



1/15

TM TAMAYO

ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

Señor

JEFE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.



No. 09-126919- -00011-0000

Fecha: 2013-01-09 16:04:28 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act: 523 RESPUESTA Folios: 15

REF: EXPEDIENTE: 09-126919

TITULO: "COMPUESTO DE PIRIDO (2,3-D) PIRIMIDINA-7-  
ONA COMO INHIBIDORES DE..."

ACTUACIÓN: RESPUESTA A EXAMEN DE PATENTABILIDAD

CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ, mayor de edad, vecino de esta ciudad, identificado con la Cédula de Ciudadanía No.17.117.818 expedida en Bogotá, Abogado titulado en ejercicio y portador de la Tarjeta Profesional No. 17.402 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad EXELIXIS, INC., según poder debidamente conferido y legalizado, adjunto a las diligencias administrativas de la referencia.

Encontrándome dentro del término legal comparezco para responder el oficio de Requerimiento No. 16528 del Examen de Patentabilidad emanado de esa Oficina **del cual pedimos prórroga**, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de 2.000 de C.A.N, damos respuesta en los siguientes términos.

#### 4.- Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 D 486)

**COLOMBIA:**Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América**USA:**COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



Para atender el requerimiento respecto de las reivindicaciones que no son patentables por no cumplir con lo establecido en los artículo 14 y 21 de la Decisión 486, y argumenta que las reivindicaciones 29 a 32 no son patentables por referirse a usos.

Se han modificado el pliego reivindicatorio eliminando además estas reivindicaciones 29 a 32. Cumpliendo con lo manifestado por el señor examinador.

## **5.- De la solicitud de patente**

### **5.1. Reivindicaciones**

Para atender el requerimiento, según el Artículo 30 de la Decisión 486, el señor Examinador señala que en las reivindicaciones 1 a 28 el término "opcionalmente", es ambiguo porque hace eventualmente la selección y no permite distinguir la invención del estado de la técnica, el solicitante respetuosamente manifiesta:

Con referencia a las objeciones relacionadas con la falta de claridad de las reivindicaciones (Art. 30 de la Dec. 486) el Sr. Examinador objetó las reivindicaciones originales 1-28 por considerarlas ambiguas por el uso del término "opcionalmente" El Sr. Examinador recomendó sustituir dicho término por un rango definido de sustituyentes. El Solicitante desea señalar que los párrafos [0055-0058] de la memoria de la solicitud PCT tal como fue presentada definen específicamente el uso del término "opcionalmente" como se usa en las actuales reivindicaciones.

**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



El Sr. Examinador objetó además las reivindicaciones originales 1 a 3 como no concisas debido al uso de términos generales como heteroarilo, arilalquilo, cicloalquilo, arilo, heterocicloalquilo, porque no definen inequívocamente los sustituyentes. En las nuevas reivindicaciones, se han definido más específicamente los términos generales de manera de cumplimentar con la petición del Sr. Examinador.

Además, el Sr. Examinador solicitó que las reivindicaciones se limiten a los radicales más representativos de los compuestos de fórmula I descritos en la especificación. Como se señaló antes, se han modificado las reivindicaciones de acuerdo a las actuales reivindicaciones pendientes en la Oficina Europea de Patentes, y presentamos además los argumentos utilizados en el trámite de la solicitud equivalente en Europa.

En consecuencia, se presenta:

- Nuevo pliego reivindicatorio que consta de 12 reivindicaciones, en reemplazo del anterior

El nuevo pliego que presentamos es similar al que se encuentra actualmente en estudio en la Oficina Europea.

Este pliego reivindicatorio que contiene 12 reivindicaciones, todas ellas sustentadas en la descripción original de la invención, con un contenido que se ajusta a los límites impuestos por la memoria descriptiva original, por lo que no exceden el alcance de la invención.

**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



Se aclara al señor examinado que con la modificación a reivindicaciones radicada ante su despacho el 13-09-2010 se realizó un pago con recibo No. 10-75420 por excedente de reivindicaciones 23. El nuevo pliego no excede el inicial, si no que por el contrario son menores al excedente pagado, como puede verificarlo en el expediente.

