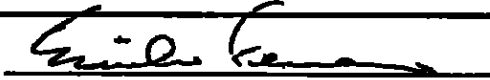


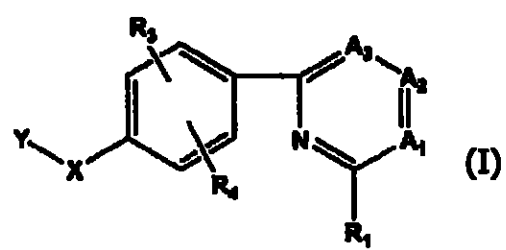
348

**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-F03**

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: EURO-CELTIQUE S.A. Dirección: 122, Boulevard de la Petrusse, L-2330 Luxemburgo, Luxemburgo Nacionalidad o Domicilio: Luxemburgo, Luxemburgo Lugar de Constitución: sociedad constituida y existente bajo las leyes de Luxemburgo Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@camyp.com	IDENTIFICACION CC ☐ NIT ☐ CE ☐ Otro ☐ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION CC ☒ NIT ☐ CE ☐ Otro ☐ Número 438.019 TP 31.929
4	Número de expediente: <u>02 080 440</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio donde se especifica mejor el alcance de la invención Las modificaciones que aquí presento se encuentran totalmente soportadas en la descripción y no amplían el alcance de la solicitud	
6	Comprobante de pago No. <u>04 - 48 942</u> Fecha <u>22 de Junio de 2004</u>	
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$ 87 000 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO	FIRMA:  CC 438 019 de Usaquén T.P.A. 31 929

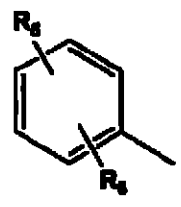
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tienen la fórmula I



15 o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de ésta, en donde:

Y es



o R₇, dado que cuando Y es R₇, R₁ es aminocarbonilo;

25 A₁, A₂ y A₃ son Independientemente CR₂ o N, dado que A₁, A₂ y A₃ no son todos N al mismo tiempo;

R₁ se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, C(O)R₈, SO₂R₈, OC(O)NH₂, 2-imidazolinilo, 2-imidazolllo, 3-pirazolilo, 5- isoxasolillo, y 3-(1,2,4)-triazolilo;

30 Cada R₂ es Independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como alquenilo o alquinilo, halógeno, hidroxil, cicloalquilo, ciano, amino, alquilamino, dialquillamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquillaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquillaminocarbonillo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino y aralquilcarbonilamino; o R₁, R₂ se toman junto con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

R₃, R₄, R₅ y R₆ son Independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquillo, hidroxil, nitro, amino, clano, amida, carboxialquillo, alcoxialquillo, ureído, aclamino, tiol, aciloxi, azi, alcoxi, carboxil, carbonilamino y alquiltiol; y

40 R₇ es un alquilo opcionalmente sustituido;

R₈ se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR₉, amino, alquilamino, dialquillamino, alquenilamino, dialquillaminoalquenillo, dialquillaminoalquillamino, dialquillaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino, hidroxiaminoalquenilamino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquillalquillamino, heterocicloalquillamino, arilo, arilalquillo, arilalquenilo, arilalquinilo y arilalquillamino, todos

los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que cuando R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 ; en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido y un metal alcalino;

X es uno de O, S, NH o CH_2 cuando Y es diferente de R_7 ; o

X es uno de O, S, NH, CH_2 o ausente cuando Y es R_7 ;

Con la condición que:

1.) R_2 no es metoxi si R_5 es trifluorometilo, R_6 es H, X es O y R_1 es SO_2CH_2Ph ;

2.) R_2 no es NH_2 si R_1 es metililo, X es O y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N;

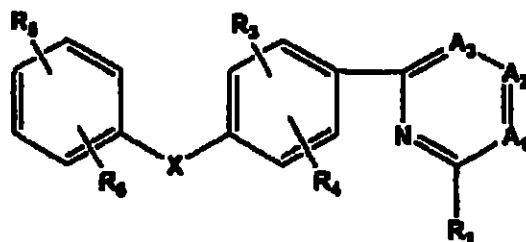
3.) R_2 no es metilo si R_1 es SO_2R_8 , en donde R_8 es metilfenilo, R_3 y R_4 son metoxi, X es S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N;

4.) R_2 no es CCl_3 si R_1 es CCl_3 , X es S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N; o

5.) R_1 y R_2 no son ambos NH_2 si X es O o S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N.

