SO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7), $NHSO_2$ -alquilo (C_1-C_6), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 (alquilo (C_1-C_6))), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7))), OSO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2CF_3 , SO_2NH_2 , SO_2NH -alquilo (C_1-C_6), SO_2NH -cicloalquilo (C_3-C_7), $SO_2NR^5R^6$, SO_2N (alquilo (C_1-C_6))₂, CO -alquilo (C_1-C_6), CO -cicloalquilo (C_3-C_7), $COCF_3$, CO_2 -alquilo (C_1-C_6),



R^1 , R^2 y R^4 son como se ha definido en la Reivindicación 1.

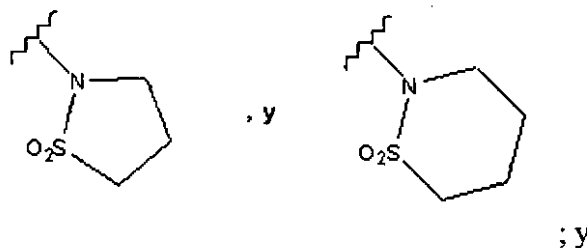
9. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, de Fórmula 4

22

en los que q es un número entero de 1 a 2.

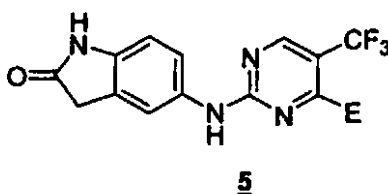
m es un entero entre 0-3;

R^{13} es un sustituyente seleccionado entre el grupo que comprende hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7), -arilo (C_6-C_{10}), heteroarilo (C_1-C_9), -heterociclilo (C_2-C_9), O-alquilo (C_1-C_6), SO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7), $NHSO_2$ -alquilo (C_1-C_6), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 (alquilo (C_1-C_6))), N (alquilo (C_1-C_6))(SO_2 -cicloalquilo (C_3-C_7))), OSO_2 -alquilo (C_1-C_6), SO_2CF_3 , SO_2NH_2 , SO_2NH -alquilo (C_1-C_6), SO_2NH -cicloalquilo (C_3-C_7), $SO_2NR^5R^6$, SO_2N (alquilo (C_1-C_6))₂, CO-alquilo (C_1-C_6), CO-cicloalquilo (C_3-C_7), $COCF_3$, CO_2 -alquilo (C_1-C_6),

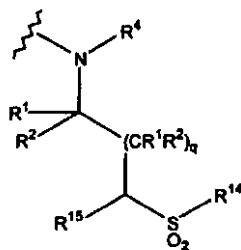


R^1 , R^2 y R^4 son como se ha definido en la Reivindicación 1.

10. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 y 2, de Fórmula 5



en la que E se selecciona del grupo que consiste en:



en el que R^{14} se selecciona del grupo que consiste en -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_6), y -heterociclilo (C_2-C_9), y R^{15} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, -alquilo (C_1-C_6), -cicloalquilo (C_3-C_7) y -heterociclilo (C_2-C_9);

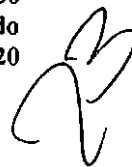
q es un entero entre 1 y 2; y

R^1 , R^2 y R^4 son como se ha definido en la Reivindicación 1.

11. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en:

N-Metil-N-{3-[(metil-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-il]-amino))-metil]-fenil}-metanosulfonamida;

N-Metil-N-{4-metil-3-[(metil-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-il]-amino))-metil]-fenil}-metanosulfonamida;



N-(5-Metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-(3-Metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-(4-Metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-(2-Metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

5-[4-(3-Metanosulfonil-propilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-Metil-N-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-(3-Metanosulfonilamino-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(3-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

5-{4-(((1S,2R)-2-Hidroxi-ciclohexilmetil)-amino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-[4-((1R,2S)-2-Hidroxi-indan-1-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-[4-((S)-1-hidroximetil-2-fenil-etilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-(3-(Metanosulfonil-metil-amino)-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-N-metil-metanosulfonamida;

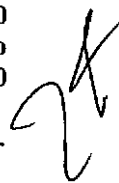
5-{4-[(1-Hidroxi-ciclopentilmetil)-amino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-Metil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-(3-Fluoro-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-N-metil-metanosulfonamida;

5-{4-[2-((S)-1-Metanosulfonil-pirrolidin-2-il)-etilamino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-{4-[(1-Hidroxi-ciclobutilmetil)-amino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;



5-{4-[2-((R)-1-Metanosulfonil-pirrolidin-2-il)-etilamino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-(2-Fluoro-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-N-metil-metanosulfonamida;

N-(4-Fluoro-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-N-metil-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-{2,2-Dimetil-3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-N-metil-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-(2,4-Difluoro-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-N-metil-metanosulfonamida;

5-[4-((R)-1-Metanosulfonil-piperidin-3-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-Metil-N-(6-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

5-[4-(1-Metanosulfonil-piperidin-4-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-{4-[Metil-((R)-1-fenil-etil)-amino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-(4-Bencilamino-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino)-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-(4,6-Dimetil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-N-metil-metanosulfonamida;