#### 6.- Determinación del Estado de la técnica:

En cuanto a la falta de Novedad planteada por el señor. Examinador, con base los documento D1, D2 y D3, el solicitante manifiesta respetuosamente:

En cuanto al estado de la técnica, el Sr. Examinador ha citado los siguientes documentos:

|    | PUBLICACIÓN NÚMERO                          |
|----|---------------------------------------------|
| D1 | CO 09-126919 (Corresponde a WO 2008/032162) |
| D2 | WO 1996/34867                               |
| D3 | WO 2005/105801                              |

#### Novedad:

El Sr. Examinador objetó las reivindicaciones 1 y 33 originales como carentes de novedad frente a D1, que se corresponde con el documento WO 2008/032162. El Sr. Examinador alega que los compuestos descritos en D1 poseen un grupo heterocíclico en el posición 8 del anillo pyridopirimidona, y por lo tanto las características técnicas esenciales de la estructura y el proceso de los compuestos de fórmula I fueron descriptos anteriormente.



#### COLOMBIA:

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### USA:

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



D1 reivindica prioridad de tres solicitudes provisionales.

| Código              | Cita         | Fecha de presentación |
|---------------------|--------------|-----------------------|
| P1 de EX07-007C-EP  | 60/911160    | 11/04/07              |
| PCT of EX07-007C-EP | WO 08/127712 | 11/04/08              |
| D1                  | WO 08/032162 | 03/09/07              |
| D1 P3               | 60/952628    | 30/07/07              |
| D1 P2               | 60/947852    | 30/07/07              |
| D1 P1               | 60/845065    | 15/09/06              |

Sin embargo, ninguno de los compuestos de D1 con un grupo heterocíclico en la posición 8 fue revelado en la primera solicitud provisional D1 (D1 P1). Estos compuestos se añadieron sólo en la segunda y tercera solicitudes provisionales (D1 P2 y D1 P3). Las fechas de presentación de D1 P2 y D1 P3 son posteriores a la fecha de presentación de P1 de la presente solicitud. Por lo tanto, D1 no destruye la novedad de la presente solicitud y los ejemplos enumerados por el Sr. Examinador no pueden citarse como Estado de la técnica.

#### Actividad Inventiva:

El Sr. Examinador ha planteado una objeción sobre la actividad inventiva frente a los documentos D2 (WO1996/34867) y D3 (WO2005/105801). Estas objeciones a la actividad inventiva no tienen fundamento por las siguientes razones.



#### COLOMBIA:

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### USA:

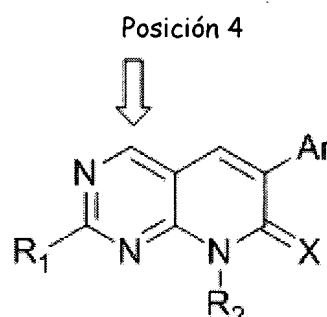
COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



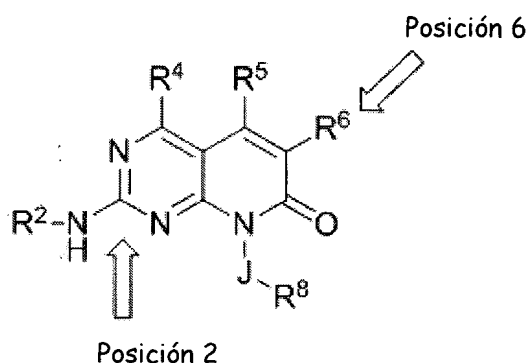
D2 describe piridopirimidonas de Fórmula I:



D2, Fórmula I, Reivindicación 1 (reivindicación 40)

En primer lugar, D2 no está dirigido a la inhibición de PI3K. Así, un experto en la materia no vería a D2 como una guía para buscar compuestos inhibidores de PI3K. Además, los compuestos en D2 carecen de un grupo alquilo en la posición 4 del anillo de piridopirimidinona, lo que es distinto a los compuestos descritos en la presente solicitud. Finalmente, R2 en la posición de 8 de la fórmula I de D2, puede ser arilo, alquilo o cicloalquilo, pero no hay ninguna opción para que R2 en D2 sea heterocicloalquilo.