R_2 no es alquilcarbonilamino si R_1 es NH_2 ; X es O; R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son cada uno hidrógeno y, A_1 y A_3 son N.

2. Un compuesto que tiene la fórmula II:



o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de ésta, en donde:

A_1 , A_2 y A_3 son independientemente CR_2 o N, dado que A_1 , A_2 y A_3 no son todos N al mismo tiempo;

R_1 se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, $C(O)R_8$, SO_2R_8 , $OC(O)NH_2$, 2-imidazolinilo, 2-imidazolilo, 3-pirazolilo, 5-isoxasolilo, y 3-(1,2,4)-triazolilo, opcionalmente sustituidos;

Cada R_2 es independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como aminoalquilo, haloalquilo e hidroxialquilo, alquenoilo o alquínilo, halógeno, hydroxy, cicloalquilo, clano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquiloaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino y

aralquilarcarbonilamino; o R_1 y R_2 son tomados juntos con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hydroxy, 5 nitro, amino, ciano, amida, carboxialquilo, alcoxialquilo, ureido, acilamino, tilo, acloxi, azido, alcoxi, carboxi, carbonilamido, y alquiltiol;

R_8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquillaminoalquenilo, dialquilaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino, hidroxilaminoalquenilamino, 10 cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquillalquillamino, heterocicloalquillamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo y arilalquilamino, todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 , en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido y un metal alcalino;

15 X es uno de O, S, NH o CH_2 ;

Con la condición que:

1.) R_2 no es metoxi si R_5 es trifluorometilo, R_6 es H, X es O y R_1 es SO_2CH_2Ph ;

2.) R_2 no es NH_2 si R_1 es metililo, X es O y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N;

3.) R_2 no es metilo si R_1 es SO_2R_8 , en donde R_8 es metilfenilo, R_3 y R_4 son metoxi, X es S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N;

4.) R_2 no es CCl_3 si R_1 es CCl_3 , X es S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N; o

5.) R_1 y R_2 no son ambos NH_2 si X es O o S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N.

R_2 no es alquilarcarbonilamino si R_1 es NH_2 ; X es O; R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son cada uno hidrógeno y, A_1 y A_3 son N.

25

3. El compuesto de la reivindicación 2, en donde A_1 , A_2 , y A_3 son cada uno CR_2 ; o A_1 es N y A_2 y A_3 son CR_2 ; o A_3 es N y A_1 y A_2 son CR_2 ; o A_2 es N y A_1 y A_3 son CR_2 ; o A_1 y A_3 son N y A_2 es CR_2 .

30

4. El compuesto de la reivindicación 2, en donde R_1 se selecciona a partir del grupo que consiste de un alquilo opcionalmente sustituido por halógeno o hidroxilo, $C(O)R_8$, Si_2R_8 , 2-imidazolinil, 2-imidazolil, 3-pirazolil, y 5-isoxazolil, en donde R_8 se define como en la reivindicación 2, siempre que R_8 no sea OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 .

