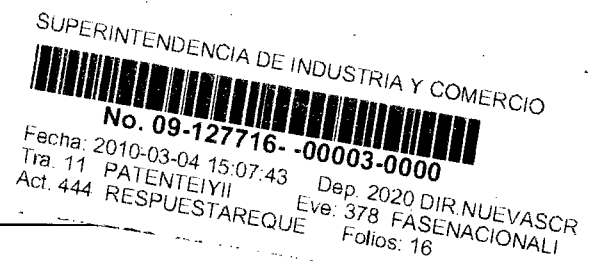


Señor
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y C
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
E. _____ S. _____



Re: PI.-ASTRAZENECA AB Y ASTEX THERAPEUTICS LTD.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE PIRROLOPIRIDINA Y SU USO COMO INHIBIDORES DE BACE".- Clase C07D 471/04.-Expediente número 09-127.716.-

1. Me refiero al Oficio No. **382** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 15 de Enero de 2010.

2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar el recibo de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 16 a 41, las cuales deberán ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Recibo número 10-15,947, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa mencionada; y

(b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por 41 reivindicaciones.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 15,947

FECHA : MARZO 1 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-127716- -00003-0000

Fecha: 2010-03-04 15:07:43 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 16

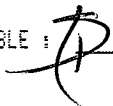
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLORERA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	52817575	01/03/2010	17,954,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
			TOTAL : \$ 676,000.00

SON: SEISCIENTOS SETENTA Y SEIS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

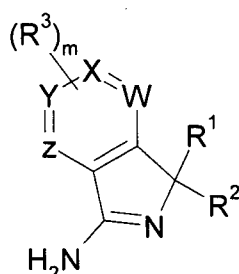
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

107

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de acuerdo con la Fórmula I:



I

en la que

R¹ se selecciona entre arilo y heteroarilo, donde dicho arilo o heteroarilo está

opcionalmente sustituido con uno o más R⁴; y donde dicho arilo o heteroarilo se fusiona
opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7
miembros para formar un sistema de anillo bicíclico, donde dicho sistema de anillo
bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más R⁴;

R² se selecciona entre arilo y heteroarilo, donde dicho arilo o heteroarilo está
opcionalmente sustituido con uno o más R⁴; y donde dicho arilo o heteroarilo se fusiona
opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7
miembros para formar un sistema de anillo bicíclico, donde dicho sistema de anillo
bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más R⁴;

R³ se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, CHO, C₀₋₆alquilCN, OC₁₋₆alquilCN, C₀₋₆alquilOR⁵, OC₂₋₆alquilOR⁵, C₀₋₆alquilNR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilOC₂₋₆alquilNR⁵R⁶, C₀₋₆alquilCO₂R⁵, OC₁₋₆alquilCO₂R⁵, C₀₋₆alquilCONR⁵R⁶, OC₁₋₆alquilCONR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(CO)R⁶, C₀₋₆alquilNR⁵(CO)R⁶, O(CO)NR⁵R⁶,
NR⁵(CO)OR⁶, NR⁵(CO)NR⁵R⁶, O(CO)OR⁵, O(CO)R⁵, C₀₋₆alquilCOR⁵, OC₁₋₆alquilCOR⁵,
NR⁵(CO)(CO)R⁵, NR⁵(CO)(CO)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilSR⁵, C₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, OC₁₋₆alquilNR⁵(SO₂)R⁶, OC₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, OC₁₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilOSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSO₃R⁵, C₀₋₆alquilNR⁵(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₁₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋

- $\text{C}_6\text{alquilSOR}^5$, $\text{C}_{1-6}\text{alquilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquenilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquenilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_6\text{cicloalquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheteroarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheterociclilo}$ y $\text{OC}_{2-6}\text{alquilheterociclilo}$, donde dicho $\text{C}_{1-6}\text{alquilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquenilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquenilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_6\text{cicloalquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheteroarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheterociclilo}$ o $\text{OC}_{2-6}\text{alquilheterociclilo}$ está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} , y donde cualquiera de los grupos arilo o heteroarilo individuales se puede fusionar opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros para formar un sistema de anillo bicíclico en el que el sistema de anillo bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más A;
- W es C o N;
 X es C o N;
 Y es C o N;
 Z es C o N;
- siempre que cuando:
- W y X sean N, Y y Z sean C;
 W e Y sean N, X y Z sean C;
 W y Z sean N, X e Y sean C;
 X e Y sean N, W y Z sean C;
 X y Z sean N, W e Y sean C;
 Y y Z sean N, W y X sean C;
 W, X e Y sean C, Z sea N;
 W, X y Z sean C, Y sea N;
 W, Y y Z sean C, X sea N;
 X, Y y Z sean C, W = N;
- m es 0, 1, 2 ó 3;

