

- *N1C(=NC2=C(C(=N1)C#N)C(=C2)SC(C)C(=O)N)N(*)C(*)
- (Qb)

Página 1 de 6

independientemente entre: metilo, flúor, -NH₂, -N(CH₃)₂, hidroximetilo, oxo, -OH y -CH₂NH₂,

ciclobutilo,
aminociclobutilo,
tetrahidrofurano,
5-oxa-2azaespiro[3,4]octano, y
8-azabicyclo[3,2,1]octano, o

R^{72a''} y R^{73a''} se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, y opcionalmente de 1 a 3 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados entre O, N y S, para formar un heterocicloalquilo seleccionado entre:

pirrolidinilo,
pirrolo[3,4-c]pirazolilo,
piperidinilo,
1,4diazepanilo,
piperazinilo,
6,7-dihidro-triazolo[4,5-c]piridinilo,
2,9-diazaespiro[5,5]undecanilo,
2,8-diazaespiro[4,5]decanilo,
octahidro-1H-pirrolo[1,2a][1,4]diazepinilo,
oxa-diazaespiro[4,5]decanilo,
oxazolilo,
morfolinilo,
1-oxa-6-azaespiro[3,4]octanilo,
2-oxa-6-azaespiro[3,4]octanilo,
1,7-diazaespiro[3,5]nonanilo,
2,7-diazaespiro[3,5]nonanilo,
2,6-diazaespiro[3,4]octanilo,
azetidinilo,
hexahidropirrolo[3,4-b]oxazinilo,
dihidronaftiridinilo,
diazabicycloheptanilo,
1,8-diazaespiro[4,5]decanilo, y
5-oxa-2-azaespiro[3,4]octanilo,

todos los cuales están opcionalmente sustituidos con de 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre:

flúor,
cloro,
oxo,
-OH,
-OP(O)(OH)₂,
-CN,

-CH₃,
-CH₂OH,
metoxi,
-CH₂CH₃,
-C(O)CH₃,
-C(O)NH₂,
-OCH₂CH₂OH,
-OCH₂CH₂NH₂,
-ONHC(NH)NH₂,
-OC(O)NH₂,
-Ooxetanilo,
-CH₂CH₂OH,
-CH₂CH₂CH₂OH,
-CH₂CH₂CH₃,
-CH₂CH₂OCH₃,
-CH₂CH(OH)CH₃,
-CH₂CH(OH)CH₂OH,
-CH₂C(O)OCH₃,
-CH₂C(O)NH₂,
-C(O)CH(CH₃)₂,
-CH₂CH₂N(CH₃)₂,
-CH₂CH₂NHCH₂CH₃,
-CH₂CH₂CH₂N(CH₃)₂,
-CH₂CH₂NHCH₂C(CH₃)₃,
-CH₂CH₂N(CH₃)CH₂OCH₃,
-C(CH₃)₂CH₂OH,
-CH₂C(CH₃)₂OH,
-CH₂C(CH₃)₂OCH₃,
-C(O)CH₂OH,
-CH₂isotiazolilo,
-CH₂tiazolilo,
-CH₂pirazolilo,
-CH₂imidazolilo,
-CH₂piridinilo,
-CH₂oxazolilo,
-CH₂pirrolilo,
-CH₂isoxazolilo,
-CH₂furanilo,
-CH₂CH₂morfolinilo,
-CH₂CH₂pirrolidinilo,
-CH₂CH₂pirrolidinilCH₃,

-CH₂CH₂CH₂pirrolidinilo,
-C(O)fenilo,
-C(O)C(tetrahidropiranyl)NH₂,
-NH₂,
-NHCH₃,
-N(CH₃)₂,
-NHC(O)CH₃,
-NHCH₂CHF₂,
-NHCH₂C(CH₃)₃,
-NHCH₂CH(CH₃)₂,
-NHCH₂CH₂OCH₃,
-NHCH₂CH₂OH,
-NHCH₂CH₂NH₂,
-NHCH₂C(O)OH,
-NHC(O)CH₂NH₂,
-NHC(O)CH₂CH₂CH₂NH₂,
-NHCH₂C(O)NH₂,
-NHCH₂C(OH)(CH₃)₂,
-NHC(O)CH(CH₃)NH₂,
-NHC(O)OCH(CH₃)NH₂,
-NHC(O)CH(CH₃)₂,
-NHC(O)C(CH₃)₂NH₂,
-NHC(O)CH₂OH,
-NHC(O)CH(CH₂OH)NH₂,
-NHC(O)(oxetanil)NH₂,
-NHC(O)OC(CH₃)₃,
-NHC(CH₃)₂C(O)OCH₃,
-NHciclopropilo,
-NHoxetanilo,
-CH₂NH₂,
-CH₂CH₂NH₂,
-CH₂CH₂CH₂NH₂,
-CH₂NHCH₂C(CH₃)₃,
-CH₂NHC(O)C(CH₃)₃,
-CH₂NHC(O)CH₂NH₂,
-CH₂NHC(O)CH₂OH,
-CH₂N(CH₃)₂,
-CH₂NHCH₃,
-CH₂N(CH₂CH₃)₂,
-CH₂CH₂N(CH₃)₂,
-S(O)₂CH₂CH₃,

