

1980

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-014104- -00004-0000

Fecha: 2010-04-14 16:49:56 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 21

Ref: Expediente N° 10-014.104

Solicitud de Patente de Invención titulada: "DERIVADOS DE PIRIMIDINA TRISUSTITUIDA PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES PROLIFERATIVAS".

Solicitante: ASTRAZENECA AB

Nuestra Ref: P2009/000224

RESPUESTA AL OFICIO N° 2183 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 53, DE FECHA 19 DE FEBRERO DE 2010,
(EXAMEN DE FORMA)

J. IAN RAISBECK, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito dar respuesta al auto emanado de ese Despacho dentro del término legal previsto en el artículo 12 del Código Contencioso Administrativo en los siguientes términos:

1. En respuesta a la única observación del Examinador, me permito adjuntar un nuevo Capitulo Reivindicatorio Modificado, del que han sido eliminadas las reivindicaciones 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22 y 23, quedando un total de 16 reivindicaciones. Así las cosas ajunto un recibo de pago por valor de \$156.000.00, que cubre el valor adicional de 6 reivindicaciones por encima de 10.

2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,

J. IAN RAISBECK
C.C. N°. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799

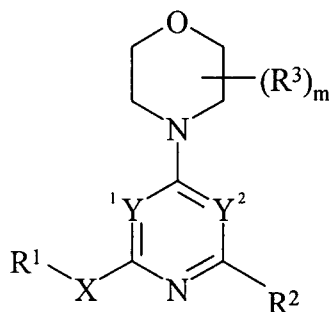
Anexo: Capitulo Reivindicatorio Modificado y Tasa por valor de \$156.000

1981

REIVINDICACIONES

(Examen de Forma)

1. Un compuesto de fórmula (I)



fórmula (I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; en donde

m es 0, 1, 2, 3 o 4;

¹**Y** e **Y**² son independientemente N o CR⁸ siempre que uno de ¹**Y** e **Y**² sea N y el otro sea CR⁸;

X es un grupo enlazante que se selecciona de -CR⁴=CR⁵CR⁶R⁷-, -CR⁶R⁷CR⁵=CR⁴-, -C≡CCR⁶R⁷-, -CR⁶R⁷C≡C-, -NR⁴CR⁶R⁷-, -OCR⁶R⁷-, -SCR⁶R⁷-, -S(O)CR⁶R⁷-, -S(O)₂CR⁶R⁷-, -C(O)NR⁴CR⁶R⁷-, -NR⁴C(O)CR⁶R⁷-, -NR⁴C(O)NR⁵CR⁶R⁷-, -NR⁴S(O)₂CR⁶R⁷- y -S(O)₂NR⁴CR⁶R⁷-;

R¹ es un grupo que se selecciona de hidrógeno, alquiloC₁₋₆, alqueniloC₂₋₆, alquiniloC₂₋₆, carbociclilo, carbociclilalquiloC₁₋₆, heterociclilo y heterociclilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, R⁹, -OR⁹, -SR⁹, -SOR⁹, -SO₂R⁹, -COR⁹, -CO₂R⁹, -CONR⁹R¹⁰, -NR⁹R¹⁰, -NR⁹COR¹⁰, -NR⁹CO₂R¹⁰, -NR⁹CONR¹⁰R¹⁵, -NR⁹COCONR¹⁰R¹⁵ y -NR⁹SO₂R¹⁰;

R² es un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, carbociclilo y heterociclilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan independientemente de halo, ciano, nitro, -R¹¹, -OR¹¹, -SR¹¹, -SOR¹¹, -SO₂R¹¹, -COR¹¹, -CO₂R¹¹, -CONR¹¹R¹², -NR¹¹R¹², -NR¹¹COR¹², -NR¹¹COCONR¹²R¹⁶, -NR¹¹SO₂R¹², -NR¹⁷CONR¹⁸R¹⁹ y -NR¹⁷CSNR¹⁸R¹⁹;

1982

cada R^3 , cuando está presente, se selecciona independientemente de halo, ciano, nitro, $-R^{13}$, $-OR^{13}$, $-SR^{13}$, $-SOR^{13}$, $-SO_2R^{13}$, $-COR^{13}$, $-CO_2R^{13}$, $-CONR^{13}R^{14}$, $-NR^{13}R^{14}$, $-NR^{13}COR^{14}$, $-NR^{13}CO_2R^{14}$ y $-NR^{13}SO_2R^{14}$;

R^4 y R^5 son independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

o R^1 y R^4 junto con el átomo o átomos a los que están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4 a 10 miembros en donde 1, 2 o 3 átomos de carbono del anillo se reemplazan opcionalmente por N, O o S y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxil, oxo, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino, bis(alquil C_{1-6})amino, aminoalquilo C_{1-6} , (alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , bis(alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alquil C_{1-6} sulfonilo, alquil C_{1-6} sulfonilamino, alquil C_{1-6} sulfonil(alquil C_{1-6})amino, sulfamoilo, alquil C_{1-6} sulfamoilo, bis(alquil C_{1-6})sulfamoilo, alcanoil C_{1-6} amino, alcanoil C_{1-6} (alquil C_{1-6})amino, carbamoilo, alquil C_{1-6} carbamoilo y bis(alquil C_{1-6})carbamoilo;

