

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6089700 Fax 6089701

244
221

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 05042906 00000002

Folios: 29

Fecha (MM): 2005-05-24 16:31:51

Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MACI 329 COMPLEME

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: **P1.-MERCK & CO., INC.-Solicitud de Patente de**
Invencción en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE
FENILALANINA COMO INHIBIDORES DE
DIPEPTIDILPEPTIDASA PARA EL TRATAMIENTO O
PREVENCIÓN DE DIABETES".-Clase C07D 295/18.-
Expediente número 05-042.906.-

1. Me refiero a mi memorial presentado el 18 de Mayo de 2005.

2. Debidamente autorizado por mí representado me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar un nuevo juego de reivindicaciones en el que se cancelan las reivindicaciones 29 a 34 del capítulo reivindicatorio originalmente presentado.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de manera alguna el alcance de la presente Invencción.

3. Anexos:

(a) Recibo No. 05-28.468, expedido por la SuperIntendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;

(b) Formulario único de modificaciones y correcciones; y

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6089700 Fax 6089701

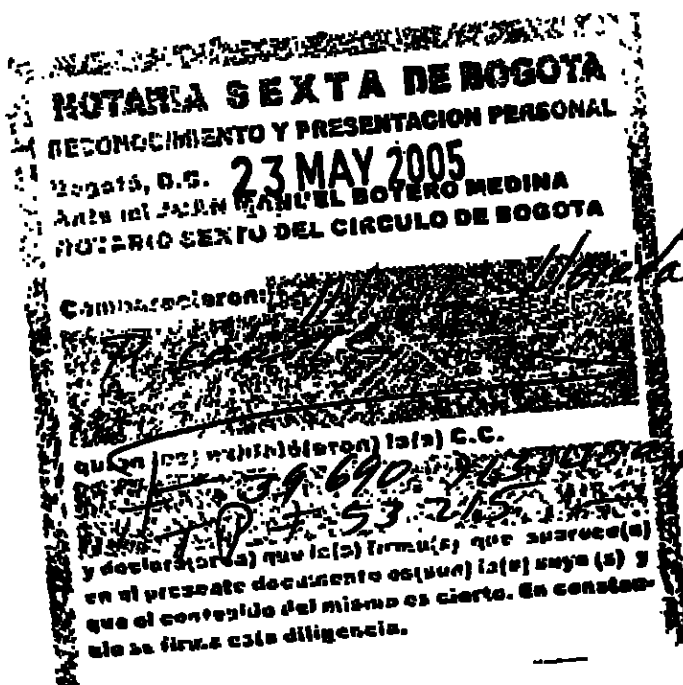
212
222

(c) Copia de las páginas 96 a 121 del capítulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado originalmente, en el cual se ha realizado la modificación expuesta anteriormente.

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

Señor SuperIntendente,


ALICIA LLORED A RICAURTE
T.P. 53.215
Código 231




ALICIA LLORED A RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

S LICITANTE

Nombre: **MERCK & CO., INC.,** sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de New Jersey, Estados Unidos de América.

Dirección: 126 East Lincoln Avenue, Rahway, Estado de New Jersey 07085-0907, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270

8 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Rahway, Estado de New Jersey, Estados Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, Colombia

Teléfono: 3 264270

Fax: 8 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

05-042.906

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificación al capítulo reivindicatorio

⑥

Comprobante de pago No. 05 - 28.468

Fecha 19/04/2005

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Podemos, si fuere el caso.

☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

214
224

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacon : 05042386 00000002 Folios: 29
Fecha (AMD): 2005-05-24 16:31:51
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLETADO
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 28,468
FECHA : ABRIL 19 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
AYDEE LINARES	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	29721124	19/04/2005	8,429,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	91,000.00
		TOTAL :	\$ 91,000.00

SON: NOVENTA Y UNO MIL PESOS

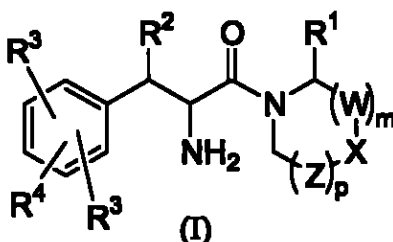
RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

215
265

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula estructural I:



5 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; en el que

cada n es independientemente 0, 1, o 2;

m y p son cada uno de ellos independientemente 0 ó 1;

X es CH₂, S, CHF, o CF₂;

10 W y Z son cada uno de ellos independientemente CH₂, CHF, o CF₂;

R¹ es hidrógeno o ciano;

cada R³ se selecciona independientemente del grupo que consta de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, trifluorometilo, trifluorometoxi, e hidrox;

15

R⁴ es arilo, heteroarilo, o heterociclilo, en el que arilo, heteroarilo, y heterociclilo no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco sustituyentes R⁵;

R² se selecciona del grupo que consta de

20

alquilo C₁₋₁₀, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno o hidrox,

alquenilo C₂₋₁₀, en el que alquenilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno o hidrox,

25

(CH₂)_n-arilo, en el que arilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de hidrox, halógeno, CO₂H, alquilocarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en el que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

(CH₂)_n-heteroarilo, en el que el heteroarilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de hidrox, halógeno,

30

216
226

- CO₂H, alquilocarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en el que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,
- 5 (CH₂)_n-heterociclilo, en el que heterociclilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de oxo, hidroxí, halógeno, CO₂H, alquilocarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,
- 10 (CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, en el que cicloalquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, CO₂H, alquilocarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,
- (CH₂)_nCOOH,
- (CH₂)_nCOO-alquilo C₁₋₆,
- 15 (CH₂)_nCONR⁶R⁷, en el que R⁶ y R⁷ se seleccionan independientemente del grupo que consta de hidrógeno, tetrazolilo, tiazolilo, (CH₂)_n-fenilo, (CH₂)_n-cicloalquil-C₃₋₆, y alquilo C₁₋₆, en los que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno e hidroxí y en los que fenilo y cicloalquilo no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí,
- 20 alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en el que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos;
- o en los que R⁶ y R⁷ conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están anclados forman un anillo heterocíclico seleccionado de azetidina, pirrolidina, piperidina, piperazina, y morfolina en las que dicho anillo heterocíclico no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos; y
- 25 en los que cualquier átomo de carbono de metileno (CH₂) en R² no está sustituido o está sustituido con de uno a dos grupos seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, y alquilo C₁₋₄ no sustituido o sustituido con de uno a cinco halógenos;
- 30 cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consta de halógeno,
- 35

217
227

ciano,

oxo,

hidroxi,

alquilo C₁₋₆, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco

5 halógenos,

alcoxi C₁₋₆, en el que alcoxi no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco

halógenos,

(CH₂)_n-NR⁶R⁷,

(CH₂)_n-CONR⁶R⁷,

10 (CH₂)_n-OCONR⁶R⁷,

(CH₂)_n-SO₂NR⁶R⁷,

(CH₂)_n-SO₂R⁹,

(CH₂)_n-NR⁸SO₂R⁹,

(CH₂)_n-NR⁸CONR⁶R⁷,

15 (CH₂)_n-NR⁸COR⁸,

(CH₂)_n-NR⁸CO₂R⁹,

(CH₂)_n-COOH,

(CH₂)_n-COO-alquilo C₁₋₆,

(CH₂)_n-arilo, en el que arilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco

20 sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, hidroxi, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

(CH₂)_n-heteroarilo, en el que heteroarilo no está sustituido o está sustituido con de uno a

25 tres sustituyentes seleccionados independientemente de hidroxi, halógeno, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

(CH₂)_n-heterociclilo, en el que heterociclilo no está sustituido o está sustituido con de

30 uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de oxo, hidroxi, halógeno, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

(CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, en el que cicloalquilo no está sustituido o está sustituido con

