

# OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Abogado  
Abogado  
Juan Carlos Acosta  
Andrés Romero  
Mónica Guayán  
Andrés Alvarado  
Ella Ponce  
Edgardo Gancedo  
María Clara Cárdenas  
Mauricio Ariza  
Jorge Rodríguez  
Rosa María Pineda

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-160879-00008-0000

Fecha: 2013-04-22 16:29:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 523 RESPUESTA Folios: 12

Re: Expediente No. 10-160.879

Solicitud de Patente de Invención titulada: "DERIVADOS DE PIPERIDINIL  
INDOL COMO INHIBIDORES DE ALDOSTERONA SINTASA"

Solicitante: NOVARTIS AG

Nuestra Ref.: P2010/000189

**RESPUESTA AL OFICIO No. 22129, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 449**

**DE FECHA 11 DE DICIEMBRE DE 2012**

**(PRIMER EXAMEN DE FONDO)**

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad el Capítulo Reivindicatorio Modificado presentado el 11 de abril de 2011.

Así entonces, el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto contiene los siguientes cambios:

- se eliminaron las Reivindicaciones 2, 3, 6, 9, 13 y 15 a 19;
- en la Reivindicación 1 se limitó el significado de los radicales R<sup>5q</sup>, R<sup>7q</sup>, R<sup>8q</sup> y R<sup>9</sup>; se limitó la condición que relaciona el significado de R<sup>5q</sup> con R<sup>2q</sup>, R<sup>3q</sup>, y R<sup>8q</sup>; además, se aclaró el significado del término alquilo;

- en la nueva Reivindicación 2 (antigua Reivindicación 4), se eliminó el radical  $R^{2q}$ ;
- en las nuevas Reivindicaciones 4 a 8 (antiguas Reivindicaciones 7, 8, 10 a 12), se corrigieron los radicales de modo que definieran  $R^{3q}$ ,  $R^{5q}$ ,  $R^{7q}$ ,  $R^{8q}$ , en lugar de  $R^{5b}$ ,  $R^{7b}$ ,  $R^{8b}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{5c}$ ,  $R^{7c}$ ,  $R^{8c}$  de acuerdo con la nomenclatura de la Fórmula II;
- en la nueva Reivindicación 4 (antigua Reivindicación 7), se eliminaron los radicales  $R^{2b}$ ,  $R^{3b}$ ,  $R^{7b}$ ,  $R^{8b}$  y  $R'$ , junto con la posibilidad de reclamar las sales farmacéuticamente aceptables, polimorfos, rotámeros, profármacos, enantiómeros, hidratos, y solvatos del compuesto;
- en la nueva Reivindicación 5 (antigua Reivindicación 8), se eliminaron los radicales  $R^{2b}$  y  $R^{3b}$ ;
- en la nueva Reivindicación 6 (antigua Reivindicación 10), se eliminaron los radicales  $R^{2c}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{7c}$  y  $R'$ ;
- en la nueva Reivindicación 7 (antigua Reivindicación 11), se eliminó el radical  $R^{2c}$ ;
- se introdujo la nueva Reivindicación 9, que reclama específicamente los compuestos de los Ejemplos 152, 164, 165, 168, 171, 221c y 187;
- en la Reivindicación 10 (antigua Reivindicación 14), se limitó la composición farmacéutica para incluir únicamente una cantidad efectiva de un compuesto de Fórmula II y un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial, por el contrario, éstas corresponden a una drástica limitación de la materia reclamada.

2. a- El Examinador señala que las Reivindicaciones 17 a 19 reclaman materia no patentable, y que la Reivindicación 13 incluye la expresión “para utilizarse en terapia”, por lo cual sugiere eliminarla.

b- Considero superadas las anteriores objeciones en tanto que las Reivindicaciones 13, 17 a 19 han sido eliminadas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

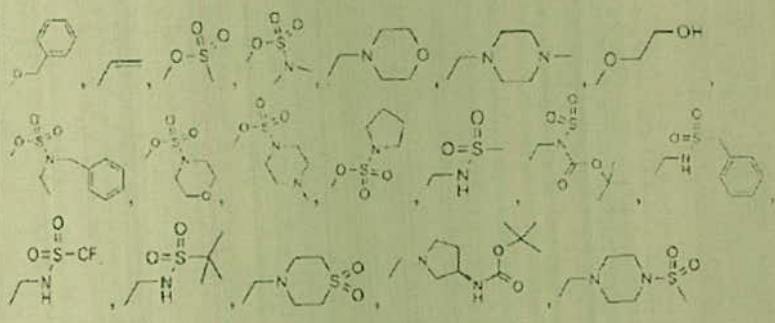
3. a- El Examinador señala que la Reivindicación 15 es excesivamente amplia porque reclama una combinación de los compuestos de la invención y un “segundo agente”, el cual no está definido de manera apropiada.