R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo carbocíclico o anillo heterocíclico de 3 a 10 miembros en donde 1 átomo de carbono del anillo se reemplaza opcionalmente por N, O o S y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxil, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino, bis(alquil C_{1-6})amino, aminoalquilo C_{1-6} , (alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , bis(alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alquil C_{1-6} sulfonilo, alquil C_{1-6} sulfonilamino, alquil C_{1-6} sulfonil(alquil C_{1-6})amino, sulfamoilo, alquil C_{1-6} sulfamoilo, bis(alquil C_{1-6})sulfamoilo, alcanoil C_{1-6} amino, alcanoil C_{1-6} (alquil C_{1-6})amino, carbamoilo, alquil C_{1-6} carbamoilo y bis(alquil C_{1-6})carbamoilo;

R^8 se selecciona de hidrógeno, halo, ciano y alquilo C_{1-6} ;

R^9 y R^{10} son independientemente hidrógeno o un grupo que se selecciona de alquilo C_{1-6} , carbociclilo, carbociclilalquilo C_{1-6} , heterociclilo y heterociclilalquilo C_{1-6} , sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxil, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino, bis(alquil C_{1-6})amino, aminoalquilo C_{1-6} , (alquil C_{1-6})

1983

6)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆sulfonilo, alquiloC₁₋₆sulfonilamino, alquiloC₁₋₆sulfonil(alquiloC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquiloC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquiloC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquiloC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquiloC₁₋₆carbamoilo y bis(alquiloC₁₋₆)carbamoilo;

R¹¹, R¹², R¹⁷ y R¹⁸ son independientemente hidrógeno o un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, carbociclilo, carbociclilalquiloC₁₋₆, heterociclilo y heterociclilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquiloC₁₋₆amino, bis(alquiloC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆sulfonilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquiloC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquiloC₁₋₆carbamoilo y bis(alquiloC₁₋₆)carbamoilo;

R¹³, R¹⁴, R¹⁵ y R¹⁶ son independientemente hidrógeno o un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, carbociclilo, carbociclilalquiloC₁₋₆, heterociclilo y heterociclilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquiloC₁₋₆amino, bis(alquiloC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆sulfonilo, alquiloC₁₋₆sulfonilamino, alquiloC₁₋₆sulfonil(alquiloC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquiloC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquiloC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquiloC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquiloC₁₋₆carbamoilo y bis(alquiloC₁₋₆)carbamoilo;

R¹⁹ es hidrógeno, ciano o un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, carbociclilo, carbociclilalquiloC₁₋₆, heterociclilo y heterociclilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquiloC₁₋₆amino, bis(alquiloC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquiloC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆sulfonilo, alquiloC₁₋₆sulfonilamino, alquiloC₁₋₆sulfonil(alquiloC₁₋₆)amino, sulfamoilo,

5/1984

alquilC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquilC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquilC₁₋₆carbamoilo y bis(alquilC₁₋₆)carbamoilo;

o R¹⁸ y R¹⁹ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico de 3 a 10 miembros en donde 1 o 2 átomos de carbono del anillo se reemplazan opcionalmente por N, O o S y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxí, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquilC₁₋₆amino, bis(alquilC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquilC₁₋₆sulfonilo, alquilC₁₋₆sulfonilamino, alquilC₁₋₆sulfonil(alquilC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquilC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquilC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquilC₁₋₆carbamoilo y bis(alquilC₁₋₆)carbamoilo.

2. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde

m es 0, 1 o 2;

¹Y e Y² son independientemente N o CR⁸ siempre que uno de ¹Y e Y² sea N y el otro sea CR⁸;

X es un grupo enlazante que se selecciona de -NR⁴CR⁶R⁷-, -OCR⁶R⁷-, -SCR⁶R⁷-, -S(O)CR⁶R⁷-, -S(O)₂CR⁶R⁷-, -C(O)NR⁴CR⁶R⁷-, -NR⁴C(O)CR⁶R⁷-, -NR⁴C(O)NR⁵CR⁶R⁷- y -S(O)₂NR⁴CR⁶R⁷;

R¹ es un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, carbociclilo, carbociclilalquiloC₁₋₆, heterociclilo y heterociclilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, R⁹, -OR⁹, -COR⁹, -CONR⁹R¹⁰, -NR⁹R¹⁰ y -NR⁹COR¹⁰;

o X-R¹ es -CR⁶R⁷OH;

R² es un grupo que se selecciona de carbociclilo y heterociclilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan independientemente de halo, ciano, nitro, -R¹¹, -OR¹¹, -SR¹¹, -SOR¹¹, -SO₂R¹¹, -COR¹¹, -CO₂R¹¹, -CONR¹¹R¹², -NR¹¹R¹², -NR¹¹COR¹², -NR¹¹COCONR¹²R¹⁶, -NR¹¹SO₂R¹², -NR¹⁷CONR¹⁸R¹⁹ y -NR¹⁷CSNR¹⁸R¹⁹; cada R³, cuando está presente, se selecciona de ciano, R¹³ y -CONR¹³R¹⁴;