35 de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno,

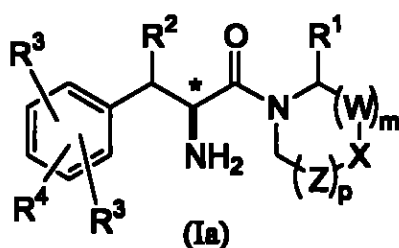
218
100

hidroxi, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están
sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,
en los que cualquier átomo de carbono de metileno (CH₂) en R⁵ no está sustituido o está
sustituido con de uno a dos grupos seleccionados independientemente de halógeno,
5 hidroxi, y alquilo C₁₋₄ no sustituido o sustituido con de uno a cinco halógenos;

10 cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consta de tetrazolilo, tiazolilo, (CH₂)_n-
fenilo, (CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, y alquilo C₁₋₆, en los que alquilo no está sustituido o está
sustituido con de uno a cinco halógenos y en los que fenilo y cicloalquilo no están sustituidos o
están sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de
halógeno, hidroxi, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o
están sustituidos con de uno a cinco halógenos, y en el que cualquier átomo de carbono de
metileno (CH₂) en R⁸ no está sustituido o está sustituido con de uno a dos grupos seleccionados
independientemente de halógeno, hidroxi, y alquilo C₁₋₄ insustituido o sustituido con de uno a
15 cinco halógenos; y

cada R⁸ es hidrógeno o R⁹.

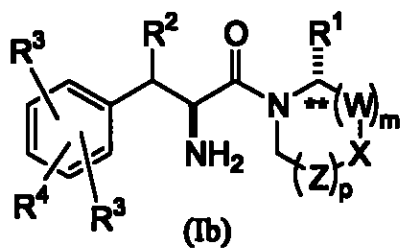
20 2. El compuesto de la reivindicación 1 en el que los átomos de carbono
marcados con un * tienen la configuración estereoquímica como se representa en la fórmula Ia:



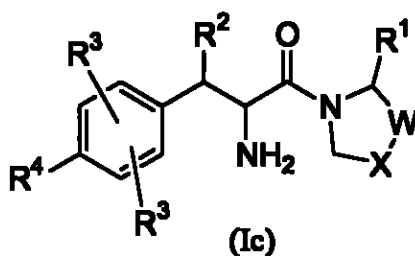
y R³ es hidrógeno o flúor.

25 3. El compuesto de la reivindicación 2 en el que el átomo de carbono
anclado a R¹ marcado con un ** tiene la configuración estereoquímica como se describe en la
fórmula Ib:

219
229



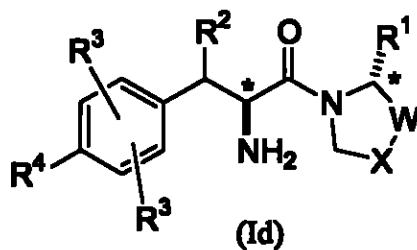
4. El compuesto de la reivindicación 1 de la fórmula estructural Ic:



en el que R³ es hidrógeno o flúor.

5

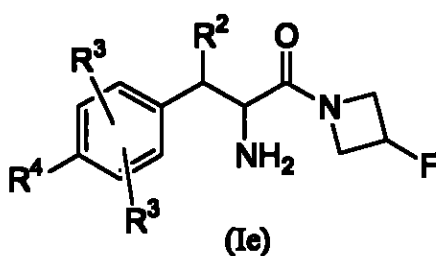
5. El compuesto de la reivindicación 4 en el que los átomos de carbono marcados con un * tienen la configuración estereoquímica como se representa en la fórmula estructural Id:



10

6. El compuesto de la reivindicación 5 en el que R¹ es hidrógeno, W es CH₂, y X es CH₂, CHF o CF₂.

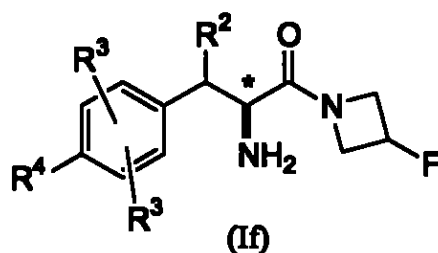
7. El compuesto de la reivindicación 1 de la fórmula estructural Ic:



