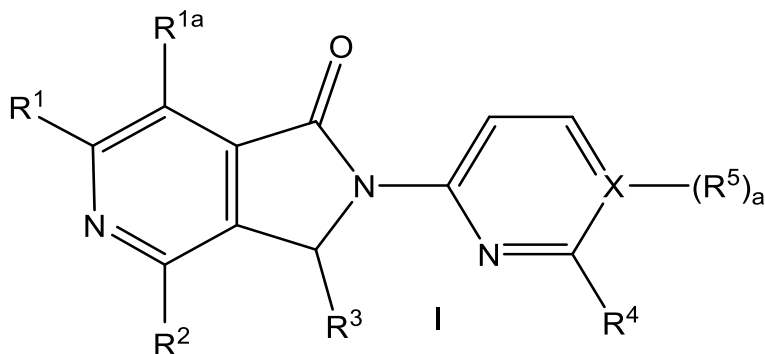


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la Fórmula I



o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, halo (C_1-C_6) alcoxi, $-N(R^6)(R^7)$, y (C_3-C_6) cicloalquilo, en donde dichos (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, y (C_3-C_6) cicloalquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, (C_1-C_6) alquilo, y (C_1-C_6) alcoxi;

R^6 y R^7 se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alcoxi, ciano e hidroxilo, o R^6 y R^7 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo (4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi y halo (C_1-C_6) alcoxi, en donde dichos (C_1-C_6) alquilo y halo (C_1-C_6) alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, (C_1-C_6) alquilo y (C_1-C_6) alcoxi;

R^{1a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno;

R^2 es:

i) $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, en donde m es un entero seleccionado de 0, 1, 2, o 3, y R^8 y R^9 se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alcoxi, ciano, e hidroxilo, o R^8 y R^9 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, $(C_1-$

C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, y (C₁-C₆)alcoxi;

ii) (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alcoxi, -N(R⁶)(R⁷), ciano, e hidroxilo, en donde R⁶ y R⁷ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo; o

iii) un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi y halo(C₁-C₆)alcoxi, en donde dichos (C₁-C₆)alquilo y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano y (C₁-C₆)alcoxi;

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi;

X es carbono o nitrógeno;

R⁴ es un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) o un heteroarilo(5 a 10 miembros), en donde dichos heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) y heteroarilo(5 a 10 miembros) se sustituyen opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, oxo, hidroxilo, -N(R¹⁰)(R¹¹), (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, halo(C₁-C₆)alcoxi y -(CH₂)_n(C₃-C₆)cicloalquilo, en donde dichos (C₁-C₆)alquilo y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano y (C₁-C₆)alcoxi, y en donde n es un entero seleccionado de 0, 1 o 2; y en donde R¹⁰ y R¹¹ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi; y

a es un entero seleccionado de 0 o 1, siempre que cuando X es nitrógeno a es 0.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es -N(R⁶)(R⁷), y R⁶ y R⁷ se

seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 halógenos.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R⁶ y R⁷ son cada uno metilo.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R⁶ y R⁷ son cada uno etilo.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R⁶ y R⁷ es hidrógeno y el otro es metilo.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R⁶ y R⁷ es metilo y el otro es etilo.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es un (C₁-C₆)alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, y ter-butilo.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es hidrógeno.

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es -N(R⁶)(R⁷) y R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) seleccionado del grupo que consiste en azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo, en donde el azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 10, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es azetidino que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 10, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es pirrolidinilo que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi.
13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es un (C_3-C_6) cicloalquilo, en donde dicho (C_3-C_6) cicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C_1-C_6) alquilo, y (C_1-C_6) alcoxi.
14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde dicho (C_3-C_6) cicloalquilo es ciclopropilo.
15. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, m es 1 y uno de R^8 y R^9 es hidrógeno y el otro es metilo.
16. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-14, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, m es 1 y R^8 y R^9 son hidrógeno.
17. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-14, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) y el heterocicloalquilo es azetidino.
18. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^3 es hidrógeno.
19. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^4 es un heteroarilo(5 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, hidroxilo, $-N(R^{10})(R^{11})$, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, halo (C_1-C_6) alcoxi, y $-(CH_2)_n(C_3-C_6)$ cicloalquilo, en donde n es un entero seleccionado de 0, 1, o 2; y en donde R^{10} y R^{11} se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo.
20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 19, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde el heteroarilo(5 a 6 miembros) es 1, 2, 3-triazolilo, 1, 2, 4-triazolilo o pirazolilo.

21. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-18, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^4 es un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, oxo, hidroxilo, $-N(R^{10})(R^{11})$, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, halo (C_1-C_6) alcoxi, y $-(CH_2)_n(C_3-C_6)$ cicloalquilo, en donde n es un entero seleccionado de 0, 1, o 2; y en donde R^{10} y R^{11} se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo.

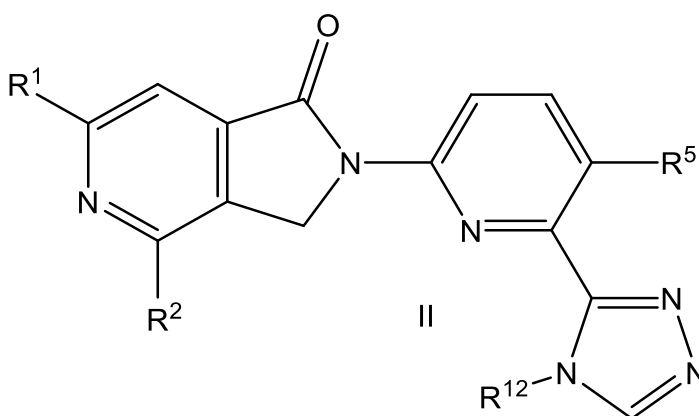
22. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 21, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde el heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) es oxazolidinilo que se sustituye opcionalmente con un sustituyente oxo.

23. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde X es nitrógeno, y a es 0.

24. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-22, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde X es carbono, a es 1 y R^5 es hidrógeno o halógeno.

25. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 24, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^5 es halógeno y el halógeno es flúor.

26. Un compuesto de la Fórmula II



o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, halo (C_1-C_6) alcoxi, $-N(R^6)(R^7)$, y (C_3-C_6) cicloalquilo, en donde dicho (C_3-C_6) cicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C_1-C_6) alquilo, y (C_1-C_6) alcoxi;

R^6 y R^7 se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo, o R^6 y R^7 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo (4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi;

R^2 es:

i) un $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, en donde m es un entero seleccionado de 0, 1, 2, o 3, y R^8 y R^9 se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo, o R^8 y R^9 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi; o

ii) un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi;

R^5 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi; y

R^{12} se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, y $-(CH_2)_n(C_3-C_6)$ cicloalquilo, en donde n es un entero 0 o 1.

27. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es $-N(R^6)(R^7)$, y R^6 y R^7 se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C_1-C_6) alquilo, en donde dicho (C_1-C_6) alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 halógenos.

28. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 27, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^6 y R^7 son cada uno metilo.

29. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 27, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^6 y R^7 son cada uno etilo.

30. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 27, o una sal de este aceptable

desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R⁶ y R⁷ es hidrógeno y el otro es metilo.

31. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 27, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R⁶ y R⁷ es metilo y el otro es etilo.

32. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es un (C₁-C₆)alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, y ter-butilo.

33. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es hidrógeno.

34. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es -N(R⁶)(R⁷) y R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

35. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 34, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) seleccionado del grupo que consiste en azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo, en donde el azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

36. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 35, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es azetidino que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

37. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 35, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es pirrolidino que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi.

38. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es un (C₃-C₆)cicloalquilo, en donde dicho (C₃-C₆)cicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C₁-C₆)alquilo, y (C₁-

C₆)alcoxi.

39. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 38, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde dicho (C₃-C₆)cicloalquilo es ciclopropilo.

40. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R² es - (CH₂)_mN(R⁸)(R⁹), m es 1 y uno de R⁸ y R⁹ es hidrógeno y el otro es metilo.

41. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R² es - (CH₂)_mN(R⁸)(R⁹), m es 1 y R⁸ y R⁹ son hidrógeno.