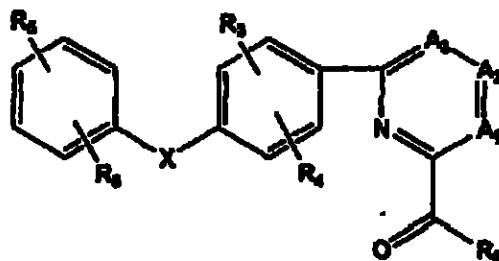
- 5 5. El compuesto de la reivindicación 4, en donde R_8 se selecciona a partir del grupo que consiste en alquilo, alqueno, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquilamino, dialquilaminoalqueno, dialquilaminoalquilamino, heterocicloalquilamino, todos de los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, y en donde R_9 es como se definió en la reivindicación 2.
- 10 6. El compuesto de la reivindicación 2 en donde R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alqueno, alquilo, aminoalquilo, amino, hidroxialquilo, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino y aralquilcarbonilamino.
7. El compuesto de la reivindicación 6 en donde R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alcoxi, aminoalquilo y aminocarbonilamino.
- 15 8. El compuesto de la reivindicación 2, en donde R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alqueno, alquilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxil, nitró, amino y ciano.
- 20 9. El compuesto de la reivindicación 8, en donde R_3 y R_4 son ambos hidrógeno y R_5 y R_6 son independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo, y nitró.
10. El compuesto de la reivindicación 2, en donde X es O o S.
- 25 11. El compuesto de la reivindicación 10, en donde X es O.
12. El compuesto de la reivindicación 2, en donde R_2 es hidrógeno, X es O o S y R_1 es aminocarbonilo.
- 30 13. El compuesto de la reivindicación 2, en donde A_2 es CR_2 , en donde R_2 es otro distinto a H y A_1 y A_3 son cada uno CH.
14. El compuesto de la reivindicación 2, en donde A_1 es N, A_2 es CR_2 , en donde R_2 es algo distinto a H y A_3 es CH.

15. El compuesto de la reivindicación 2 en donde A_3 es N, A_2 es CR_2 en donde CR_2 es otro distinto de H y A_1 es CH.

5 16. El compuesto de la reivindicación 2, en donde A_2 es N, A_1 es CR_2 , en donde R_2 es otro diferente de H, y A_3 es CH.

17. El compuesto de la reivindicación 2, que tiene la fórmula III:

15



20

o unas sales, prodroga y solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

A_1 - A_3 , R_2 - R_6 , R_7 y X son según se definió en la reivindicación 2.

25

18. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A_1 , A_2 y A_3 son cada uno CR_2 ; o A_1 es N y A_2 y A_3 son CR_2 ; o A_3 es N y A_1 y A_2 son CR_2 ; o A_2 es N y A_1 y A_3 son CR_2 ; o A_1 y A_3 son N y A_2 es CR_2 .

30

19. El compuesto de la reivindicación 17 en donde R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, aminoalquilo, amino, hidroxialquilo, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino y aralquilcarbonilamino.

35

20. El compuesto de la reivindicación 19, en donde R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alcoxi, aminoalquilo y aminocarbonilamino.

21. El compuesto de la reivindicación 17, en donde R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxil, nitro, amino y ciano.

22. El compuesto de la reivindicación 21, en donde R_3 y R_4 son ambos hidrógeno y R_5 y R_6 son Independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo, y nitro.

23. El compuesto de la reivindicación 17, en donde R_8 se selecciona a partir del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquelimaminoalquenilo, dialquilaminoalquilamion, y heterocicloalquilamino, todos los cuales pueden ser sustituidos opcionalmente siempre que R_8 no sea OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 , y en donde R_9 son según se definió en la reivindicación 2.

24. El compuesto de la reivindicación 17, en donde X es O o S.

25. El compuesto de la reivindicación 24, en donde X es O.

26. El compuesto de la reivindicación 17, en donde X es O;

A_1 , A_2 y A_3 son cada uno CR_2 ; o A_1 es N y A_2 y A_3 son CR_2 ; o A_3 es N y A_1 y A_2 son CR_2 ; o A_2 es N y A_1 y A_3 son CR_2 ; o A_1 y A_3 son N y A_2 es CR_2 ; en donde

R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo alcoxi, aminoalquilo y aminocarbonilo;

R_3 y R_4 son ambos hidrógeno;

R_5 y R_6 son independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo, y nitro; y

R_8 es amino.