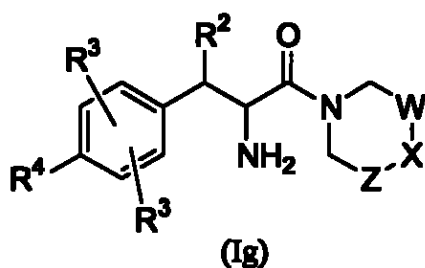
228
230

en el que R^3 es hidrógeno o flúor.

8. El compuesto de la reivindicación 7 en el que el átomo de carbono marcado con un * tiene la configuración estereoquímica como se representa en la fórmula estructural If:

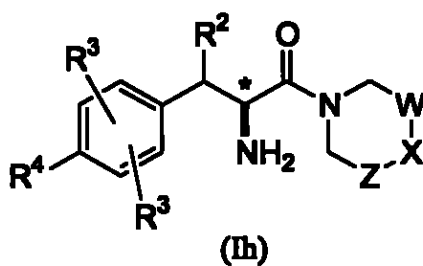


9. El compuesto de la reivindicación 1 de la fórmula estructural Ig:



en el que R^3 es hidrógeno o flúor.

10. El compuesto de la reivindicación 9 en el que el átomo de carbono marcado con un * tiene la configuración estereoquímica que se describe en la fórmula estructural Ih:



11. El compuesto de la reivindicación 10 en el que W y Z son CH_2 y X es CH_2 , CHF o CF_2 .

221
231

12. El compuesto de la reivindicación 1 en el que R² se selecciona del grupo que consta de

alquilo C₁₋₆, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno o hidroxí,

alqueno C₂₋₆, en el que alqueno no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno o hidroxí,

(CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, en el que cicloalquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

(CH₂)_nCOOH,

(CH₂)_nCOO-alquilo C₁₋₆,

(CH₂)_nCONR⁶R⁷, en el que R⁶ y R⁷ se seleccionan independientemente del grupo que consta de hidrógeno, tetrazolilo, tiazolilo, (CH₂)_n-fenilo, (CH₂)_n-cicloalquil C₃₋₆, y alquilo C₁₋₆, en los que el alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno e hidroxí y en los que fenilo y cicloalquilo no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos;

o en el que R⁶ y R⁷ conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están anclados forman un anillo heterocíclico seleccionado de azetidina, pirrolidina, piperidina, piperazina, y morfolina en las que dicho anillo heterocíclico no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en el que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos; y

en el que cualquier átomo de carbono de metileno (CH₂) en R² no está sustituido o está sustituido con de uno a dos grupos independientemente seleccionados de halógeno, hidroxí, y alquilo C₁₋₄ no están sustituido o están sustituido con de uno a cinco halógenos.

13. El compuesto de la reivindicación 12 en el que R² se selecciona del grupo que consta de

297
232

alquilo C₁₋₃, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco
sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno o hidroxí,

CH₂-cicloalquilo C₃₋₆,

COOH,

5 COO-alquil C₁₋₆,

CONR⁶R⁷, en el que R⁶ y R⁷ se seleccionan independientemente del grupo que consta
de hidrógeno, tetrazolilo, tiazolilo, (CH₂)_n-fenilo, (CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, y

alquilo C₁₋₆, en los que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a

cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno e hidroxí y en

10 los que fenilo y cicloalquilo no están sustituidos o están sustituidos con de uno a
cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí,

alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆ alcoxi, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos
o están sustituidos con de uno a cinco halógenos;

o en el que R⁶ y R⁷ conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están

15 anclados forman un anillo heterocíclico seleccionado de acetidina, pirrolidina,

piperidina, piperazina, y morfolina en las que dicho anillo heterocíclico no está

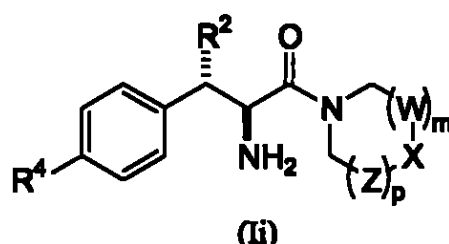
sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados

independientemente de halógeno, hidroxí, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que

alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco

20 halógenos.