27985

R^4 y R^5 son independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-6} ;

o, cuando X es $-NR^4CR^6R^7-$, $-NR^4C(O)CR^6R^7-$ o $-NR^4C(O)NR^5CR^6R^7-$, R^1 y R^4 junto con el átomo o átomos a los que están unidos forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros en donde 1 átomo de carbono del anillo se reemplaza opcionalmente por N u O y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, oxo, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino, bis(alquil C_{1-6})amino, aminoalquilo C_{1-6} , (alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , bis(alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alquil C_{1-6} sulfonilo, alquil C_{1-6} sulfonilamino, alquil C_{1-6} sulfonil(alquil C_{1-6})amino, sulfamoilo, alquil C_{1-6} sulfamoilo, bis(alquil C_{1-6})sulfamoilo, alcanoil C_{1-6} amino, alcanoil C_{1-6} (alquil C_{1-6})amino, carbamoilo, alquil C_{1-6} carbamoilo y bis(alquil C_{1-6})carbamoilo;

R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo carbocíclico o anillo heterocíclico de 3 a 10 miembros en donde 1 átomo de carbono del anillo se reemplaza opcionalmente por N, O o S y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino, bis(alquil C_{1-6})amino, aminoalquilo C_{1-6} , (alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , bis(alquil C_{1-6})aminoalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alquil C_{1-6} sulfonilo, alquil C_{1-6} sulfonilamino, alquil C_{1-6} sulfonil(alquil C_{1-6})amino, sulfamoilo, alquil C_{1-6} sulfamoilo, bis(alquil C_{1-6})sulfamoilo, alcanoil C_{1-6} amino, alcanoil C_{1-6} (alquil C_{1-6})amino, carbamoilo, alquil C_{1-6} carbamoilo y bis(alquil C_{1-6})carbamoilo;

R^8 se selecciona de hidrógeno, halo, ciano y alquilo C_{1-6} ;

R^9 y R^{10} son independientemente hidrógeno o un grupo que se selecciona de alquilo C_{1-6} , carbociclilo y heterociclilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , hidroxialquilo C_{1-6} , hidroxialcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} alcoxi C_{1-6} , amino, alquil C_{1-6} amino y bis(alquil C_{1-6})amino;

R^{11} , R^{12} , R^{17} y R^{18} son independientemente hidrógeno o un grupo que se selecciona de alquilo C_{1-6} , carbociclilo y heterociclilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano,

1986

nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquilC₁₋₆amino y bis(alquilC₁₋₆)amino;

R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno o un alquiloC₁₋₃ que se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, hidroxilo y alcoxiC₁₋₃; y

R¹⁹ es hidrógeno, ciano o un grupo que se selecciona de alquiloC₁₋₆, cicloalquiloC₃₋₆, arilo, heteroarilo, arilalquiloC₁₋₆ y heteroarilalquiloC₁₋₆, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquilC₁₋₆amino, bis(alquilC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquilC₁₋₆sulfonilo, alquilC₁₋₆sulfonilamino, alquilC₁₋₆sulfonil(alquilC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquilC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquilC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquilC₁₋₆carbamoilo y bis(alquilC₁₋₆)carbamoilo;

o R¹⁸ y R¹⁹ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico de 6 miembros en donde 1 átomo de carbono del anillo se reemplaza opcionalmente por N u O y dicho anillo se sustituye opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquilC₁₋₆amino, bis(alquilC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquilC₁₋₆sulfonilo, alquilC₁₋₆sulfonilamino, alquilC₁₋₆sulfonil(alquilC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquilC₁₋₆sulfamoilo, bis(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquilC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquilC₁₋₆carbamoilo y bis(alquilC₁₋₆)carbamoilo.

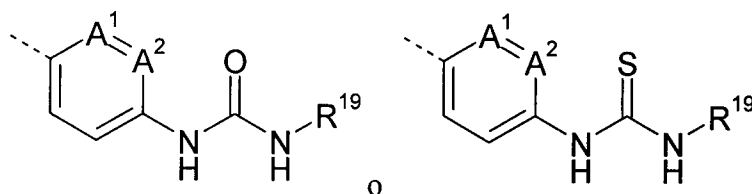
3. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2 en donde ¹Y es CH e Y² es N.

1987

4. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 en donde X es un grupo enlazante -S(O)₂CR⁶R⁷-.

5. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4 en donde R¹ es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, propilo, butilo, isobutilo, *tert*-butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo, bencilo, fenetilo, imidazolilo, pirrolidinilo, tiadiazolilo, tiazolilo, piridinilo, pirazoliletilo, furanilmetilo, tienilmetilo, tiazolilmetilo, tiadiazolilmetilo y piraziniletilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por 1 o 2 grupos sustituyentes que se seleccionan de amino, halo, ciano, hidroxilo, metilo, metoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi, -NHCOCH₃, -CONH₂ y -CONHCH₃.

6. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en donde R² es



en donde A¹ y A² se seleccionan de CH o N siempre que al menos uno de A¹ o A² es CH.

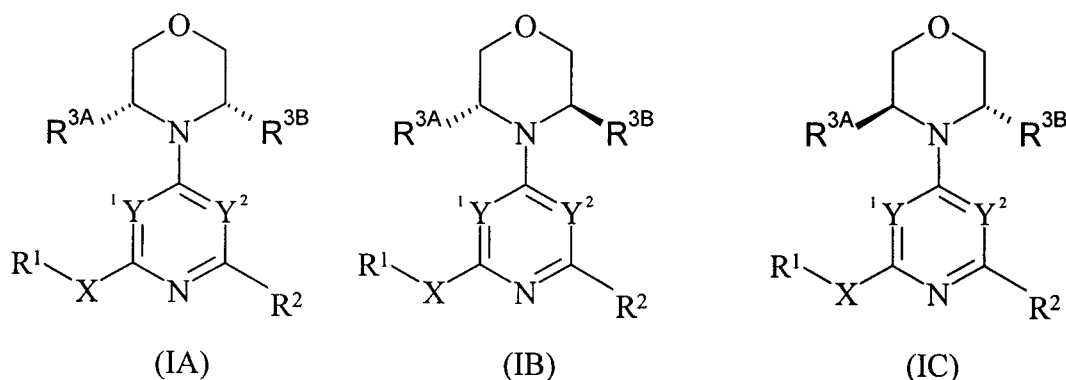
7. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6 en donde R¹⁹ es hidrógeno o un grupo que se selecciona de metilo, etilo, propilo, *i*-propilo, butilo, *i*-butilo, *t*-butilo, pentilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo, tienilo, imidazoilmetilo, isoxazolilo, pirazolilo, pirazolilmetilo, piridinilo y pirimidinilo, sustituyéndose este grupo opcionalmente por uno o más grupos sustituyentes que se seleccionan de halo, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, haloalcoxiC₁₋₆, hidroxialquiloC₁₋₆, hidroxialcoxiC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alquiloC₁₋₆, alcoxiC₁₋₆alcoxiC₁₋₆, amino, alquilC₁₋₆amino, bis(alquilC₁₋₆)amino, aminoalquiloC₁₋₆, (alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, bis(alquilC₁₋₆)aminoalquiloC₁₋₆, cianoalquiloC₁₋₆, alquilC₁₋₆sulfonilo, alquilC₁₋₆sulfonilamino, alquilC₁₋₆sulfonil(alquilC₁₋₆)amino, sulfamoilo, alquilC₁₋₆sulfamoilo,

1988

bis(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, alcanoilC₁₋₆amino, alcanoilC₁₋₆(alquilC₁₋₆)amino, carbamoilo, alquilC₁₋₆carbamoilo y bis(alquilC₁₋₆)carbamoilo.

8. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7 en donde R⁶ y R⁷ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 5 miembros.

9. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (IA), (IB) o (IC)



en donde

X es un grupo enlazante -S(O)₂CR⁶R⁷-;

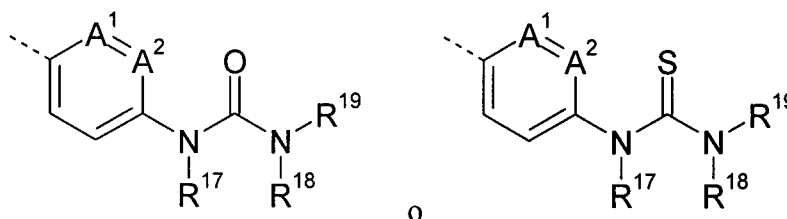
¹Y es CH e Y² es N;

R¹ es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, -CH₂CH₂OH, -CH₂CH₂CH₂OH, -CH₂CH₂C(OH)(CH₃)₂, -CH₂CH₂CH₂OCHF₂, -CH₂CH₂OCH₃, -CH₂CH₂NHC(O)CH₃, -CH₂C(O)NH₂, -CH₂C(O)NHMe, -CH₂CH₂NHMe, fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-fluoro-4-metilaminofenilo, 4-fluoro-2-metilfenilo, 5-fluoro-2-metilfenilo, 3-fluoro-4-(2-hidroxi-etilamino)fenilo, 4-(difluorometoxi)fenilo, 4-carbamoil-2-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-clorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-4-metilaminofenilo, 3-cloro-4-etilaminofenilo, 3-cloro-4-(2-fluoroetilamino)fenilo, 3-cloro-4-(2-hidroxi-etilamino)fenilo, 2-cloro-4-cianofenilo, 4-cianofenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,5-difluorofenilo, 2-(trifluorometil)fenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-(2-hidroxi-etilamino)fenilo, 1H-imidazol-2-ilo, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, 2-(dimetilcarbamoil)piridin-3-ilo, 5-(dimetilcarbamoil)piridin-2-ilo,