-S(O)₂CH₂CH₂CH₃,
-S(O)₂fenilo,
-S(O)₂CH₃,
benzoílo,
bencilamino,
-propilpirrolidinilo,
-metilciclopropilo,
ciclobutilamino,
ciclobutil-N(CH₃)-,
piperidinilo,
imidazolilo,
morfolinilo,
morfolinilmetilo,
metilpiperazinilmetilo,
metilpiperazinilo,
pirrolidinilo,
pirrolidinilmetilo,
(metoxipiridinilmetil)amino,
metilpirrolidinilo,
difluoropirrolidinilo,
dimetilpirrolidinilo,
(metilciclopropilmetil)amino,
hidroximetilpirrolidinilo,
fluoropirrolidinilo,
(fluorofenilmetil)amino,
piperazinilmetilo,
oxazolidinilo,
(metiloxetanilmetil)amino,
(metilciclobutilmetil)amino,
oxoimidazolidinilo, y
2-hidroxiethylpiperidinilo;

con la condición de que:

R^{72a''} y R^{73a''} no son ambos hidrógeno;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de la Reivindicación 1 seleccionado entre:

dihidrógeno fosfato de 1-(6-((2-amino-2-oxo-1-feniletíl)tio)-3,5-diciano-4-etilpiridin-2-il)pirrolidin-3-ilo;

dihidrógeno fosfato de (3R)-1-(6-((2-amino-2-oxo-1-feniletíl)tio)-3,5-diciano-4-etilpiridin-2-il)pirrolidin-3-ilo;

dihidrógeno fosfato de (S)-1-(6-(((S)-2-amino-2-oxo-1-feniletíl)tio)-3,5-diciano-4-etilpiridin-2-il)pirrolidin-3-ilo;

dihidrógeno fosfato de (S)-1-(6-(((R)-2-amino-2-oxo-1-feniletíl)tio)-3,5-diciano-4-etilpiridin-2-il)pirrolidin-3-ilo;

o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

3. Un compuesto de la Reivindicación 1 seleccionado entre:

2-(((3,5-diciano-4-etil-6-(3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida;

2-(((3,5-diciano-4-etil-6-((S)-3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida;

2-(((3,5-diciano-4-etil-6-((R)-3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida;

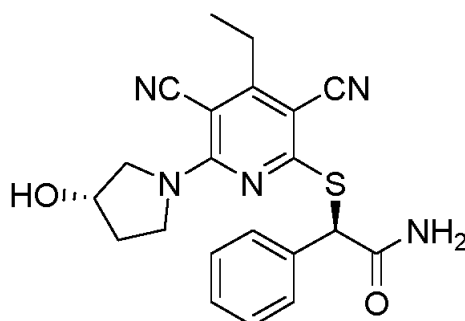
(R)-2-(((3,5-diciano-4-etil-6-((S)-3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida;

(R)-2-(((3,5-diciano-4-etil-6-((R)-3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida; y

(S)-2-(((3,5-diciano-4-etil-6-((S)-3-hidroxipirrolidin-1-il)piridin-2-il)tio)-2-fenilacetamida;

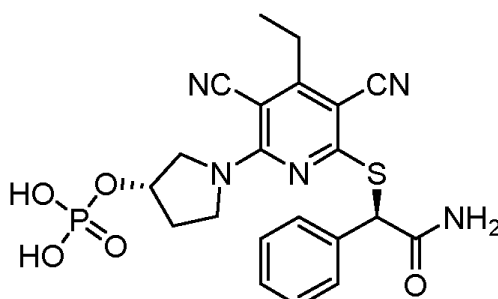
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. Un compuesto de la Reivindicación 1, el cual es:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

5. Un compuesto de la Reivindicación 1, el cual es:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

6. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un excipiente farmacéuticamente aceptable.