- R^4 se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, SF_5 , OSF_5 , CHO, $\text{C}_{0-6}\text{alquilCN}$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilCN}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilOR}^5$, $\text{OC}_{2-6}\text{alquilOR}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilNR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{2-6}\text{alquilNR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{2-6}\text{alquilOC}_{2-6}\text{alquilNR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilCO}_2\text{R}^5$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilCO}_2\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilCONR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilCONR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{2-6}\text{alquilNR}^5(\text{CO})\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilNR}^5(\text{CO})\text{R}^6$, $\text{O}(\text{CO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5(\text{CO})\text{OR}^6$, $\text{NR}^5(\text{CO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{O}(\text{CO})\text{OR}^5$, $\text{O}(\text{CO})\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilCOR}^5$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilCOR}^5$,

NR⁵(CO)(CO)R⁵, NR⁵(CO)(CO)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilSR⁵, C₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, OC₁₋₆alquilNR⁵(SO₂)R⁶, OC₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, OC₁₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilOSO₂R⁵, SO₃R⁵, C₀₋₆alquilNR⁵(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₁₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSOR⁵, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo y OC₂₋₆alquilheterociclilo, donde dicho C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo o OC₂₋₆alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más

10 R¹¹, y donde cualquiera de los grupos arilo o heteroarilo individuales se puede fusionar opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros para formar un sistema de anillo bicíclico en el que el sistema de anillo bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más A;

15 R⁵ se selecciona entre hidrógeno, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo y C₁₋₆alquilNR⁷R⁸, donde dicho C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo o C₀₋₆alquilheterociclilo está

20 opcionalmente sustituido con uno o más A;

R⁶ se selecciona entre hidrógeno y C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilOR⁷, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo y C₁₋₆alquilNR⁷R⁸, donde dicho

25 C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo o C₀₋₆alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A; o

R⁵ y R⁶ pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno

30 o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S que esté opcionalmente sustituido con A; siempre que dos grupos R⁵ estén presentes en la estructura pueden entonces, opcionalmente, formar juntos un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contenga uno

o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S, que esté opcionalmente sustituido con uno o más A;

5 R^7 y R^8 se seleccionan independientemente entre hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo, C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo y C_{0-6} alquilheteroarilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo, C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo o C_{0-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A; o

10 R^7 y R^8 pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S opcionalmente sustituido con uno o más A;

A se selecciona entre oxo, halógeno, nitro, SF_5 , OSF_5 , CN, OR^9 , C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquilheterociclilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, OC_{2-6} alquil NR^9R^{10} , NR^9R^{10} , $CONR^9R^{10}$, $NR^9(CO)R^{10}$, $O(CO)C_{1-6}$ alquilo, $(CO)OC_{1-6}$ alquilo, COR^9 , $(SO_2)NR^9R^{10}$, NSO_2R^9 , SO_2R^9 , SOR^9 , $(CO)C_{1-6}$ alquil NR^9R^{10} , $(SO_2)C_{1-6}$ alquil NR^9R^{10} , OSO_2R^9 y SO_3R^9 , donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo o C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo está opcionalmente sustituido con halo, OSO_2R^9 , SO_3R^9 , nitro, ciano, OR^9 , C_{1-6} alquilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi;

25 R^9 y R^{10} se seleccionan independientemente entre hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{3-6} cicloalquilo, C_{3-6} cicloalquenilo, C_6 cicloalquinilo, arilo, heteroarilo y heterociclilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{3-6} cicloalquilo, C_{3-6} cicloalquenilo, C_6 cicloalquinilo, arilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres hidroxilo, ciano, halógeno o C_{1-3} alquilo; o