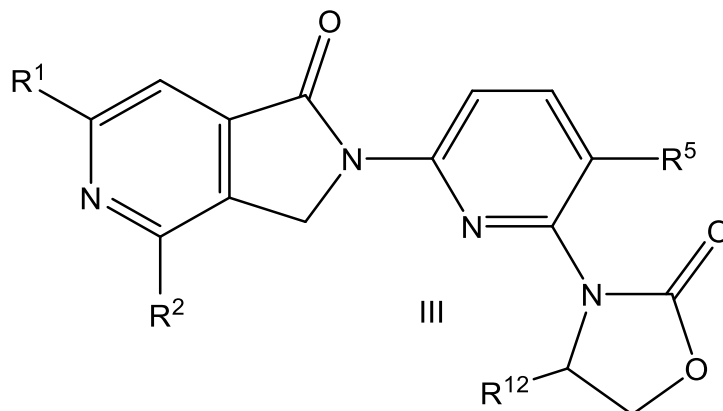
42. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R² es un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) y el heterocicloalquilo es azetidino.

43. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹² es (C₁-C₆)alquilo seleccionado del grupo que consiste en etilo, etilo, propilo, propilo, isopropilo, butilo, y ter-butilo.

44. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹² es halo(C₁-C₆)alquilo seleccionado del grupo que consiste en fluorometilo, fluoroetilo, difluorometilo, difluoroetilo, trifluorometilo, trifluorobutanilo, y trifluoropentanilo.

45. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26-39, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹² es -(CH₂)_n(C₃-C₆)cicloalquilo, en donde n es 1 y el (C₃-C₆)cicloalquilo es ciclopropilo.

46. Un compuesto de la Fórmula III



o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, halo(C₁-C₆)alcoxi, -N(R⁶)(R⁷), y (C₃-C₆)cicloalquilo, en

donde dicho (C₃-C₆)cicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C₁-C₆)alquilo, y (C₁-C₆)alcoxi;

R⁶ y R⁷ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo, o R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi;

R² es:

i) un -(CH₂)_mN(R⁸)(R⁹), en donde m es un entero seleccionado de 0, 1, 2, o 3, y R⁸ y R⁹ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo, o R⁸ y R⁹ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi; o

ii) un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi; y

R¹² se selecciona del grupo que consiste en (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, y -(CH₂)_n(C₃-C₆)cicloalquilo, en donde n es un entero 0 o 1.

47. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R¹ es -N(R⁶)(R⁷), y R⁶ y R⁷ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 halógenos.

48. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R⁶ y R⁷ son cada uno metilo.

49. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^6 y R^7 son cada uno etilo.
50. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R^6 y R^7 es hidrógeno y el otro es metilo.
51. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde uno de R^6 y R^7 es metilo y el otro es etilo.
52. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es un (C_1-C_6) alquilo seleccionado del grupo que consiste en metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, y ter-butilo.
53. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es hidrógeno.
54. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es $-N(R^6)(R^7)$ y R^6 y R^7 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi.
55. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) seleccionado del grupo que consiste en azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo, en donde el azetidino, pirrolidino, y azabicyclo[2.2.1]heptilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi.
56. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 55, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es azetidino que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi.
57. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 55, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es pirrolidino que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) alquilo, halo (C_1-C_6) alquilo, (C_1-C_6) alcoxi, y halo (C_1-C_6) alcoxi.
58. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 46, o una sal de este aceptable

desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^1 es un (C_3-C_6) cicloalquilo, en donde dicho (C_3-C_6) cicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, (C_1-C_6) alquilo, y (C_1-C_6) alcoxi.

59. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 58, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde dicho (C_3-C_6) cicloalquilo es ciclopropilo.

60. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, m es 1 y uno de R^8 y R^9 es hidrógeno y el otro es metilo.

61. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es $-(CH_2)_mN(R^8)(R^9)$, m es 1 y R^8 y R^9 son hidrógeno.