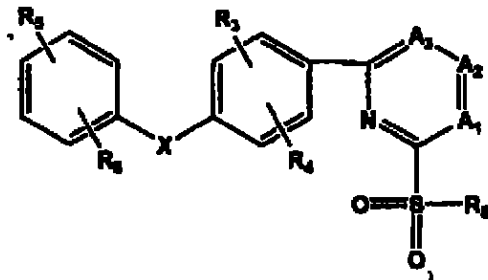
27. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A_2 es CR_2 , en donde R_2 es otro distinto a H y A_1 y A_3 son cada uno CH.

28. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A_1 es N, A_2 es CR_2 , en donde R_2 es distinto a H y A_3 es CH.

29. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A_3 es N, A_2 es CR_2 , en donde R_2 es distinto a H y A_1 es CH.

30. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A_2 es N, A_1 es CR_2 , en donde R_2 es distinto a H y A_3 es CH.

5 31. El compuesto de la fórmula 2, tiene la fórmula IV:



15 o unas sales, prodroga y solvatos farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde:

A_1 - A_3 , R_2 - R_6 , R_8 y X son según se definió en la reivindicación 2 y

20 R_8 se selecciona a partir del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquinnilamino, dialquilaminoalquenilo, dialquilaminoalquilamino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilamino, heterocicloalquilamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, y arilalquilamino, todos de los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos.

25 32. El compuesto de la reivindicación 31, en donde A_1 , A_2 y A_3 son cada uno CR_2 ; o A_1 es N y A_2 y A_3 son CR_2 ; o A_3 es N y A_1 y A_2 son CR_2 ; o A_2 es N y A_1 y A_3 son CR_2 ; o A_1 y A_3 son N y A_2 es CR_2 , y R_2 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, aminoalquilo, asino, hidroxialquilo, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino y aralquilcarbonilamino.

33. Los compuestos de la reivindicación 33, en donde R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alcoxi, aminoalquilo y aminocarbonilo.

35 34. El compuesto de la reivindicación 31, en donde R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 son seleccionadas independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxilo, nitro, amino y cloro.

35. El compuesto de la reivindicación 34, en donde R_3 y R_4 son ambos hidrógeno y R_5 y R_6 son seleccionados Independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo y nitro.

5 36. El compuesto de la reivindicación 31, en donde R_8 se selecciona a partir del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquilaminoalquenilo y heterocicloalquilamino, todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos.

10 37. El compuesto de la reivindicación 31, en donde X es O o S.

38. El compuesto de la reivindicación 37, en donde X es O.

39. Un compuesto de la reivindicación 2, en donde dicho compuesto es:

15 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(4-nitrofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(4-metoxifenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(4-trifluorometilfenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(3-cloro-2-cianofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 20 4-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(2,4-difluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 4-[4-(2-cloro-4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxamida;
 1-[4-(4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-etanona;
 2-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxamida;
 25 2-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]-4-metilpirimidina;
 2-metil-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;
 ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
 sal de sodio de ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
 metilamida de ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
 30 dimetilamida de ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
 tert-butilamida 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
 2-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-caarboxamida;
 ácido 2-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxílico;
 dimetilamida de ácido 2-(4-fenoxifenil)-6-(dimetilamino)pirimidina-4-carboxílico;

2-hidroxi-etilamida de ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;
hidroximetilenoamida de ácido 4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;

2-(2-hidroxi-prop-2-il)-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

5 2-morfolin-4-il-etilamida de ácido 4-[4-(2,4-difluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-carboxílico;

2-(4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]-piridina;

2-(3-pirazolil)-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

2-(5-isoxazolil)-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

10 2-(1-metil-3-pirazolil)-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

metilamida de ácido 2-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxílico;

3-dimetilamino-1-(4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-2-il]propenona;

2-tiometil-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

2-metanosulfonil-4-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]pirimidina;

15 2-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]-4-metil-piridina;