30 R^9 y R^{10} pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S opcionalmente sustituido con hidroxilo, C_{1-3} alquilo, ciano o halógeno;

R^{11} se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, SF_5 , OSF_5 , CHO, C_{0-6} alquilCN, OC_{1-6} alquilCN, C_{0-6} alquilOR⁸, OC_{1-6} alquilOR⁸, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, C_{0-6} alquilNR⁵R⁶, OC_{2-6} alquilNR⁵R⁶, OC_{2-6} alquilOC₂₋₆alquilNR⁵R⁶,
 5 NR⁵OR⁶, C_{0-6} alquilCO₂R⁵, OC_{1-6} alquilCO₂R⁵, C_{0-6} alquilCONR⁵R⁶, OC_{1-6} alquilCONR⁵R⁶,
 OC_{2-6} alquilNR⁵(CO)R⁶, C_{0-6} alquilNR⁵(CO)R⁶, O(CO)NR⁵R⁶, NR⁵(CO)OR⁶,
 NR⁵(CO)NR⁵R⁶, O(CO)OR⁵, O(CO)R⁵, C_{0-6} alquilCOR⁵, OC_{1-6} alquilCOR⁵,
 NR⁵(CO)(CO)R⁶, NR⁵(CO)(CO)NR⁵R⁶, C_{0-6} alquilSR⁵, C_{0-6} alquil(SO₂)NR⁵R⁶, OC_{2-6}
 $alquilNR^5(SO_2)R^6$, $OC_{0-6}alquil(SO_2)NR^5R^6$, $C_{0-6}alquil(SO)NR^5R^6$, OC_{1-6}
 10 $alquil(SO)NR^5R^6$, OSO_2R^5 , SO_3R^5 , $C_{0-6}alquilNR^5(SO_2)NR^5R^6$, $C_{0-6}alquilNR^5(SO)R^6$,
 $OC_{2-6}alquilNR^5(SO)R^6$, $OC_{1-6}alquilSO_2R^5$, $C_{0-6}alquilSO_2R^5$, $C_{0-6}alquilSOR^5$, $C_{1-6}alquilo$,
 $C_{2-6}alqueno$, $C_{2-6}alquino$, $C_{0-6}alquilC_{3-6}cicloalquilo$, $C_{0-6}alquilC_{3-6}cicloalqueno$, C_{0-6}
 $alquilC_6cicloalquino$, $C_{0-6}alquilarilo$, $C_{0-6}alquilheteroarilo$, $C_{0-6}alquilheterociclilo$ y OC_{2-6}
 $alquilheterociclilo$, donde dicho $C_{1-6}alquilo$, $C_{2-6}alqueno$, $C_{2-6}alquino$, $C_{0-6}alquilC_{3-6}$
 15 $cicloalquilo$, $C_{0-6}alquilC_{3-6}cicloalqueno$, $C_{0-6}alquilC_6cicloalquino$, $C_{0-6}alquilarilo$, C_{0-6}
 $alquilheteroarilo$, $C_{0-6}alquilheterociclilo$ o $OC_{2-6}alquilheterociclilo$ está opcionalmente
 sustituido con uno o más A;

como una base libre o una de sus sales, solvatos o solvatos de una sal farmacéuticamente
 aceptables.

20 2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que
 R^1 se selecciona entre arilo y heteroarilo, donde dicho arilo o heteroarilo está
 opcionalmente sustituido con uno o más R^4 ;

25 R^2 se selecciona entre arilo y heteroarilo, donde dicho arilo o heteroarilo está
 opcionalmente sustituido con uno o más R^4 ;