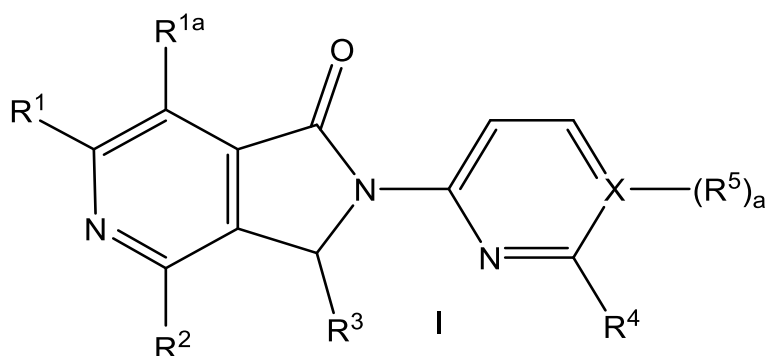
62. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^2 es un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) y el heterocicloalquilo es azetidino.

63. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^{12} es (C_1-C_6) alquilo seleccionado del grupo que consiste en etilo, etilo, propilo, propilo, isopropilo, butilo, y ter-butilo.

64. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^{12} es halo (C_1-C_6) alquilo seleccionado del grupo que consiste en fluorometilo, fluoroetilo, difluorometilo, difluoroetilo, trifluorometilo, trifluorobutanilo, y trifluoropentanilo.

65. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 46-59, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde R^{12} es $-(CH_2)_n(C_3-C_6)$ cicloalquilo, en donde n es 1 y el (C_3-C_6) cicloalquilo es ciclopropilo.

66. Un compuesto de la Fórmula I,



o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, halo(C₁-C₆)alcoxi, -N(R⁶)(R⁷), y (C₃-C₆)cicloalquilo, en donde dichos (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, y (C₃-C₆)cicloalquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxí, ciano, (C₁-C₆)alquilo, y (C₁-C₆)alcoxi;

R⁶ y R⁷ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alcoxi, ciano, e hidroxí, o R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 8 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, y halo(C₁-C₆)alcoxi, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo, y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxí, ciano, (C₁-C₆)alquilo, y (C₁-C₆)alcoxi;

R^{1a} es H;

R² es CH₂N(R⁸)(R⁹), en donde R⁸ y R⁹ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)alcoxi, ciano e hidroxí, o R⁸ y R⁹ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo (4 a 6 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxí, (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi y halo(C₁-C₆)alcoxi, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxí, ciano y (C₁-C₆)alcoxi; y

R³ es H;

X es carbono;

R⁵ es hidrógeno;

a es 1; y

R⁴ es un heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) o un heteroarilo(5 a 10 miembros), en donde dichos heterocicloalquilo(4 a 6 miembros) y heteroarilo(5 a 10 miembros) se sustituyen opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, oxo, hidroxí, -N(R¹⁰)(R¹¹), (C₁-C₆)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, halo(C₁-C₆)alcoxi y -(CH₂)_n(C₃-C₆)cicloalquilo, en donde dichos (C₁-C₆)alquilo

y halo(C₁-C₆)alquilo se sustituyen opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano y (C₁-C₆)alcoxi, y en donde n es un entero seleccionado de 0, 1 o 2; y en donde R¹⁰ y R¹¹ se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₆)alquilo, en donde dicho (C₁-C₆)alquilo se sustituye opcionalmente con 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno e hidroxilo.

67. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 66, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ se selecciona del grupo que consiste en (C₁-C₄)alquilo, CF₃, -N(R⁶)(R⁷), y (C₃-C₄)cicloalquilo, en donde dicho (C₃-C₄)cicloalquilo se sustituye opcionalmente con un CH₃;

R⁶ y R⁷ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₃)alquilo, o

R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 5 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a dos sustituyentes de CH₃;

R² es CH₂N(R⁸)(R⁹), en donde R⁸ es hidrógeno y R⁹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y CH₃; y

R⁴ es un heterocicloalquilo(5 miembros) o un heteroarilo(5 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo(5 miembros) es 1,3-oxazolidin-3-il y dicho heteroarilo(5 miembros) es 1H-pirazolilo o triazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en oxo, (C₁-C₅)alquilo, halo(C₁-C₅)alquilo, y -CH₂-ciclopropilo.

68. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 66, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ se selecciona del grupo que consiste en (C₁-C₄)alquilo, CF₃, -N(R⁶)(R⁷), y (C₃-C₄)cicloalquilo, en donde dicho (C₃-C₄)cicloalquilo se sustituye opcionalmente con un CH₃;

R⁶ y R⁷ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₃)alquilo, o

R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 5 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a dos sustituyentes de CH₃;

R² es CH₂N(R⁸)(R⁹), en donde R⁸ es hidrógeno y R⁹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y CH₃; y

R⁴ es un heterocicloalquilo(5 miembros) o un heteroarilo(5 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo(5 miembros) es 2-oxo-1,3-oxazolidin-3-ilo, opcionalmente

sustituido con 1 CH₃, CH₂F, CHF₂ o CF₃, y dicho heteroarilo(5 miembros) es 1_H-pirazolilo o triazolilo, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (C₁-C₅)alquilo, halo(C₁-C₅)alquilo y -CH₂-ciclopropilo.

69. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 66, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ se selecciona del grupo que consiste en -N(R⁶)(R⁷), y (C₃-C₄)cicloalquilo, en donde dicho (C₃-C₄)cicloalquilo se sustituye opcionalmente con un CH₃;

R⁶ y R⁷ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₃)alquilo, o

R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterocicloalquilo(4 a 5 miembros) que se sustituye opcionalmente con uno a dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en CH₃, o halo(C₁)alquilo;

R² es -CH₂N(R⁸)(R⁹), en donde R⁸ y R⁹ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y CH₃; y

R⁴ es un heterocicloalquilo(5 miembros) o un heteroarilo(5 miembros), en donde dicho heterocicloalquilo(5 miembros) es 2-oxo-1,3-oxazolidin-3-ilo, opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado del grupo que consiste en CH₃, CHF₂- y CH₂F, y dicho heteroarilo(5 miembros) es imidazolilo, 1_H-pirazolilo, tiadiazolilo o triazolilo, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en (C₁-C₅)alquilo, halo(C₁-C₆)alquilo y -(C₄-C₅)cicloalquilo, en donde dicho (C₁-C₅)alquilo se sustituye opcionalmente con un hidroxilo.

70. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 66, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R¹ es -N(R⁶)(R⁷);

R⁶ y R⁷ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y (C₁-C₃)alquilo, o

R⁶ y R⁷ junto con el nitrógeno al que están unidos forman pirrolidin-1-ilo, opcionalmente sustituido con 1 a 2 CH₃;

R² es -CH₂N(R⁸)(R⁹), en donde R⁸ y R⁹ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y CH₃; y

R⁴ es triazol-3-ilo, sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en CH₃-, CH₃-CH₂- y CH₃-CH₂-CH₂-.

71. Un compuesto de la Fórmula I, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto se selecciona del grupo que consiste en:

4-[(metilamino)metil]-6-[metil(propan-2-il)amino]-2-[6-(4-propil-4_H-1,2,4-triazol-

3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona;

4-[(metilamino)metil]-6-[(2*R*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2-[6-(4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona;

4-[(metilamino)metil]-2-[6-(5-metil-4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-6-[(2*R*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona;

4-[(metilamino)metil]-6-[metil(propan-2-il)amino]-2-[6-(5-metil-4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona; y

4-(aminometil)-2-[6-(4-etil-5-metil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-6-[(2*S*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona.

72. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 71, o una sal de este aceptables desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto es 4-[(metilamino)metil]-6-[metil(propan-2-il)amino]-2-[6-(4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona.

73. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 71, o una sal de este aceptables desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto es 4-[(metilamino)metil]-6-[(2*R*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2-[6-(4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona.

74. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 71, o una sal de este aceptables desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto es 4-[(metilamino)metil]-2-[6-(5-metil-4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-6-[(2*R*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona

75. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 71, o una sal de este aceptables desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto es 4-[(metilamino)metil]-6-[metil(propan-2-il)amino]-2-[6-(5-metil-4-propil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona.

76. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 71, o una sal de este aceptables desde el punto de vista farmacéutico, en donde el compuesto es 4-(aminometil)-2-[6-(4-etil-5-metil-4*H*-1,2,4-triazol-3-il)piridin-2-il]-6-[(2*S*)-2-metilpirrolidin-1-il]-2,3-dihidro-1H-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-ona.