14. El compuesto de la reivindicación 1 de la fórmula estructural li:



en los que X es CH₂, S, CHF, o CF₂;

25 W y Z son cada uno de ellos independientemente CH₂, CHF, o CF₂;

R⁴ es fenilo, heteroarilo, o heterociclilo, en los que fenilo, heteroarilo, y heterociclilo no están
sustituidos o están sustituidos con de uno a tres sustituyentes R⁵;

R² se selecciona del grupo que consta de:

metilo,

30 etilo,

228
233

- CH₂-ciclopropilo,
COOH,
COOMe,
COOEt,
5 CONHMe,
CONMe₂,
CONH₂,
CONHEt,
CONMeCH₂Ph,
10 pirrolidin-1-ilcarbonilo,
azetidin-1- ilcarbonilo,
3-fluoroazetidin-1- ilcarbonilo,
morfolin-4- ilcarbonil, y
[(tetrazol-5-il)amino]carbonilo; y
15 cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consta de:
halógeno,
ciano,
oxo,
20 hidroxil,
alquilo C₁₋₆, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco
halógenos,
alcoxi C₁₋₆, en el que alcoxi no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco
halógenos,
25 NR⁶R⁷,
CONR⁶R⁷,
OCONR⁶R⁷,
SO₂NR⁶R⁷,
SO₂R⁹,
30 NR⁸SO₂R⁹,
NR⁸CONR⁶R⁷,
NR⁸COR⁸,
NR⁸CO₂R⁹,
COOH,
35 COO-alquil C₁₋₆,

229
234

arilo, en el que arilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

5 heteroarilo, en el que heteroarilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de hidroxí, halógeno, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos,

10 heterociclilo, en el que heterociclilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de oxo, hidroxí, halógeno, CO₂H, alquiloxicarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos, y

15 (CH₂)_n-cicloalquilo C₃₋₆, en el que cicloalquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, hidroxí, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos.

15. El compuesto de la reivindicación 14 en el que cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consta de:

20 halógeno,
ciano,
oxo,
alquilo C₁₋₆, en el que alquilo no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco halógenos,

25 alcoxi C₁₋₆, en el que alcoxi no está sustituido o está sustituido con de uno a cinco halógenos,

30 CONR⁶R⁷,
NR⁸COR⁸,
SO₂R⁹,
NR⁸SO₂R⁹,

COOH,
COO-alquil C₁₋₆,

heteroarilo, en el que heteroaril no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de hidroxí, halógeno, CO₂H,

alquiloxycarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en el que alquilo y alcoxi no están sustituidos o están sustituidos con de uno a cinco halógenos, y heterociclilo, en el que heterociclilo no está sustituido o está sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de oxo, hidroxí, halógeno, CO₂H, alquiloxycarbonilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆, en los que alquilo y alcoxi están insustituidos o sustituidos con de uno a cinco halógenos.