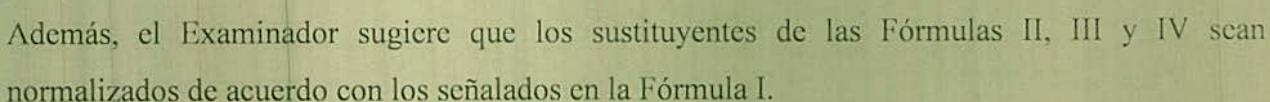
De manera similar, la Reivindicación 16 no es concisa porque señala una combinación de los compuestos de la invención con inhibidores de HMG CoA reductasa, antagonistas de receptores de Angiotensina II, inhibidores de ECA, bloqueadores de canales de Calcio, entre otros, lo cual abarca innumerables compuestos.

b- Considero superadas las anteriores objeciones en tanto que las Reivindicaciones 15 y 16 han sido eliminadas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

4. a- El Examinador señala que las Reivindicaciones 1, 6, 9 y 13 son excesivamente amplias porque contienen términos indefinidos e ilimitados tales como: “alquilo”, “alcoxi”, “OSO<sub>2</sub>-heterociclilo”, “-O-arilalquilo”, “NR-SO<sub>2</sub>-alquilo”, “NR-CO-alquilo”, “NR-CO-NR-alquilo”, “hidroxialquilo”, “alquilo-CO-O-alquilo”, “arilalquilo”, “alcoxycarbonilo”, “arilo”, entre otros.

El Examinador sugiere limitar la materia reclamada a una razonable generalización de los ejemplos, como sigue:

| Sustituyente                                                          | Soportado en el Capítulo Descriptivo                                                                                                                                                                                                                                                          |
|-----------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| R <sup>1a</sup> , R <sup>1b</sup> , R <sup>1c</sup> , R <sup>1q</sup> | H, F                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| R <sup>2a</sup> , R <sup>2b</sup> , R <sup>2c</sup> , R <sup>2q</sup> | H, F, Cl, CH <sub>3</sub>                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| R <sup>3a</sup> , R <sup>3b</sup> , R <sup>3c</sup> , R <sup>3q</sup> | H, F, Cl, Br, CH <sub>3</sub> , CN                                                                                                                                                                                                                                                            |
| R <sup>4a</sup>                                                       | H, F, Cl                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| R <sup>5a</sup> , R <sup>5b</sup> , R <sup>5c</sup> , R <sup>5q</sup> | H, CH <sub>3</sub> , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , CN, CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                                                                                                                                   |
| R <sup>6a</sup>                                                       | H, OCH <sub>3</sub> , CH <sub>2</sub> OH, F, Cl                                                                                                                                                                                                                                               |
| R <sup>7a</sup> , R <sup>7b</sup> , R <sup>7c</sup> , R <sup>7q</sup> | H, OH, F, Cl, Br, CH <sub>3</sub> , CF <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> , CN, COOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , CHO, NH <sub>2</sub> , OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , COOH, CONH <sub>2</sub> ,<br> |
| R <sup>8a</sup> , R <sup>8b</sup> , R <sup>8c</sup> , R <sup>8q</sup> | H, CH <sub>3</sub> , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ,                                                                                                                                                                                                                                        |



b- Me permito llamar respetuosamente la atención del Examinador sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto donde se ha limitado la materia particularmente a compuestos de Fórmula II, y donde la definición de sus sustituyentes, de acuerdo con una generalización razonable de los compuestos ejemplificados, como a continuación se resume:

- en la Reivindicación 1,  $R^{5q}$  ahora significa hidrógeno, alquilo $C_{1-4}$  o ciano;  $R^{7q}$  ahora significa alquilo $C_{1-4}$  opcionalmente sustituido con  $-NR'-SO_2-$  alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2-$ haloalquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)-$ alquilo $C_{1-4}$ , o  $-NR'-C(O)-NR'-$ alquilo $C_{1-4}$ ;  $R^{8q}$  ahora significa hidrógeno o alquilo $C_{1-4}$  únicamente;  $R'$  ahora significa independientemente hidrógeno o alquilo  $C_{1-4}$ ; se eliminó la opción de reclamar polimorfos, rotámeros, pro-fármacos, enantiómeros, hidratos, y solvatos del compuesto de Fórmula II;
- en la Reivindicación 1 se limitó la condición del significado de  $R^{5q}$ , de modo que ahora cuando significa ciano, entonces cuando menos uno de  $R^{2q}$ ,  $R^{3q}$ , y  $R^{8q}$  es diferente de hidrógeno;
- en la Reivindicación 1, se aclaró el significado del término alquilo. Esta modificación encuentra sustento en el Capítulo Descriptivo, página 23;
- en la nueva Reivindicación 2 (antigua Reivindicación 4), se eliminó el radical  $R^{2q}$ ;
- en las nuevas Reivindicaciones 4 a 8 (antiguas Reivindicaciones 7, 8, 10 a 12), se corrigieron los radicales de modo que definieran  $R^{3q}$ ,  $R^{5q}$ ,  $R^{7q}$ ,  $R^{8q}$ , en lugar de  $R^{5b}$ ,  $R^{7b}$ ,  $R^{8b}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{5c}$ ,  $R^{7c}$ ,  $R^{8c}$  de acuerdo con la nomenclatura de la Fórmula II;
- en la nueva Reivindicación 4 (antigua Reivindicación 7),  $R^{5q}$  significa alquilo $C_{1-4}$  únicamente; se eliminaron los radicales  $R^{2b}$ ,  $R^{3b}$ ,  $R^{7b}$ ,  $R^{8b}$  y  $R'$  junto con la

- posibilidad de reclamar las sales farmacéuticamente aceptables, polimorfos, rotámeros, profármacos, enantiómeros, hidratos, y solvatos del compuesto;
- en la nueva Reivindicación 5 (antigua Reivindicación 8),  $R^{5q}$  significa metilo, etilo o isopropilo;  $R^{7q}$  significa alquilo $C_{1-4}$  sustituido con  $-NR'-SO_2$ -alquilo  $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2$ -haloalquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)$ -alquilo $C_{1-4}$ , o  $-NR'-C(O)-NR'$ -alquilo $C_{1-4}$ ,  $R^{8q}$  significa hidrógeno, metilo o etilo;  $R'$  significa independientemente hidrógeno o alquilo $C_{1-4}$ , y se eliminaron los radicales  $R^{2b}$  y  $R^{3b}$ ;
  - en la nueva Reivindicación 6 (antigua Reivindicación 10),  $R^{5q}$  significa ciano,  $R^{8q}$  significa alquilo $C_{1-4}$ , y se eliminaron los radicales  $R^{2c}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{7c}$  y  $R'$ ;
  - en la nueva Reivindicación 7 (antigua Reivindicación 11),  $R^{3q}$  es hidrógeno o halógeno;  $R^{5q}$  es ciano;  $R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  opcionalmente sustituido con  $-NR'-SO_2$ -alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2$ -halo-alquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)$ -alquilo $C_{1-4}$ ;  $R^{8q}$  es alquilo $C_{1-4}$ ; cada  $R'$  es independientemente hidrógeno, metilo, etilo o propilo, y se eliminó el radical  $R^{2c}$ ;
  - se introdujo la nueva Reivindicación 9 que reclama específicamente los compuestos de los Ejemplos 152, 164, 165, 168, 171, 221c y 187; y
  - por último, en la nueva Reivindicación 10 (antigua Reivindicación 14), se limitó la composición farmacéutica para incluir únicamente una cantidad efectiva de un compuesto de Fórmula II, y un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

Así las cosas, de acuerdo con las limitaciones realizadas, considero respetuosamente que el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto corresponde a una generalización razonable y limitada de la materia ilustrada en los Ejemplos.