R^3 se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, CHO, C_{0-6} alquilCN, OC_{1-6}
 $alquilCN$, $C_{0-6}alquilOR^5$, $OC_{2-6}alquilOR^5$, $C_{0-6}alquilNR^5R^6$, $OC_{2-6}alquilNR^5R^6$, OC_{2-6}
 30 $alquilOC_{2-6}alquilNR^5R^6$, $C_{0-6}alquilCO_2R^5$, $OC_{1-6}alquilCO_2R^5$, $C_{0-6}alquilCONR^5R^6$, OC_{1-6}
 $alquilCONR^5R^6$, $OC_{2-6}alquilNR^5(CO)R^6$, $C_{0-6}alquilNR^5(CO)R^6$, O(CO)NR⁵R⁶,
 NR⁵(CO)OR⁶, NR⁵(CO)NR⁵R⁶, O(CO)OR⁵, O(CO)R⁵, $C_{0-6}alquilCOR^5$, $OC_{1-6}alquilCOR^5$,

$\text{NR}^5(\text{CO})(\text{CO})\text{R}^5$, $\text{NR}^5(\text{CO})(\text{CO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilSR}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquil}(\text{SO}_2)\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilNR}^5(\text{SO}_2)\text{R}^6$, $\text{OC}_{0-6}\text{alquil}(\text{SO}_2)\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquil}(\text{SO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquil}(\text{SO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquil}(\text{SO})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilOSO}_2\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilSO}_3\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilNR}^5(\text{SO}_2)\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilNR}^5(\text{SO})\text{R}^6$, $\text{OC}_{2-6}\text{alquilNR}^5(\text{SO})\text{R}^6$, $\text{OC}_{1-6}\text{alquilSO}_2\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilSO}_2\text{R}^5$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilSOR}^5$, $\text{C}_{1-6}\text{alquilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquenilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquenilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_6\text{cicloalquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheteroarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheterociclilo}$ y $\text{OC}_{2-6}\text{alquilheterociclilo}$, donde dicho $\text{C}_{1-6}\text{alquilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquenilo}$, $\text{C}_{2-6}\text{alquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_{3-6}\text{cicloalquenilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilC}_6\text{cicloalquinilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheteroarilo}$, $\text{C}_{0-6}\text{alquilheterociclilo}$ o $\text{OC}_{2-6}\text{alquilheterociclilo}$ está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} , y donde cualquiera de los grupos arilo o heteroarilo individuales se puede fusionar opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros para formar un sistema de anillo bicíclico en el que el sistema de anillo bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más A;

15

W es C o N;

X es C o N;

Y es C o N;

Z es C o N;

20 siempre que cuando:

W y X sean N, Y y Z sean C;

W e Y sean N, X y Z sean C;

W y Z sean N, X e Y sean C;

X e Y sean N, W y Z sean C;

25 X y Z sean N, W e Y sean C;

Y y Z sean N, W y X sean C;

W, X e Y sean C, Z sea N;

W, X y Z sean C, Y sea N;

W, Y y Z sean C, X sea N;

30 X, Y y Z sean C, W = N;

m es 0, 1, 2 ó 3;

R^4 se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, SF_5 , OSF_5 , CHO, C_{0-6} alquilCN, OC_{1-6} alquilCN, C_{0-6} alquilOR⁵, OC_{2-6} alquilOR⁵, C_{0-6} alquilNR⁵R⁶, OC_{2-6} alquilNR⁵R⁶, OC_{2-6} alquilOC₂₋₆alquilNR⁵R⁶, C_{0-6} alquilCO₂R⁵, OC_{1-6} alquilCO₂R⁵, C_{0-6} alquilCONR⁵R⁶, OC_{1-6} alquilCONR⁵R⁶, OC_{2-6} alquilNR⁵(CO)R⁶, C_{0-6} alquilNR⁵(CO)R⁶, O(CO)NR⁵R⁶, NR⁵(CO)OR⁶, NR⁵(CO)NR⁵R⁶, O(CO)OR⁵, O(CO)R⁵, C_{0-6} alquilCOR⁵, OC_{1-6} alquilCOR⁵, NR⁵(CO)(CO)R⁵, NR⁵(CO)(CO)NR⁵R⁶, C_{0-6} alquilSR⁵, C_{0-6} alquil(SO₂)NR⁵R⁶, OC_{1-6} alquilNR⁵(SO₂)R⁶, OC_{0-6} alquil(SO₂)NR⁵R⁶, C_{0-6} alquil(SO)NR⁵R⁶, OC_{1-6} alquil(SO)NR⁵R⁶, C_{0-6} alquilOSO₂R⁵, SO₃R⁵, C_{0-6} alquilNR⁵(SO₂)NR⁵R⁶, C_{0-6} alquilNR⁵(SO)R⁶, OC_{2-6} alquilNR⁵(SO)R⁶, OC_{1-6} alquilSO₂R⁵, C_{0-6} alquilSO₂R⁵, C_{0-6} alquilSOR⁵, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C_{0-6} alquilC₆cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo y OC_{2-6} alquilheterociclilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo o OC_{2-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} , y donde cualquiera de los grupos arilo o heteroarilo individuales se puede fusionar opcionalmente con un grupo cicloalquilo, cicloalquenilo o heterociclilo de 4, 5, 6 ó 7 miembros para formar un sistema de anillo bicíclico en el que el sistema de anillo bicíclico está opcionalmente sustituido con uno o más A;