1989

1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 1-(difluorometil)-3,5-dimetilpirazol-4-ilo, 1,3-dimetilpirazol-4-ilo, piridin-4-ilo, piridin-2-ilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, 5-fluoropiridin-3-ilo, tiazol-2-ilo, 4-metiltiazol-2-ilo, 4,5-dimetiltiazol-2-ilo, 2,4-dimetiltiazol-5-ilo, 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo y tetrahidropiran-4-ilo;

R^2 es



en donde A^1 y A^2 son CH;

R^{17} es hidrógeno;

R^{18} es hidrógeno; y

R^{19} es hidrógeno, ciano o un grupo que se selecciona de metilo, etilo, propilo, i-propilo, i-butilo, t-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, $-\text{CH}_2(\text{ciclopropilo})$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CH}_2\text{CONMe}_2$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$, 1-(metil)ciclopropilo, $-\text{CH}_2(1\text{-hidroxiciclopropilo})$, 1-(hidroximetil)ciclopropilo, (1R)-2-hidroxi-1-metiletilo, (1S)-2-hidroxi-1-metiletilo, fenilo, 4-metilfenilo, 4-clorofenilo, 4-(trifluorometil)fenilo, 4-fluorofenilo, 4-metoxifenilo, 3,4-difluorofenilo, $-\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{pirrolidin-1-il})$, $-\text{CH}_2(\text{imidazol-2-ilo})$, 1-metilimidazol-4-ilo, oxazolil-2-ilo, isoxazolil-3-ilo, oxetan-3-ilo, 1,1-dioxotiolan-3-ilo, 5-metilisoxazol-3-ilo, $-\text{CH}_2(1\text{-metilpirazol-4-ilo})$, 1-metilpirazol-4-ilo, $-\text{CH}_2(1\text{-metilpirazol-4-ilo})$, 5-metilpirazin-2-ilo, $-\text{CH}_2(2\text{H-1,2,4-triazol-3-ilo})$, 6-metoxipiridin-3-ilo, piridin-2-ilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, tiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo y 1-metilpirazol-3-ilo;

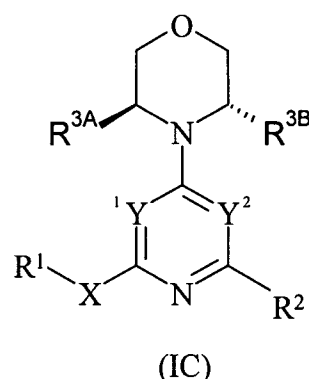
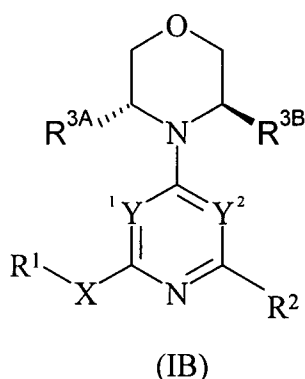
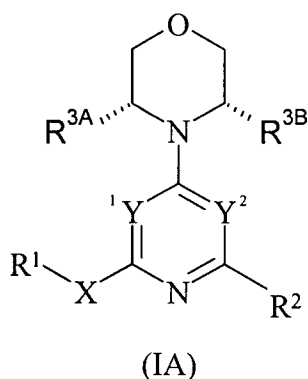
R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, tetrahidropiranilo o piperidilo; y

cuando R^{3A} es hidrógeno, R^{3B} es hidrógeno, metilo, etilo, hidroximetilo, dimetilcarbamoilo o carbamoilo; o

1990

cuando R^3 es metilo, R^3 es metilo.

10. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 9, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (IA), (IB) o (IC)



en donde

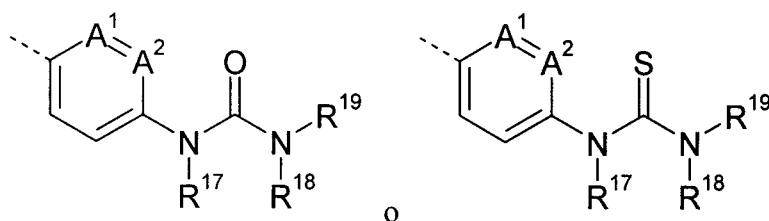
X es un grupo enlazante $-S(O)_2CR^6R^7-$;

Y^1 es CH e Y^2 es N;