5. a- El Examinador señala que las patentes US3468894 (D1) y US4478842 (D2), afectan la novedad de las Reivindicaciones 1, 6, 7, 13 y 16, y que la patente US4460777 (D3) afecta el nivel inventivo de las Reivindicaciones 1 a 19 de la presente invención.

i) Con respecto a la novedad, el Examinador señala que D1 divulga compuestos derivados de 2-piridil indol con actividad antagonista de la Aldosterona, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares. De manera semejante, D2 describe compuestos derivados de 2-piridil indol para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares.

# OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

El Examinador concluye que las características esenciales de los compuestos reclamados en las Reivindicaciones 1, 6 y 13 y dependientes, ya se encontraban divulgadas en D1 y D2, por ejemplo, derivados de 2-(piridin-3-il)-indol como inhibidores de aldosterona.

ii) Con respecto al nivel inventivo, el Examinador indica que D3 divulga compuestos derivados de 2-piridil indol para el tratamiento de desórdenes cardiovasculares, y presenta un cuadro comparando las características estructurales de los compuestos aquí reclamados con los compuestos divulgados en D3. El Examinador concluye que la diferencia entre la presente invención y D3 consiste en que para  $R^{8q}$ , el arilo puede estar sustituido por CN, mientras que para D3, el arilo perteneciente al sustituyente B se sustituye por carboxi.

Adicionalmente, el Examinador señala que la solicitud no contiene valores de actividad que indiquen las ventajas sobre D3 y por lo tanto no es posible identificar un efecto técnico inesperado.

Finalmente, el Examinador concluye que una persona medianamente versada en la materia siguiendo las enseñanzas del arte previo podría haber producido los compuestos de la invención, intercambiando el grupo carboxilo por CN, ya que las propiedades farmacocinéticas y farmacodinámicas de los compuestos no cambian, haciendo obvia la presente invención.

b- i) En primer lugar, una vez más llamo la atención del Examinador sobre las limitaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, en donde específicamente se reclama el compuesto de Fórmula II, cuyos grupo de sustituyentes se han limitado drásticamente tal y como se indicó en los puntos 1 y 4.b del presente memorial.

ii) Ahora bien, respecto al arte previo citado por el Examinador, me permito resaltar lo siguiente:

- D1 no comprende compuestos con un grupo 3-piridinilo sustituido en la posición 5, como los compuestos de Formula II de la presente invención. En D1 los grupos piridinilo están necesariamente insustituídos;
- D2 no comprende compuestos cuyo sustituyente equivalente al radical  $R^{8q}$  de la presente invención (sustituyente sobre el nitrógeno del grupo indol)

signifiquen hidrógeno o alquiloC<sub>1-4</sub> únicamente, tal como se limitó en el Capítulo Reivindicatorio Modificado.

En este punto vale la pena recordar que para fundamentar una afectación válida contra la novedad de una invención, el arte previo debe divulgar explícitamente todas y cada una de las características de la invención.<sup>1</sup> Es más, el Tribunal Andino de Justicia (TAJ) ha determinado que para establecer una objeción válida contra la novedad, la divulgación del arte previo debe ser lo suficientemente detallada para que una persona versada en la materia pueda usar dicha información para reproducir y explotar la invención.<sup>2</sup>

En el presente caso, ni D1 ni D2 divulgan específicamente compuestos con el mismo conjunto de sustituyentes que en la presente invención. En conclusión, la materia objeto de la presente invención es novedosa sobre D1 o D2.

iii) Con respecto a las objeciones de nivel inventivo realizadas por el Examinador con base en D3, me permito resaltar lo siguiente:

- D3 enseña compuestos derivados de 2-piridin indol que necesariamente poseen un sustituyente carbonilo o hidroxí en la posición 1 del sistema indol, tal como se ilustra en sus 17 ejemplos;
- no hay ejemplo alguno en D3 que proporcione sugerencias específicas respecto a no sustituir dicha posición 1 del grupo indol (cuando R<sup>8q</sup> es hidrógeno) o solamente incluir un sustituyente alquiloC<sub>1-4</sub>.