16. El compuesto de la reivindicación 14 en el que R⁴ se selecciona del grupo que consta de:

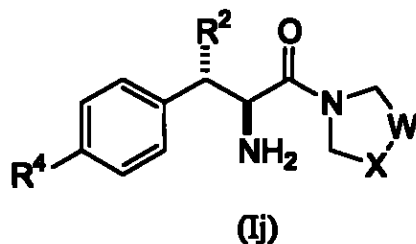
- 10 4-fluorofenilo,
- 2,4-difluorofenilo,
- 3,4-difluorofenilo,
- 2-clorofenilo,
- 2-fluorofenilo,
- 15 3-(metilsulfonil)fenilo,
- 3-(etoxycarbonil)fenilo,
- 3-carboxifenilo,
- 3-(aminocarbonil)fenilo,
- 3-[(*tert*-butilamino)carbonil]fenilo,
- 20 3-[(fenilamino)carbonil]fenilo,
- 3-[(tiazol-2-ilamino)carbonil]fenilo,
- 3-[(tetrazol-5-ilamino)carbonil]fenilo,
- 3-[[trifluorometil)sulfonil]amino]fenilo,
- 3-(tetrazol-5-il)fenilo,
- 25 4-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenilo,
- 2-fluoro-5-(tetrazol-5-il)fenilo,
- 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo,
- 4-fluoro-3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo,
- 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenilo,
- 30 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
- 3-(1,3,4-oxadiazol-2-il)fenilo
- 3-(1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
- 3-[5-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-3-il]fenilo,
- 3-(5-etoxi-1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
- 35 piridin-3-ilo,

228
236

- 6-fluoro-piridin-3-ilo,
6-metoxipiridin-3-ilo,
6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
5 1-etil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
5-bromo-1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3- ilo,
imidazo[1,2-*a*]piridin-6- ilo,
[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6- ilo,
3-(trifluorometil)[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6- ilo,
10 3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6- ilo,
2-metil-3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6-ilo,
4-aminoquinazolin-6-ilo,
2-(acetilamino)imidazo[1,2-*a*]piridin-6-ilo,
3-aminoimidazo[1,2-*a*]piridin-6- ilo,
15 3-carboxipirazolo[1,5-*a*]piridin-5-ilo,
5-bromo-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3- ilo,
[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]piridin-6- ilo,
[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]piridin-7- ilo, y
pirazolo[1,5-*a*]pirimidin-5- ilo.

20

17. El compuesto de la reivindicación 14 de la fórmula estructural Ij:



en el que R² se selecciona del grupo que consta de:

- metilo,
25 etilo,
CH₂-ciclopropilo,
COOH,
COOMe,
COOEt,
30 CONHMe,

i i

227
237

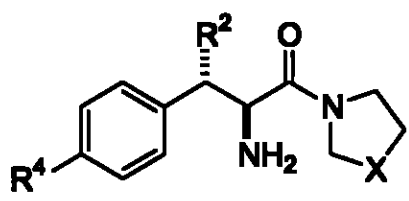
- CONMe₂,
CONH₂,
CONHEt,
CONMeCH₂Ph,
5 pirrolidin-1-ilcarbonilo,
 azetidin-1-ilcarbonilo,
 3-fluoroazetidin-1-ilcarbonilo,
 morfolin-4-ilcarbonilo, y
 [(tetrazol-5-il)amino]carbonilo; y
10 R⁴ se selecciona del grupo que consta de
 4-fluorofenilo,
 2,4-difluorofenilo,
 3,4-difluorofenilo,
15 2-clorofenilo,
 2-fluorofenilo,
 3-(metilsulfonil)fenilo,
 3-(etoxicarbonil)fenilo,
 3-carboxifenilo,
20 3-(aminocarbonil)fenilo,
 3-[(*tert*-butilamino)carbonil]fenilo,
 3-[(fenilamino)carbonil]fenilo,
 3-[(tiazol-2-ilamino)carbonil]fenilo,
 3-[(tetrazol-5-ilamino)carbonil]fenilo,
25 3-[(trifluorometil)sulfonil]amino]fenilo,
 3-(tetrazol-5-il)fenilo,
 4-fluoro-3-(tetrazol-5-il)fenilo,
 2-fluoro-5-(tetrazol-5-il)fenilo,
 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo,
30 4-fluoro-3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo,
 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,3,4-oxadiazol-2-il)fenilo,
 3-(5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
 3-(1,3,4-oxadiazol-2-il)fenilo,
 3-(1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
35 3-[5-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-3-il]fenilo,