R^5 se selecciona entre hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C_{0-6} alquilC₆cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo y C_{1-6} alquilNR⁷R⁸, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C_{0-6} alquilC₆cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo o C_{0-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A;

R^6 se selecciona entre hidrógeno y C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilOR⁷, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C_{0-6} alquilC₆cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo y C_{1-6} alquilNR⁷R⁸, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquilo, C_{0-6} alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C_{0-6} alquilC₆cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo o C_{0-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A;

- C_6 cicloalquenilo, C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo o C_{0-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A; o
- R^5 y R^6 pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S que esté opcionalmente sustituido con A;
- 5 siempre que dos grupos R^5 estén presentes en la estructura pueden entonces, opcionalmente, formar juntos un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S, que esté opcionalmente sustituido con uno o más A;
- 10 R^7 y R^8 se seleccionan independientemente entre hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo, C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo y C_{0-6} alquilheteroarilo, donde dicho C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo, C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo o
- 15 C_{0-6} alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A; o
- R^7 y R^8 pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S opcionalmente sustituido con uno o más A;
- A se selecciona entre oxo, halógeno, nitro, SF_5 , OSF_5 , CN, OR^9 , C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo,
- 20 C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquilheterociclilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, OC_{2-6} alquil NR^9R^{10} , NR^9R^{10} , $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, $\text{NR}^9(\text{CO})\text{R}^{10}$, $\text{O}(\text{CO})\text{C}_{1-6}$ alquilo, $(\text{CO})\text{OC}_{1-6}$ alquilo, COR^9 , $(\text{SO}_2)\text{NR}^9\text{R}^{10}$, NSO_2R^9 , SO_2R^9 , SOR^9 , $(\text{CO})\text{C}_{1-6}$ alquil NR^9R^{10} , $(\text{SO}_2)\text{C}_{1-6}$ alquil NR^9R^{10} , OSO_2R^9 y SO_3R^9 , donde dicho C_{1-6} alquilo,
- 25 C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{0-6} alquilarilo, C_{0-6} alquilheteroarilo, C_{0-6} alquilheterociclilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquilo, C_{0-6} alquil C_{3-6} cicloalquenilo o C_{0-6} alquil C_6 cicloalquinilo está opcionalmente sustituido con halo, OSO_2R^9 , SO_3R^9 , nitro, ciano, OR^9 , C_{1-6} alquilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluorometoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi;
- 30 R^9 y R^{10} se seleccionan independientemente entre hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{3-6} cicloalquilo, C_{3-6} cicloalquenilo, C_6 cicloalquinilo, arilo, heteroarilo y

heterociclilo, donde dicho C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₃₋₆cicloalquilo, C₃₋₆cicloalquenilo, C₆cicloalquinilo, arilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres hidroxilo, ciano, halógeno o C₁₋₃alquiloxi; o

R⁹ y R¹⁰ pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que contenga uno o más heteroátomos seleccionados entre N, O o S opcionalmente sustituido con hidroxilo, C₁₋₃alquiloxi, ciano o halógeno;