Evidentemente, no existe enseñanza alguna en D3 que conduzca a la persona medianamente versada en la materia a utilizar sustituyentes diferentes a los allí ilustrados para la posición 1 del grupo indol. Es más, ninguno de los Ejemplos de D3 ilustran o por lo menos sugieren a la persona medianamente versada en la materia la posibilidad de utilizar en dichos compuestos una disposición estructural similar a la de la presente invención (R<sup>8q</sup> es hidrógeno o alquiloC<sub>1-4</sub>). Antes bien, las enseñanzas y sugerencias de D3 necesariamente conducirían a la persona medianamente versada en la materia a producir derivados de indol que tengan un sustituyente

<sup>1</sup> Manual Andino de Patentes. (2004). Sección 9.4. (disponible en <http://www.comunidadandina.org/public/patentes.pdf>).

<sup>2</sup> Proceso 06-IP-89 (<http://intranet.comunidadandina.org/Documentos/Procesos/209-IP-2005.doc>); y Proceso 36-IP-2004 (<http://www.notinet.com.co/serverfiles/servicios/archivos/30jul04/ca36-04.htm>)

carbonilo o hidroxilo en la posición 1. La persona medianamente versada en la materia siguiendo las enseñanzas de D3, habría estado necesariamente sesgada a producir compuestos diferentes estructuralmente. La única forma en que una persona medianamente versada en la materia podría llegar a la sustitución que menciona el Examinador en su examen de fondo sería al realizar un análisis en retrospectiva una vez conoce la invención aquí reclamada.

Ahora bien, la única enseñanza de D3 respecto de la actividad de los compuestos derivados de indol allí divulgados, es que éstos resultarían útiles como inhibidores de tromboxano. No hay sugerencia alguna en D3 que indique a la persona medianamente versada en la materia cómo desarrollar compuestos que resulten activos como inhibidores de aldosterona la sintetasa.

En este sentido, me permito llamar la atención del Examinador sobre los resultados de actividad inhibitoria obtenidos para los compuestos de la presente invención (ver Capítulo Descriptivo, Tabla 1). La Tabla 1 señala que los compuestos de la presente invención presentan valores de  $IC_{50}$  de menos de 105 nM en la medición de la secreción de aldosterona de las células, y valores de  $IC_{50}$  de hasta mayores de 1000 nM en la secreción de Cortisol de las células.

De ninguna manera es posible predecir que la estructura particular de los compuestos reclamados pueda proveer la actividad señalada en la Tabla 1, menos aún a partir de las enseñanzas de D3 que revelan compuestos estructuralmente diferentes y una actividad biológica no relacionada con la presente invención. La persona medianamente versada en la materia no habría esperado obtener los resultados alcanzados por la presente invención con base en las enseñanzas de D3.

A la luz de lo anterior, y según los lineamientos del Manual Andino de Patentes (MAP), debe reconocerse que las invenciones en el campo de la química tienen nivel inventivo cuando tienen una estructura inesperada (no derivable por la persona medianamente versada en la materia), o presenten un efecto técnico inesperado o mejorado impredecible del arte previo.<sup>3</sup> En el presente caso, no solo la estructura de los compuestos es inesperada, sino también la actividad proporcionada por las mismas, lo que es una clara evidencia de nivel inventivo.

6. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo, han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de patentabilidad y proceda con la concesión de la patente.

<sup>3</sup> Manual Andino de Patentes. (2004). Sección 10.8.1 (disponible en <http://www.comunidadandina.org/public/patentes.pdf>)

# OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexo:

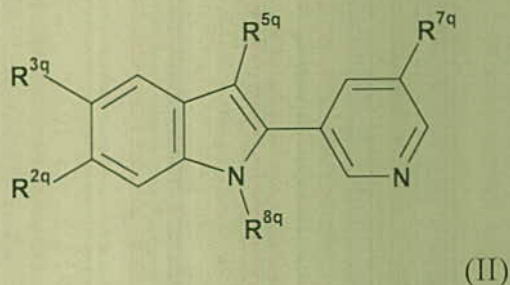
- Capítulo Reivindicatorio Modificado

10

## CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

### (Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto de la Fórmula II:



en donde:

$R^{2q}$  es hidrógeno o halógeno;

$R^{3q}$  es hidrógeno, halógeno, o ciano;

$R^{5q}$  es hidrógeno, alquilo $C_{1-4}$ , o ciano;

$R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  opcionalmente sustituido con  $-NR'-SO_2-$  alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2-$  haloalquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)-$  alquilo $C_{1-4}$ , o  $-NR'-C(O)-NR'-$  alquilo $C_{1-4}$ ;