4-[4-(4-fluorofenoxi)-3-fluorofenil]pirimidina-2-carboxamida;

2-[4-(4-fluorofenoxi)-3-fluorofenil]pirimidina-4-carboxamida;

2-metil-6-(4-fenoxifenil)piridina;

6-(4-fenoxifenil)piridina-2-carboxamida;

20 2-metil-6-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]piridina;

ácido 6-(4-fenoxifenil)piridina-2-carboxílico;

metilamida de ácido 6-(4-fenoxifenil)piridina-2-carboxílico;

6-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]piridina-2-carboxamida;

6-[4-(2,4-difluorofenoxi)fenil]piridina-2-carboxamida;

25 6-[4-(4-cloro-2-fluorofenoxi)fenil]piridina-2-carboxamida;

6-[4-(4-fluorofenoxi)-3-fluorofenil]piridina-2-carboxamida;

6-[4-(4-trifluormetilfenoxi)fenil]piridina-2-carboxamida;

6-(4-fenoxifenil)pirazina-2-carboxamida;

3,5-diamino-6-(4-fenoxifenil)pirazina-2-carboxamida; o

30 2-[4-(4-nitrofenoxi)fenil]-4-metil-[1,3,5]-triazina.

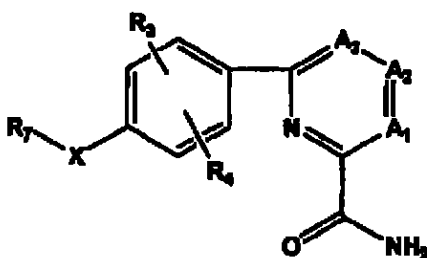
o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de estas.

40. Un compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es:

N-piperidiniletilamida de ácido 6-[4-(4-fluorofenoxi)fenil]piridina carboxílico;

6-(4-*tert*-butilfenil)piridina-2-carboxamida;
 6-(4-*n*-butilfenil)piridina-2-carboxamida;
 6-(4-*i*-propenilfenil)piridina-2-carboxamida;
 6-(4-tiometilfenil)piridina-2-carboxamida;
 5 6-(4-etoxifenil)piridina-2-carboxamida; o
 6-(4-metoxifenil)piridina-2-carboxamida.
 o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de éstas.

10 41. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene la fórmula V:



20

o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de esta, en donde:
 A₁-A₃ y R₇ son como se definió en la reivindicación 1; y
 X es uno de O, S, NH, CH₂ o ausente.

25 42. El compuesto de la reivindicación 41, en donde A₁, A₂ y A₃ son cada uno CR₂; o
 A₁, A₂ y A₃ son cada uno CR₂; o A₁ es N y A₂ y A₃ son CR₂; o A₃ es N y A₁ y A₂ son CR₂;
 o A₂ es N y A₁ y A₃ son CR₂; o A₁ y A₃ son N y A₂ es CR₂.

30 43. El compuesto de la reivindicación 41, en donde R₇ es alquilo C₁₋₆ opcionalmente
 sustituido con uno o más de halógeno, hidroxilo, nitró, amino, cloro y alcoxi.

44. El compuesto de la reivindicación 41, en donde R₂ se selecciona del grupo que
 consiste de hidrógeno, alquilo, alcoxi, aminoalquilo, y aminocarbonilo.

35 45. El compuesto de la reivindicación 41, en donde R₃ y R₄ son independientemente
 seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, alquino,
 halógeno, haloalquilo, hidrohaloalquilo, hidroxilo, nitró, amino, y cloro.

46. El compuesto de la reivindicación 45, en donde R₃ y R₄ son ambos hidrógeno.

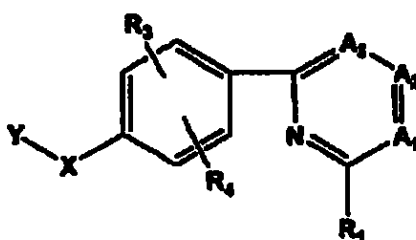
40

47. El compuesto de la reivindicación 41, en donde X es O o S.

48. El compuesto de la reivindicación 47, en donde X es O.

49. El compuesto de la reivindicación 41, en donde dicho compuesto es 6-[(4-trifluorometoxi)fenil]piridina-2-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de estas.