R¹¹ se selecciona independientemente entre halógeno, nitro, SF₅, OSF₅, CHO, C₀₋₆alquilCN, OC₁₋₆alquilCN, C₀₋₆alquilOR⁸, OC₁₋₆alquilOR⁸, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, C₀₋₆alquilNR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilOC₂₋₆alquilNR⁵R⁶, NR⁵OR⁶, C₀₋₆alquilCO₂R⁵, OC₁₋₆alquilCO₂R⁵, C₀₋₆alquilCONR⁵R⁶, OC₁₋₆alquilCONR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(CO)R⁶, C₀₋₆alquilNR⁵(CO)R⁶, O(CO)NR⁵R⁶, NR⁵(CO)OR⁶, NR⁵(CO)NR⁵R⁶, O(CO)OR⁵, O(CO)R⁵, C₀₋₆alquilCOR⁵, OC₁₋₆alquilCOR⁵, NR⁵(CO)(CO)R⁶, NR⁵(CO)(CO)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilSR⁵, C₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(SO₂)R⁶, OC₀₋₆alquil(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, OC₁₋₆alquil(SO)NR⁵R⁶, OSO₂R⁵, SO₃R⁵, C₀₋₆alquilNR⁵(SO₂)NR⁵R⁶, C₀₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₂₋₆alquilNR⁵(SO)R⁶, OC₁₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSO₂R⁵, C₀₋₆alquilSOR⁵, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo y OC₂₋₆alquilheterociclilo, donde dicho C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquilo, C₀₋₆alquilC₃₋₆cicloalquenilo, C₀₋₆alquilC₆cicloalquinilo, C₀₋₆alquilarilo, C₀₋₆alquilheteroarilo, C₀₋₆alquilheterociclilo o OC₂₋₆alquilheterociclilo está opcionalmente sustituido con uno o más A;

como una base libre o una de sus sales, solvatos o solvatos de una sal farmacéuticamente aceptables.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, donde X es C o N; Y es C; Z es C o N; y W es C.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, donde X es C; Y es C; Z es N; y W es C.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde m es 0.
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 ó 5, donde R^1 es arilo y dicho arilo está opcionalmente sustituido con un R^4 .
- 5 7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, donde R^1 es fenilo sustituido con un R^4 .
8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 7, donde R^4 es
- 10 C_{0-6} alquilheteroarilo, donde dicho C_{0-6} alquilheteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} .
9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, donde R^4 es pirimidilo.
- 15 10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, donde R^4 es piridilo.
11. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, donde R^4 es piridilo, sustituido con un R^{11} y dicho R^{11} es halo.
- 20 12. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, donde R^4 es piridilo, sustituido con un R^{11} , dicho R^{11} es C_{0-6} alquilOR⁵; donde dicho C_{0-6} alquilOR⁵ representa metoxi.
13. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 7, donde R^4 es C_{0-6} alquilarilo, donde dicho C_{0-6} alquilarilo está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} .
- 25 14. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 13, donde R^4 representa fenilo sustituido con dos R^{11} y dichos R^{11} son un halo y un C_{0-6} alquilOR⁵; donde dicho C_{0-6} alquilOR⁵ representa metoxi.
- 30 15. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 14, donde R^2 es heteroarilo.
- 113

16. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 15, donde dicho heteroarilo es piridilo.
17. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 4 a 14, donde R^2 es arilo sustituido con un R^{11} .
- 5 18. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde dicho R^{11} representa C_{0-6} alquilOR⁵; donde dicho C_{0-6} alquilOR⁵ representa metoxi.
- 10 19. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde X es N; W es C; Y es C y Z es C.
20. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 19, donde m es 0.
- 15 21. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 19 ó 20, donde R^1 es C_{0-6} alquilarilo, opcionalmente sustituido con un R^4 .
- 20 22. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 21, donde R^1 es fenilo sustituido con un R^4 .
23. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 22, donde R^4 es C_{0-6} alquilheteroarilo, donde dicho C_{0-6} alquilheteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} .
24. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 23, donde R^4 es pirimidilo.
- 25 25. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 23, donde R^4 es piridilo sustituido con un R^{11} , siendo dicho R^{11} halo.
26. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 19 a 25, donde R^2 es heteroarilo.
- 30 27. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 26, donde dicho heteroarilo es piridilo.