$R^{8q}$  es hidrógeno o alquilo $C_{1-4}$ ;

cada  $R'$  es independientemente hidrógeno o alquilo $C_{1-4}$ ; y las sales farmacéuticamente aceptables del mismo;

con la condición de que cuando  $R^{5q}$  es ciano, entonces cuando menos uno de  $R^{2q}$ ,  $R^{3q}$ , y  $R^{8q}$  es diferente de hidrógeno; y en donde

alquilo $C_{1-4}$  incluye a los grupos alifáticos saturados de cadena recta y cadena ramificada, que tienen de 1 a 4 átomos de carbono en su estructura.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde:

$R^{3q}$  es hidrógeno o halógeno;

$R^{5q}$  es hidrógeno o ciano;

$R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  opcionalmente sustituido con heterociclilo,  $-NR'-SO_2-$  alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2-$  haloalquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)-$  alquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)-$  heterociclilo,  $-NR'-C(O)-NR'-$  alquilo $C_{1-4}$ , o  $-NR'-C(O)-O-$  alquilo $C_{1-4}$ ;

$R'$  es independientemente hidrógeno, o alquilo $C_{1-4}$ ; y

$R^{8q}$  es hidrógeno, o alquilo $C_{1-4}$ .

3. El compuesto de acuerdo con las Reivindicaciones 1 a 4, en donde:

$R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  sustituido con  $-NR'-SO_2-$  alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2-$  haloalquilo $C_{1-4}$ , o  $NR'-C(O)-$  alquilo $C_{1-4}$ ;

$R'$  es independientemente hidrógeno, o alquilo $C_{1-4}$ ; y

4

$R^{8q}$  es hidrógeno, metilo, o etilo.

4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde  $R^{5q}$  es alquilo $C_{1-4}$ .
5. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 4, en donde:  
 $R^{5q}$  es metilo, etilo, o isopropilo;  
 $R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  sustituido con  $-NR'-SO_2$ -alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2$ -haloalquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)$ -alquilo $C_{1-4}$ , o  $-NR'-C(O)-NR'$ -alquilo $C_{1-4}$ ;  
 $R^{8q}$  es hidrógeno, metilo, o etilo;  
cada  $R'$  es independientemente hidrógeno, o alquilo $C_{1-4}$ .
6. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde  $R^{5q}$  es ciano y  $R^{8q}$  es alquilo $C_{1-4}$ .
7. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 6, en donde:  
 $R^{3q}$  es hidrógeno, o halógeno;  
 $R^{5q}$  es ciano; y  
 $R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  opcionalmente sustituido con  $-NR'-SO_2$ -alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2$ -halo-alquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)$ -alquilo $C_{1-4}$ ;  
 $R^{8q}$  es alquilo $C_{1-4}$ ;  
cada  $R'$  es independientemente hidrógeno, metilo, etilo, o propilo.
8. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 7, en donde:  
 $R^{7q}$  es alquilo $C_{1-4}$  sustituido con  $-NR'-SO_2$ -alquilo $C_{1-4}$ ,  $-NR'-SO_2$ -halo-alquilo $C_{1-4}$ ,  $NR'-C(O)$ -alquilo $C_{1-4}$ ; y  
cada  $R'$  es independientemente hidrógeno o alquilo $C_{1-4}$ .
9. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, seleccionado a partir de:  
6-cloro-1-metil-2-(5-morfolin-4-il-metil-piridin-3-il)-1H-indol-3-carbonitrilo;  
N-metil-N-[5-(1-metil-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-metan-sulfonamida;  
N-metil-N-[5-(1-metil-3-ciano-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-metan-sulfonamida;  
N-[5-(6-cloro-3-ciano-1-metil-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-N-metil-metan-sulfonamida;  
N-[5-(6-cloro-3-ciano-1-metil-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-etan-sulfonamida;  
[5-(3-ciano-1-metil-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-amida del ácido propan-2-sulfónico;

12

[5-(6-cloro-3-ciano-1-metil-1H-indol-2-il)-piridin-3-il-metil]-amida del ácido  
2,2,2-trifluoro-etan-sulfónico;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. Una composición farmacéutica, la cual comprende:  
una cantidad efectiva de un compuesto de Fórmula II, de acuerdo con las  
Reivindicaciones 1 a 9, y  
un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable.

\*\*\*\*\*