La reivindicación 1 de D3 describe compuestos de piridopirimidona con actividad PI3K que tienen la siguiente estructura:

**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)

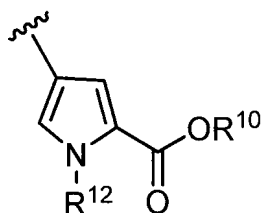


### D3, Reivindicación 1

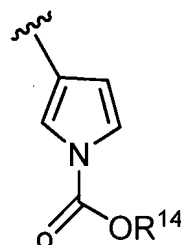
Existen varias diferencias entre D3 y la presente solicitud, que incluyen:

D3 se refiere a compuestos donde el grupo en la posición 6 es "H, halo, fenilo, o un grupo C1-C3 alquilo ". En contraste, la posición 6 de los compuestos de la presente solicitud siempre lleva un grupo heteroarilo;

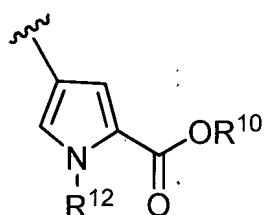
- ✓ El grupo en la posición 2 en D3 es  $-NHR^2$ , donde  $R^2$  es



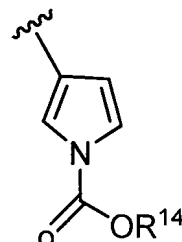
o



- ✓ En contraste a ello, la posición 2 en la presente invención siempre lleva un grupo  $-NH_2$  o  $-NH$  (alquilo); y
- ✓ Los grupos
- ✓



o



#### COLOMBIA:

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

#### USA:

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



TM TAMAYO  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

en la posición 2 de D3 no darían expectativas de presentar propiedades similares a las de los grupos  $-NH_2$  o  $-NH$  (alquilo) de la presente invención.

Por lo tanto, no puede considerarse que haya una orientación en D2 o D3, ya sea solo o en combinación, que llevaría a una persona con experiencia en la técnica, a hacer todos los cambios necesarios para llegar a la invención del Solicitante.

Además, se han caracterizado todas las reivindicaciones, cumplimentando así lo dispuesto por las Disposiciones locales.

En virtud de las enmiendas realizadas y los argumentos precedentes, y el nuevo pliego reivindicatorio, la presente invención resulta novedosa e inventiva frente a los documentos citados

De acuerdo con el nuevo pliego reivindicatorio anexo, la presente invención cumple con los requisitos de patentabilidad exigidos en el Art. 14 de la Decisión 486/2000 de la C.A.N, en el sentido de Novedad, Nivel inventivo y Aplicación Industrial.

Por lo antes expuesto, ruego a usted dar por subsanado dicho requerimiento, sin perjuicio de lo cual desde ya nos acogemos a lo dispuesto por el inciso segundo del artículo 45 de la decisión 486 de la Comunidad Andina de Naciones que a la letra dice: “(...) Cuando la oficina nacional competente estimare que ello es necesario para los fines del examen de patentabilidad, podrá notificar al solicitante dos o más veces (...)” (Subrayado para destacar).



**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)



**TM TAMAYO**  
ROYALTIES • PATENTS • TRADEMARKS

## NOTIFICACIONES

Mi poderdante y yo recibiremos notificaciones en la Secretaría de su Despacho o en mi Oficina de Abogado ubicada en la Carrera 13A No. 28-38 Ofc. 230 MZ. 2 Parque Central Bavaria de la ciudad de Bogotá D.C.

Del señor Jefe,

CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ

No.17.117.818 expedida en Bogotá,

T.P No. 17.402 del C.S.J.



**COLOMBIA:**

Carrera 13-A No. 28-38 Bufete 230  
Tel (571) 341 9841 / Fax (571) 243 5423  
Parque Central Bavaria  
Bogotá D.C. / Colombia / Sur América

**USA:**

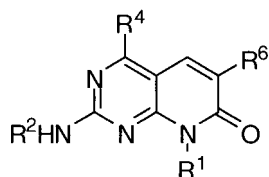
COL 12010 TM Tamayo  
10000 NW 25 Th St Unit 1 L  
33172-2204  
MIAMI / FL, U.S.A.