R^1 es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, isopropilo, *tert*-butilo, ciclopropilo, $-CH_2CH_2OH$, $-CH_2CH_2CH_2OH$, $-CH_2CH_2C(OH)(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_2OCHF_2$, $-CH_2CH_2OCH_3$, $-CH_2CH_2NHC(O)CH_3$, $-CH_2CH_2NHMe$, fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-fluoro-4-metilaminofenilo, 4-fluoro-2-metilfenilo, 5-fluoro-2-metilfenilo, 3-fluoro-4-(2-hidroxietilamino)fenilo, 4-(difluorometoxi)fenilo, 4-carbamoyl-2-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-clorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-4-metilaminofenilo, 3-cloro-4-etilaminofenilo, 3-cloro-4-(2-fluoroetilamino)fenilo, 3-cloro-4-(2-hidroxietilamino)fenilo, 2-cloro-4-cianofenilo, 4-cianofenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,5-difluorofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 1H-imidazol-2-ilo, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, 2-(dimetilcarbamoyl)piridin-3-ilo, 5-(dimetilcarbamoyl)piridin-2-ilo, 1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 1,3-dimetilpirazol-4-ilo, piridin-4-ilo, piridin-2-ilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, tiazol-2-ilo, 4-metiltiazol-2-ilo, 4,5-dimetiltiazol-2-ilo, 2,4-dimetiltiazol-5-ilo y 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo;

R^2 es

1991
13



en donde

A^1 y A^2 son CH;

R^{17} es hidrógeno;

R^{18} es hidrógeno; y

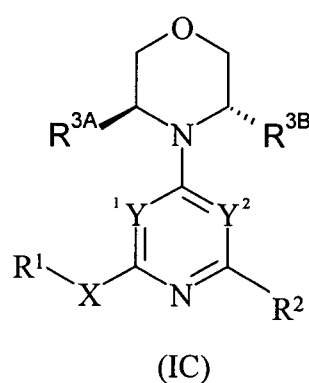
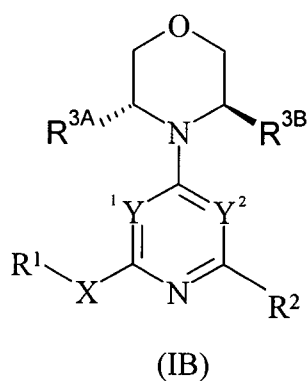
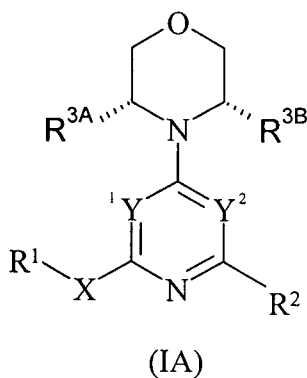
R^{19} es hidrógeno o un grupo que se selecciona de metilo, etilo, propilo, i-propilo, ciclopropilo, ciclobutilo, $-\text{CH}_2(\text{ciclopropilo})$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CH}_2(1\text{-hidroxiciclopropilo})$, 1-(hidroximetil)ciclopropilo, (1R)-2-hidroxi-1-metiletilo, (1S)-2-hidroxi-1-metiletilo, fenilo, 4-metilfenilo, 4-clorofenilo, 4-metoxifenilo, 3,4-difluorofenilo, $-\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{pirrolidin-1-il})$, $-\text{CH}_2(\text{imidazol-2-ilo})$, 1-metilimidazol-4-ilo, oxazolil-2-ilo, isoxazolil-3-ilo, oxetan-3-ilo, 5-metilisoxazol-3-ilo, 1-metilpirazol-4-ilo, 5-metilpirazin-2-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, tiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo y 1-metilpirazol-3-ilo;

R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, tetrahidropiraniilo o piperidilo; y

cuando R^{3A} es hidrógeno, R^{3B} es hidrógeno, metilo o etilo; o

cuando R^{3A} es metilo, R^{3B} es metilo.

11. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (IA), (IB) o (IC)



1992
43

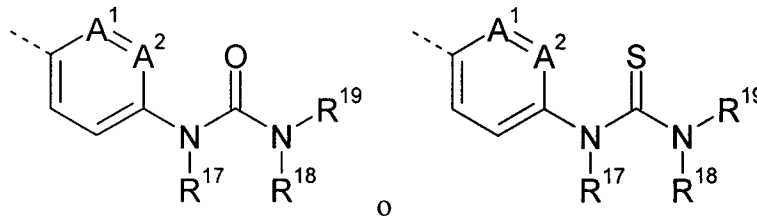
en donde

X es un grupo enlazante $-S(O)_2CR^6R^7-$;

^1Y es CH e Y^2 es N;

R^1 es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, ciclopropilo, $-CH_2CH_2CH_2OH$, fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-clorofenilo, 2-metilfenilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, piridin-2-ilo, tiazol-2-ilo y 4-metiltiazol-2-ilo;

R^2 es



en donde A^1 y A^2 son CH;

R^{17} es hidrógeno;

R^{18} es hidrógeno; y

R^{19} es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, ciclopropilo, ciclobutilo, $-CH(CH_3)CH_2OH$, $-CH_2CH_2OH$, $-CH_2CH_2CH_2OH$, $-CH_2CHF_2$, $-CH_2CH_2F$, $-CH_2CH_2CN$, (1R)-2-hidroxi-1-metiletilo, (1S)-2-hidroxi-1-metiletilo, $-CH_2$ (imidazol-2-ilo), oxazolil-2-ilo, isoxazolil-3-ilo, 1-metilpirazol-4-ilo, 5-metilpirazin-2-ilo, tiazol-2-ilo y 1,2,4-tiadiazol-5-ilo;