5-(4-terc-Butilamino-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino)-1,3-dihidro-indol-2-ona;

5-[4-((1R,5S,6S)-3-Metanosulfonil-3-aza-biciclo[3.1.0]hex-6-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-Metil-N-{3-metil-3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-butil}-metanosulfonamida;

N-(6-Metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

5-{4-[(2-Metanosulfonil-piridin-4-ilmetil)-amino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

Amida del ácido 2-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-etanosulfónico;

N-(3-{Metil-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-il]-amino}-propil)-metanosulfonamida;

N-(2-{Metil-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-il]-amino}-etil)-metanosulfonamida;

5-[4-(2-Metanosulfonilmetil-bencilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino]-1,3-dihidro-indol-2-ona;

Dimetilamida del ácido 2-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-etanosulfónico;

N-Metil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida;

Metil-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

N-Etil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-{1,1-Dimetil-3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-metanosulfonamida;

N-(5,6-Dimetil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-N-metil-metanosulfonamida;

5-{4-[(R)-4-Metanosulfonil-morfolin-3-ilmetil]-amino}-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

(2-{[2-(2-Oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido propano-1-sulfónico;

5-{4-[2-((R)-4-Metanosulfonil-morfolin-3-il)-etilamino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

Metil-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-amida del ácido etanosulfónico;

Trifluoro-N-metil-N-{3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-metanosulfonamida;

Metil-{3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-amida del ácido ciclopropanosulfónico;

N-Etil-N-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

Metil-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

Etil-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;



Etil-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

N-Etil-N-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

(5-Metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

(3-Metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

Metil-(3-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-amida del ácido etanosulfónico;

Metilamida del ácido 2-[2-(2-Oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-etanosulfónico;

{3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-amida del ácido etanosulfónico;

C-Metanosulfonil-N-{3-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-metanosulfonamida;

{2-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-etil}-amida del ácido etanosulfónico;

C-Metanosulfonil-N-{2-[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-etil}-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

5-(4-{[1-(2,2,2-Trifluoro-acetil)-piperidin-3-ilmetil]-amino}-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino)-1,3-dihidro-indol-2-ona;

{3-[2-(2-Oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-propil}-amida del ácido 2,2,2-trifluoro-etanosulfónico;

N-Metil-N-(4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Ciclopropil-N-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-fenil)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-4-il)-metanosulfonamida;



N-ciclopropil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida;

5-{4-[(2-Metanosulfonilmetil-piridin-3-ilmetil)-amino]-5-trifluorometil-pirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidro-indol-2-ona;

N-Metil-N-(4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(3-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(3-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-2-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(S-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(6-metil-4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-3-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-5-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(4-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-5-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(5-metil-3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(2-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-5-il)-metanosulfonamida;

N-Metil-N-(3-metil-6-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirazin-2-il)-metanosulfonamida; y

N-Metil-N-(6-metil-5-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-pirimidin-4-il)-metanosulfonamida.

12. Una composición farmacéutica para tratar el crecimiento celular anómalo en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto de la Reivindicación 1 que es eficaz para tratar el crecimiento celular anómalo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

13. Un compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 7, 8 o 9, en donde

R^1 se selecciona entre hidrógeno, hidroxilo, y -alquilo (C_1-C_6) opcionalmente sustituido por uno a tres fracciones independientemente seleccionadas del grupo que comprende halógeno, hidroxilo, -CN, -alquilo (C_1-C_6), $-NR^5R^6$, $-OR^5$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^5$, $-CONR^5R^6$ y $-CONR^5R^8$;

R^2 es hidrogeno o -alquilo (C_1-C_6) opcionalmente sustituido por una o tres fracciones independientemente seleccionadas del grupo que comprende halógeno, hidroxilo, $-NO_2$, -CN, -alquilo (C_1-C_6), -alquenilo (C_2-C_6), -alquinilo (C_2-C_6), $-C=N-OH$, $-C=N-O(alquilo(C_1-C_6))$, $-NR^5R^6$, $-OR^5$, -cicloalquilo (C_3-C_7), -heterociclilo (C_2-C_9), $-CO_2R^5$, $-CONR^5R^6$, $-CONR^5R^8$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, $-SO_2NR^5R^6$, $-NHCOR^5$, $-NR^5CONR^5R^6$, y $-NR^5SO_2R^7$, donde dichas fracciones -alquenilo (C_2-C_6) y -alquinilo (C_2-C_6) pueden estar opcionalmente sustituidas por uno a tres grupos R^5 ;

n es 1; y

R^5 , R^6 , R^7 y R^8 son como se han definido para la Reivindicación 1.

14. Un compuesto que es N-metil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo farmacéuticamente aceptable y N-metil-N-(3-{[2-(2-oxo-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-5-trifluorometil-pirimidin-4-ilamino]-metil}-piridin-2-il)-metanosulfonamida o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo