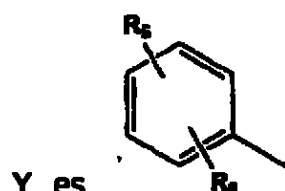
50. Una composición farmacéutica, comprende el compuesto de la fórmula:



15

o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de esta, en donde:

20



Y es o R₇, dado que cuando Y es R₇, R₁ es aminocarbonilo;

A₁, A₂, y A₃ son Independientemente CR₂ o N, dado que A₁, A₂, y A₃ no son todos

N al mismo tiempo;

30

R₁ se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, C(O)R₈, OC(O)NH₂, 2-imidazolinilo, 2-imidazolilo, 3-pirazolilo, 5-isoxazolilo, y 3-(1,2,4)-triazolilo;

Cada R₂ es Independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como aminoalquilo, aloalquilo e hidroxialquilo, alquenilo, o alquinilo, halógeno, hidroxilo, cicloalquilo, clano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino, y aralquilcarbonilamino; o R₁, R₂ se toman juntos con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

35

R₃, R₄, R₅, y R₆ son Independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxilo, nitró, amino, clano, amida, carboxialquilo, alcoxi, ureido, acilamino, tiol, aciloxi, azido, alcoxi, carboxi, carbonilamino, y alquiltiol; y

40

R_7 es un alquilo opcionalmente sustituido;

R_8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquilaminoalquenilo, dialquilaminoalquil amino, dialquilaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino, hidroxilaminoalquenil amino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilamino, heterocicloalquilamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, y arilalquilamino, todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que cuando R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 ; en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, y un metal alcalino;

X es uno de O, S, NH, o CH_2 cuando Y es diferente de R_7 ;

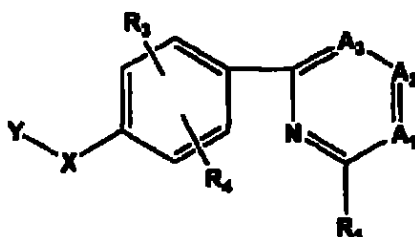
X es uno de O, S, NH, CH_2 o ausente cuando Y es R_7 ; y un portador farmacéuticamente aceptable o solvente.

R_1 y R_2 no son ambos NH_2 si X es O o S y dos de A_1 , A_2 y A_3 son N.

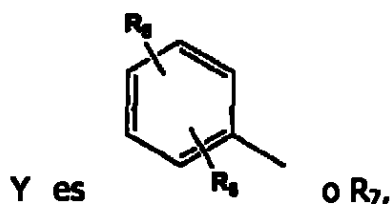
R_2 no es alquilcarbonilamino si R_1 es NH_2 ; X es O; R_3 , R_4 , R_5 y R_6 son cada uno hidrógeno y, A_1 y A_3 son N.

51. La composición de la reivindicación 50, en donde el compuesto es como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1-49.

52. Una composición para tratar un desorden que responde al bloqueo de los canales de sodio en mamíferos que los sufren, que comprende una cantidad efectiva de un compuesto activo de fórmula:



o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvente de esta, en donde:



dado que cuando Y es R_7 , R_1 es aminocarbonilo;

A_1 , A_2 , y A_3 no son todos N al mismo tiempo;

R_1 se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, $C(O)R_8$, SO_2R_8 , $OC(O)NH_2$, 2-imidazolinilo, 2-imidazolilo, 3-pirazolilo, 5-isoxazolilo, y 3-(1,2,4)-triazolilo;

5 Cada R_2 es Independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como aminoalquilo, aloalquilo e hidroxialquilo, alquenilo, o alquinilo, halógeno, hidroxil, cicloalquilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino, y
10 aralquilcarbonilamino; o R_1 , R_2 se toman juntos con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 son Independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxil, nitro, amino, ciano, amida, carboxialquilo, alcoxialquilo, ureido, aclamino, tiol, aciloxi,
15 azido, alcoxi, carboxi, carbonilamino, y alquiltiol; y

R_7 es un alquilo opcionalmente sustituido;

R_8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquilaminoalquenilo, dialquilaminoalquil amino, dialquilaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino,
20 hidroxilaminoalquenil amino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilamino, heterocicloalquilamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, y arilalquilamino, todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que cuando R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 ; en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente
25 sustituido, y un metal alcalino;

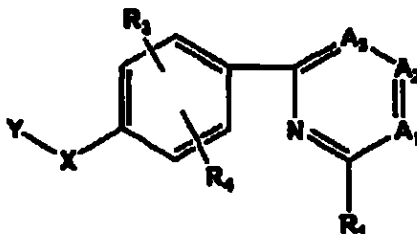
X es uno de O, S, NH, o CH_2 cuando Y es diferente de R_7 ;

X es uno de O, S, NH, CH_2 o ausente cuando Y es R_7 ;

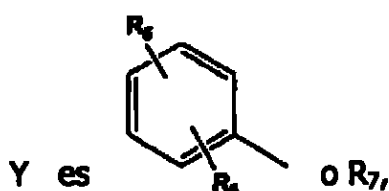
53. La composición de la reivindicación 52, en donde el compuesto activo es según
30 se reivindicó en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 49.

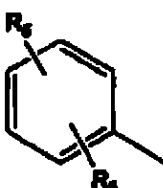
54. Una composición para tratar, prevenir o mejorar pérdida neuronal seguido de isquemia global y focal; tratar, prevenir o mejorar condiciones neurodegenerativas, tratar, prevenir o mejorar dolor o tinnitus; tratar, prevenir o mejorar depresión maníaca,

suministrar anestesia local; o tratar arritmias, o tratar convulsiones, que comprende una cantidad efectiva de un compuesto activo de fórmula:



o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvente de esta, en donde:



Y es  o R₇,
dado que cuando Y es R₇, R₁ es aminocarbonilo;

A₁, A₂, y A₃ son independientemente CR₂ o N, dado que A₁, A₂, y A₃ no son todos

N al mismo tiempo;

R₁ se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, C(O)R₈, OC(O)NH₂, 2-imidazolinilo, 2-imidazolilo, 3-pirazolilo, 5-isoxazolilo, y 3-(1,2,4)-triazolilo;

Cada R₂ es Independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como aminoalquilo, aloalquilo e hidroxialquilo, alquenilo, o alquinilo, halógeno, hidroxil, cicloalquilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino, y aralquilcarbonilamino; o R₁, R₂ se toman juntos con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

R₃, R₄, R₅, y R₆ son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxil, nitro, amino, ciano, amida, carboxialquilo, alcoxialquilo, ureido, acilamino, tiol, aciloxi, azido, alcoxi, carboxil, carbonilamino, y alquiltiol; y

R₇ es un alquilo opcionalmente sustituido;

R₈ se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR₉, amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquilaminoalquenilo, dialquilaminoalquil amino, dialquilaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino, hidroxilaminoalquenil amino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilamino, heterocicloalquilamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, y arilalquilamino,

todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que cuando R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 ; en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, y un metal alcalino;

5 X es uno de O, S, NH, o CH_2 cuando Y es diferente de R_7 ;

X es uno de O, S, NH, CH_2 o ausente cuando Y es R_7 .

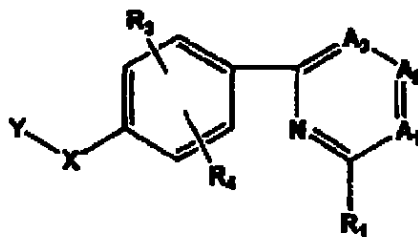
55. La composición de la reivindicación 54, en donde el compuesto activo es según se reivindica en una de las reivindicaciones 1 a 49.

10

56. La composición de la reivindicación 54 para tratar, prevenir o mejorar dolor y dicho dolor es uno del dolor neuropático, dolor de cirugía o dolor crónico.

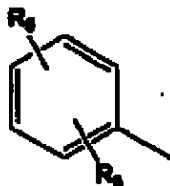
57. Una composición para aliviar o prevenir actividad de daños en un sujeto animal, que comprende una cantidad efectiva de un compuesto activo de fórmula:

15

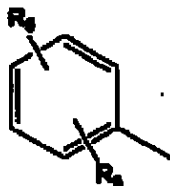


25

o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvente de esta, en donde:



30

Y es  o R_7 ;

dado que cuando Y es R_7 , R_1 es aminocarbonilo;

A_1 , A_2 , y A_3 son independientemente CR_2 o N, dado que A_1 , A_2 , y A_3 no son todos N al mismo tiempo;

R_1 se selecciona del grupo que consiste de un alquilo, amino, alquiltiol, $C(O)R_8$, SO_2R_8 , $OC(O)NH_2$, 2-Imidazolinilo, 2-Imidazolilo, 3-pirazolilo, 5-isoxazolilo, y 3-(1,2,4)-triazolilo;

35

Cada R_2 es independientemente seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, un alquilo opcionalmente sustituido, tal como aminoalquilo, aloalquilo e hidroxialquilo, alquenilo, o alquinilo, halógeno, hidroxilo, cicloalquilo, ciano, amino,

alquilamino, dialquilamino, alcoxi, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, aralquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino, y aralquilcarbonilamino; o R_1 , R_2 se toman juntos con los átomos de carbono a los cuales ellos están unidos para formar un anillo heterocíclico;

5 R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, hidroxialquilo, hidroxi, nitró, amino, ciano, amida, carboxialquilo, alcoxialquilo, ureido, acllamino, tiol, acloxi, azido, alcoxi, carboxi, carbonilamino, y alquiltiol; y

R_7 es un alquilo opcionalmente sustituido;

10 R_8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, OR_9 , amino, alquilamino, dialquilamino, alquenilamino, dialquilaminoalquenilo, dialquilaminoalquil amino, dialquilaminoalquenilamino, alquilaminoalquenilamino, hidroxiaminoalquenil amino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilamino, heterocicloalquilamino, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, y arilalquilamino, todos los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos, dado que cuando R_8 no es OR_9 cuando R_1 es SO_2R_8 ; en donde

R_9 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, y un metal alcalino;

X es uno de O, S, NH, o CH_2 cuando Y es diferente de R_7 ;

20 X es uno de O, S, NH, CH_2 o ausente cuando Y es R_7 .

58. La composición de la reivindicación 57 en donde el compuesto activo es uno de los reivindicados en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 49.

25 59. El compuesto de la reivindicación 2, donde dicho compuesto es 2-[4-(cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de la misma.

60. El compuesto de la reivindicación 59, el cual es 2-[4-(cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxamida.

61. La composición farmacéutica de la reivindicación 50 que comprende 2-[4-(cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxamida o una sal farmacéuticamente aceptable, prodroga o solvato de la misma.

62. La composición farmacéutica de la reivindicación 61 que comprende 2-[4-(cloro-2-fluorofenoxi)fenil]pirimidina-4-carboxamida.

5

10

15 COLO13416 841 001-4
PRP/JAG/WPC13416/ID-000011.

36 77

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 82800440 00000006 Folios: 19
Fecha (AMB): 2004-06-30 17:05:44
Trámite : 011 PCT-PATENT 370 FASE NACI 329 COMPLETA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800174089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 48,942
FECHA : JUNIO 22 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CANELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	23490076	22/06/2004	29,913,360.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	97,000.00
		TOTAL :	9 87,000.00

SON: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____ 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 13416-841.007 4