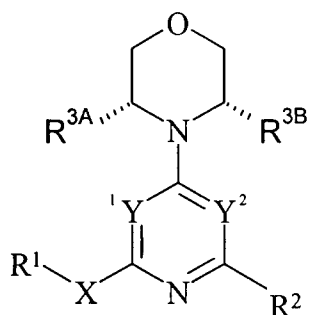
R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, tetrahidropiraniilo o piperidilo; y

cuando R^{3A} es hidrógeno, R^{3B} es hidrógeno, metilo o etilo; o

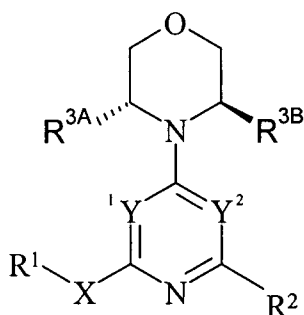
cuando R^{3A} es metilo, R^{3B} es metilo.

12. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 11, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (Ia), (Ib) o (Ic)

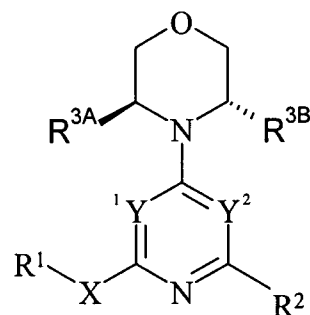
1793



(IA)



(IB)



(IC)

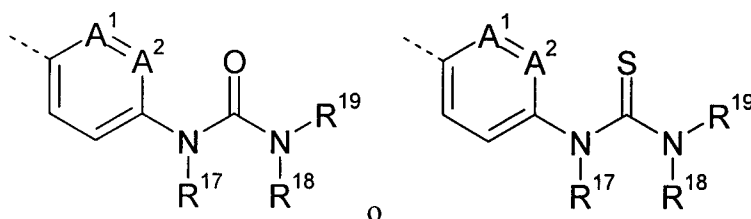
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;

X es un grupo enlazante $-S(O)_2CR^6R^7-$;

^1Y es CH e Y^2 es N;

R¹ es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, ciclopropilo, $-CH_2CH_2CH_2OH$, fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-clorofenilo, 2-metilfenilo, 5-fluoropiridin-2-ilo, piridin-2-ilo, tiazol-2-ilo y 4-metiltiazol-2-ilo;

R² es



en donde **A¹** y **A²** son CH;

R¹⁷ es hidrógeno;

R¹⁸ es hidrógeno; y

R¹⁹ es un grupo que se selecciona de metilo, etilo, ciclopropilo, ciclobutilo, $-CH(CH_3)CH_2OH$, $-CH_2CH_2OH$, $-CH_2CH_2CH_2OH$, $-CH_2CHF_2$, $-CH_2CH_2F$, $-CH_2CH_2CN$, (1R)-2-hidroxi-1-metiletilo, (1S)-2-hidroxi-1-metiletilo, $-CH_2$ (imidazol-2-ilo), oxazolil-2-ilo, isoxazolil-3-ilo, 1-metilpirazol-4-ilo, 5-metilpirazin-2-ilo, tiazol-2-ilo y 1,2,4-tiadiazol-5-ilo;

R⁶ y **R⁷** junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, tetrahidropiraniilo o piperidilo; y

cuando **R^{3A}** es hidrógeno, **R^{3B}** es metilo o etilo; o

cuando **R^{3A}** es metilo, **R^{3B}** es metilo.

1974

13. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 12 en donde R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo ciclopropilo o ciclobutilo.

14. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1 que se selecciona de cualquiera de los Ejemplos, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1 que se selecciona de cualquiera de

1-[4-[4-(1-etilsulfonilciclopropil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-metil-urea,

1-[4-[4-(1-ciclopropilsulfonilciclopropil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]tiourea,

3-ciclopropil-1-[4-[4-(1-metilsulfonilciclopropil)-6-morfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]urea,

1-[4-[4-[1-(4-clorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-(1-piridin-2-ilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]urea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-[(4-metil-1,3-tiazol-2-il)sulfonil]ciclopropil]pirimidin-2-il]fenil]urea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-ciclopropilurea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(3-hidroxipropil)urea,

1-[4-[4-(1-ciclopropilsulfonilciclopropil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)tiourea,

1995


3-ciclopropil-1-[4-[4-[1-(4-fluorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]tiourea,

3-ciclopropil-1-[4-[4-[1-(3-hidroxipropilsulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]tiourea,

1-etil-3-[4-[4-[1-(3-hidroxipropilsulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]tiourea,

1-[4-[4-[1-(ciclopropilsulfonilciclobutil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclobutil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-metiltiourea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(1H-imidazol-2-ilmetil)tiourea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-(1-piridin-4-ilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]tiourea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-fluoroetil)urea,

1-[4-[4-[1-(2,4-difluorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1-[4-[4-[1-(3-fluorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-(2-metilfenil)sulfonilciclopropil]pirimidin-2-il]fenil]urea,