1/2

28. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado por que
R¹ es arilo, donde dicho arilo está sustituido con un R⁴;
R² se selecciona entre arilo y heteroarilo, donde dicho arilo o heteroarilo está
opcionalmente sustituido con un R⁴;
- 5 W es C;
X es C o N;
Y es C;
Z es C o N;
m es 0;
- 10 R⁴ se selecciona independientemente entre C₀₋₆alquilOR⁵, C₀₋₆alquilarilo y C₀₋₆alquilheteroarilo, donde dicho C₀₋₆alquilarilo o C₀₋₆alquilheteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más R¹¹;
R⁵ es C₁₋₆alquilo;
R⁸ es C₁₋₆alquilo;
- 15 R¹¹ se selecciona independientemente entre halógeno y C₀₋₆alquilOR⁸.
29. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde X es C; W es N; Y es C; y Z es C.
- 20 30. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde m es 0.
31. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R¹ es C₀₋₆alquilarilo, opcionalmente sustituido con un R⁴.
- 25 32. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R¹ es fenilo sustituido con un R⁴.
33. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R⁴ es C₀₋₆alquilheteroarilo o C₀₋₆alquilarilo, donde dicho C₀₋₆alquilheteroarilo o C₀₋₆alquilarilo está opcionalmente
- 30 sustituido con uno o más R¹¹.

34. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R^4 es C_{0-6} alquilheteroarilo, donde dicho C_{0-6} alquilheteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más R^{11} .
35. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R^4 es pirimidilo.
- 5 36. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R^4 es piridilo sustituido con un R^{11} , siendo dicho R^{11} halo.
37. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R^4 es fenilo sustituido con
10 dos R^{11} , estando dichos R^{11} independientemente seleccionados entre halógeno y C_{0-6} alquilOR⁸.
38. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, donde R^2 es piridilo.
- 15 39. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 29, caracterizado por que
 R^1 es arilo, donde dicho arilo está sustituido con un R^4 ;
 R^2 es heteroarilo;
 W es N;
 X es C;
20 Y es C;
 Z es C;
 m es 0;
 R^4 se selecciona independientemente entre C_{0-6} alquilarilo y C_{0-6} alquilheteroarilo, donde
dicho C_{0-6} alquilarilo o C_{0-6} alquilheteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más
25 R^{11} ;
 R^{11} se selecciona independientemente entre halógeno y C_{0-6} alquilOR⁸.
40. Un compuesto seleccionado de:
5-(4-Metoxifenil)-5-(3-pirimidin-5-ilfenil)-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;
30 5-[3-(2-Fluoropiridin-3-il)fenil]-5-(4-metoxifenil)-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;
5-(4-Metoxifenil)-5-[3-(5-metoxipiridin-3-il)fenil]-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;
5-(4-Metoxifenil)-5-(3-piridin-3-ilfenil)-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;

120

5-[3-(2-Fluoropiridin-3-il)fenil]-5-piridin-4-il-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;

5-Piridin-4-il-5-(3-pirimidin-5-ilfenil)-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;

0.25 Acetato de 5-(2'-fluoro-3'-metoxibifenil-5-il)-5-piridin-4-il-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;

5 0.5 Acetato de 5-(2'-fluoro-3'-metoxibifenil-3-il)-5-piridin-4-il-5*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-7-amina;

3-Piridin-4-il-3-(3-pirimidin-5-ilfenil)-3*H*-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-amina; 3-[3-(2-Fluoropiridin-3-il)fenil]-3-piridin-4-il-3*H*-pirrolo[3,4-*c*]piridin-1-amina;

7-[3-(2-Fluoropiridin-3-il)fenil]-7-piridin-4-il-7*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-5-amina;

10 7-Piridin-4-il-7-(3-pirimidin-5-ilfenil)-7*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-5-amina; y

7-(2'-Fluoro-3'-metoxibifenil-3-il)-7-piridin-4-il-7*H*-pirrolo[3,4-*b*]piridin-5-amina;

como una base libre o una de sus sales, solvatos o solvatos de una sal farmacéuticamente aceptables.

15 41. Una formulación farmacéutica que comprende como principio activo una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 40 en asociación con excipientes, portadores o diluyentes farmacéuticamente aceptables.

20

25

30