228
230

- 3-(5-etoxi-1,2,4-triazol-3-il)fenilo,
piridin-3-ilo,
6-fluoro-piridin-3-ilo,
6-metoxipiridin-3-ilo,
5 6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
1-etil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
5-bromo-1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
imidazo[1,2-*a*]piridin-6-ilo,
10 [1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6-ilo,
3-(trifluorometil)[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6-ilo,
3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6-ilo,
2-metil-3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3-*a*]piridin-6-ilo,
4-aminoquinazolin-6-ilo,
15 2-(acetilamino)imidazo[1,2-*a*]piridin-6-ilo,
3-aminoimidazo[1,2-*a*]piridin-6-ilo,
3-carboxipirazolo[1,5-*a*]piridin-5-il,
5-bromo-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo,
[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]piridin-6-ilo,
20 [1,2,4]triazolo[1,5-*a*]piridin-7-ilo, y
pirazolo[1,5-*a*]pirimidin-5-ilo.

18. El compuesto de la reivindicación 17 en el que W es CH₂ y X es CHF o CF₂.

19. El compuesto de la reivindicación 17 de la fórmula estructural seleccionada del grupo que consta de:



<u>R⁴</u>	<u>R²</u>	<u>X</u>
fenilo	Me	(S)-CHF

229
239

4-(SO ₂ Me)-fenilo	Me	(S)-CHF
3-(SO ₂ Me)-fenilo	Me	(S)-CHF
pirazin-5-ilo	Me	(S)-CHF
3-cloropiridin-4-ilo	Me	(S)-CHF
2,4-difluorofenilo	Me	(S)-CHF
3,4-difluorofenilo	Me	(S)-CHF
2,5-difluorofenilo	Me	(S)-CHF
3,5-difluorofenilo	Me	(S)-CHF
3-(etoxicarbonil)fenilo	Me	(S)-CHF
4-(etoxicarbonil)fenilo	Me	(S)-CHF
3-(NH ₂ SO ₂ Me)-fenil	Me	(S)-CHF
4-(NH ₂ SO ₂ Me)-fenilo	Me	(S)-CHF
4-CO ₂ H-fenilo	Me	(S)-CHF
piridin-3-ilo	Me	(S)-CHF
6-OMe-piridin-3-ilo	Me	(S)-CHF
2-Cl-fenilo	Me	(S)-CHF
2-F-fenilo	Me	(S)-CHF
3-CN-fenilo	Me	(S)-CHF
piridin-4-ilo	Me	(S)-CHF
piridin-2-ilo	Me	(S)-CHF

220
240

2,4-difluorofenilo	Ciclopropil- metilo	(S)-CHF
3-(MeSO ₂)fenil	Ciclopropil- metil	(S)-CHF
4-fluoro-(3-tetrazol-5-il)fenilo	Me	(S)-CHF
3-(aminosulfonil)fenilo	Me	(S)-CHF
2-fluoro-(5-tetrazol-5-il)fenilo	Me	(S)-CHF
3-hidroxifenilo	Me	(S)-CHF
6-fluoropiridin-3-ilo	Me	(S)-CHF
3-(aminocarbonil)fenilo	Me	(S)-CHF
3-(fenilaminocarbonil)fenilo	Me	(S)-CHF
4-fluoro-3-(5-oxo-4,5-dihidro- 1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo	Me	(S)-CHF
3-[(tiazol-2- il)aminocarbonil]fenilo	Me	(S)-CHF
3-[(tetrazol-5- il)aminocarbonil]fenilo	Me	(S)-CHF
imidazo[1,2- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
2-metoxifenilo	Me	(S)-CHF
3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,3,4- oxadiazol-2-il)fenilo	Me	(S)-CHF
3-(5-etoxi-1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3- il)fenilo	Me	(S)-CHF