3-(2-fluoroetil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-(2-metilfenil)sulfonilciclopropil]pirimidin-2-il]fenil]urea,

3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-(1,3-tiazol-2-ilsulfonil)ciclopropil]pirimidin-2-il]fenil]urea,

1-[4-[4-[1-(2-clorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclobutil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2S)-1-hidroxipropan-2-il]urea,

1996

1-[4-[4-(1-ciclopropilsulfonilciclobutil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2S)-1-hidroxiopropan-2-il]urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclobutil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2R)-1-hidroxiopropan-2-il]urea,
3-(2-fluoroetil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-[(4-metil-1,3-tiazol-2-il)sulfonil]ciclopropil]pirimidin-2-il]fenil]urea,
3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-[(4-metil-1,3-tiazol-2-il)sulfonil]ciclobutil]pirimidin-2-il]fenil]urea,
3-(2-hidroxietil)-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-(1,3-tiazol-2-ilsulfonil)ciclobutil]pirimidin-2-il]fenil]urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-metilurea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-ciclopropilurea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-fluoroetil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2,2-difluoroetil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2S)-1-hidroxiopropan-2-il]urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2R)-1-hidroxiopropan-2-il]urea,
3-ciclopropil-1-[4-[4-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]urea,
1-[4-[4-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,
1-[4-[4-[1-(2,6-difluorofenil)sulfonilciclopropil]-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,
1-[4-[4-(1-ciclopropilsulfonilciclopropil)-6-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,

1977

3-ciclopropil-1-[4-[4-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]urea,
1-[4-[4-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-fluoroetil)urea,
1-[4-[4-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-metilurea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-ciclopropilurea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(2S)-1-hidroxipropan-2-il]urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(3-hidroxipropil)urea,
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S)-3-etilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-[(1-hidroxiciclopropil)metil]urea,
1-[4-[4-(1-etilsulfonilciclobutil)-6-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-hidroxietil)tiourea,
1-[4-[4-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]-6-(1-metilsulfonilciclopropil)pirimidin-2-il]fenil]-3-etilurea,
3-[(2S)-1-hidroxipropan-2-il]-1-[4-[4-[(3S)-3-metilmorfolin-4-il]-6-[1-(1,3-tiazol-2-ilsulfonil)ciclobutil]pirimidin-2-il]fenil]urea y
1-[4-[4-[1-(bencenosulfonil)ciclopropil]-6-[(3S,5S)-3,5-dimetilmorfolin-4-il]pirimidin-2-il]fenil]-3-(2-fluoroetil)urea,
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

16. [ELIMINADA] ~~Un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15 para su uso como un medicamento.~~

1978


17. ~~[ELIMINADA] El uso de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15 en la fabricación de un medicamento para su uso en el tratamiento de una enfermedad proliferativa.~~

18. ~~[ELIMINADA] El uso de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15 para la producción de un efecto anti-proliferativo en un animal de sangre caliente tal como el hombre.~~

19. ~~[ELIMINADA] El uso de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15 en la fabricación de un medicamento para su uso en la producción de un efecto anti-proliferativo en un animal de sangre caliente tal como el hombre.~~

20. ~~[ELIMINADA] El uso de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15 en la fabricación de un medicamento para su uso en la obtención de un efecto inhibitorio de la mTOR quinasa en un animal de sangre caliente tal como el hombre.~~

21. ~~[ELIMINADA] Un método para producir un efecto anti-proliferativo en un animal de sangre caliente, tal como el hombre, que necesita dicho tratamiento que comprende administrar a dicho animal una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15.~~

22. ~~[ELIMINADA] Un método para producir un efecto inhibitorio de la mTOR quinasa en un animal de sangre caliente, tal como el hombre, que necesita dicho tratamiento que comprende administrar a dicho animal una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15.~~

25
1999

23. ~~[ELIMINADA] Un método para el tratamiento de cáncer, enfermedades inflamatorias, enfermedades obstructivas de las vías respiratorias, enfermedades inmunes o enfermedades cardiovasculares en un animal de sangre caliente tal como el hombre que necesita dicho tratamiento que comprende administrar una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15.~~

24. 16. [RENUMERADA] Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 15, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en asociación con un diluyente o portador farmacéuticamente aceptable.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

000174000-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 28,743
FECHA : 4801.14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-014104- -00004-0000

Fecha: 2010-04-14 16:49:56 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 21

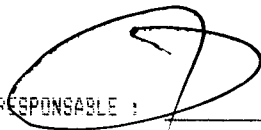
XXXX COMSIBNACION XXXX

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. C/C	FECHA PAGO	VALOR PAGO
CLARTE RAISBEY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062734387	074655400	10/04/2010	155,000.00

XXXX C O M P E R T O XXXX

CANT. DEBITADO	CONCEPTO	VALOR DEBITADO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	155,000.00
99	OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	155,000.00
	TOTAL	310,000.00

BONI: CIENTO CINCUENTA Y SEIS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CASH 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