E-mail: [consultas@tmtamayo.net](mailto:consultas@tmtamayo.net)  
[ip@tmtamayo.com](mailto:ip@tmtamayo.com)

Web: [www.tmtamayo.com](http://www.tmtamayo.com)

# REIVINDICACIONES

1. Un compuesto caracterizado por la fórmula I



I

opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos, donde

R¹ es heterocicloalquilo de 5 ó 6 miembros;

R² es hidrógeno o (C₁-C₆) alquilo;

R⁴ es (C₁-C₆) alquilo;

R⁶ es heteroarilo de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 grupos R⁹;

cada R⁹, cuando está presente, es, de modo independiente, halo, (C₁-C₆) alquilo, halo (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alcoxi, halo(C₁-C₆) alcoxi, ciano, amino, (C₁-C₆) alquilamino, (C₁-C₆) dialquilamino, (C₁-C₆) alcoxialquilo, (C₁-C₆) carboxialquilo, (C₁-C₆) alcoxycarbonilo, (C₁-C₆) aminoalquilo, (C₃-C₁₀) cicloalquilo, (C₆-C₁₄) arilo, (C₁-C₆) arilalquilo, (C₁-C₆) ariloxi, (C₃-C₁₂) heterocicloalquilo o (C₅-C₁₄) heteroarilo y donde el (C₃-C₁₀) cicloalquilo, (C₆-C₁₄) arilo, (C₃-C₁₂) heterocicloalquilo y (C₅-C₁₄) heteroarilo, cada uno solo o como parte de otro grupo dentro de R⁹, están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3 ó 4 grupos seleccionados de halo, (C₁-C₆) alquilo, halo (C₁-C₆) alquilo, hidroxilo, (C₁-C₆) alcoxi, halo(C₁-C₆) alcoxi, amino, (C₁-C₆) alquilamino y (C₁-C₆) dialquilamino.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque  $R^1$  es un heterocicloalquilo de 5 ó 6 miembros, donde el heterocicloalquilo comprende un heteroátomo que es -O-; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 caracterizado porque  $R^6$  es un heteroarilo de 5 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos  $R^9$ ; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque  $R^6$  es pirazolilo, imidazolilo, tienilo, furanilo, pirrolilo o tiazolilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos  $R^9$ ; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque  $R^6$  es pirazolilo, imidazolilo o tiazolilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos  $R^9$ ; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque  $R^6$  es heteroarilo de 6 miembros opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos  $R^9$ ; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

7. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5 ó 6, caracterizado porque  $R^2$  es hidrógeno; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

8. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5 ó 6, caracterizado porque  $R^2$  es etilo o metilo; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

9. Los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8, caracterizado porque  $R^4$  es metilo; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque es seleccionado de:

| Nombre                                                                                        |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2-amino-4-metil-6-(1H-pirazol-5-il)-8-(tetrahidrofuran-3-il)pirido[2,3-d]pirimidin-7(8H)-ona; |

| Nombre                                                                                                                                              |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;              |
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;              |
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-4-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;               |
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;               |
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona; |
| 2-amino-4-metil-6-(1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona; |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                                     |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                       |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                       |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-4-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                        |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il)-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                        |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;          |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-2-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;          |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                           |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;             |

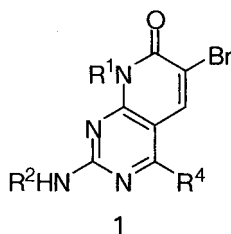
| Nombre                                                                                                                                               |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidrofuran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;              |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-4-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;               |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;               |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona; |
| 2-amino-6-(1 <i>H</i> -imidazol-2-il)-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona; |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidrofuran-3-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                                      |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                        |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidrofuran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                        |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-4-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                         |
| 2-amino-4-metil-8-(tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il)-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona;                         |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>S</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona; y         |
| 2-amino-4-metil-8-[(3 <i>R</i> )-tetrahidro-2 <i>H</i> -piran-3-il]-6-(1,3-tiazol-5-il)pirido[2,3- <i>d</i> ]pirimidin-7(8 <i>H</i> )-ona            |

donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

11. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 10 y un portador, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptables; donde el compuesto está opcionalmente como una sal farmacéuticamente aceptable, de modo adicional opcionalmente como un solvato y de modo adicional opcionalmente como uno de sus hidratos.

12. Un método de preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende:

- (a) hacer reaccionar un intermediario de la fórmula 1



donde  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^4$  son como se definen en la reivindicación 1, con un intermediario de la fórmula  $R^6\text{Sn}(n\text{-Bu})_3$  o  $R^6\text{B}(\text{OH})_2$  donde  $R^6$  y  $R^9$  son como se definen en la reivindicación 1 para obtener un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1;

- (b) opcionalmente también modificar uno de los grupos  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$  y  $R^6$ ; y
- (c) opcionalmente formar una de sus sales, solvatos y/o hidratos farmacéuticamente aceptables.