220
240

299
241

1-etil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	(S)-CHF
quinolin-6-ilo	Me	(S)-CHF
3-(2-oxo-2,3-dihidro-1 <i>H</i> -imidazol-4-il)fenilo	Me	(S)-CHF
2-metilfenilo	Me	(S)-CHF
2-(trifluorometil)fenilo	Me	(S)-CHF
3-[5-(trifluorometil)-4 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-il]fenilo	Me	(S)-CHF
4-oxo-3,4-dihidroquinazolin-6-ilo	Me	(S)-CHF
4-fluorofenilo	CONHEt	(S)-CHF
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Et	(S)-CHF
6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Et	(S)-CHF
3-(trifluorometil)[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
4-fluorofenilo	CONH ₂	(S)-CHF
3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	CF ₂
6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	CF ₂

112

235
242

4-aminoquinazolin-6-ilo	Me	(S)-CHF
5-bromo-1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	(S)-CHF
4-fluorofenilo	(pirrolidin-1-il)carbonilo	(S)-CHF
4-fluorofenilo	(azetidin-1-il)carbonilo	(S)-CHF
2-(acetilamino)imidazo[1,2- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
2-metil-3-oxo-2,3-dihidro[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
3-aminoimidazo[1,2- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
4-fluorofenilo	[(tetrazol-5-il)amino]carbonilo	(S)-CHF
4-fluorofenilo	CONHMe	(S)-CHF
4-fluorofenilo	CONEt ₂	(S)-CHF
4-fluorofenilo	COOMe	(S)-CHF
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(S)-CHF
4-fluorofenilo	COOH	CH ₂
4-fluorofenilo	COOH	CF ₂
4-fluorofenil	CONMe ₂	CH ₂

239
243

3-carboxipirazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-5-ilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	CH ₂
4-fluorofenilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
3-carboxifenil	Me	(<i>S</i>)-CHF
3-(tetrazol-5-il)fenilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
3-(5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)fenilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Ciclopropil-metilo	(<i>S</i>)-CHF
5-bromo-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
3-[(<i>terc</i> -butilamino)carbonil]fenilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
3-[[[(trifluorometil)sulfonil]amino]fenilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	(<i>S</i>)-CHF
4-fluorofenilo	COOH	(<i>S</i>)-CHF
4-fluorofenilo	CONMe ₂	(<i>S</i>)-CHF
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	CONMe ₂	(<i>S</i>)-CHF
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-7-ilo	CONMe ₂	(<i>S</i>)-CHF
pirazolo[1,5- <i>a</i>]pirimidin-5-ilo	CONMe ₂	(<i>S</i>)-CHF

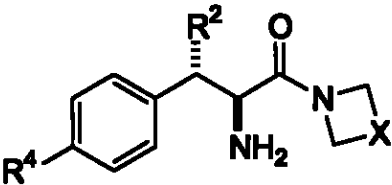
15

234
24

[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	CONMe ₂	CF ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-7-ilo	CONMe ₂	CF ₂
pirazolo[1,5- <i>a</i>]pirimidin-5-ilo	CONMe ₂	CF ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	CONMe ₂	CH ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	(3-fluoro-azetindin-1-il)carbonilo	CH ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	(pirrolidina-1-il)carbonilo	CF ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	CONMeCH ₂ Ph	CF ₂
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	(morfolin-1-il)carbonilo	CF ₂

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

20. El compuesto de la reivindicación 16 de la fórmula estructural
5 seleccionada del grupo que consta de:



<u>R⁴</u>	<u>R²</u>	<u>X</u>
4-fluorofenilo	Me	CHF
1-metil-6-oxo-1,6-	Me	CHF

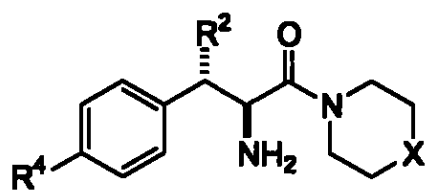
38

229
245

dihidropiridin-3-ilo		
[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	CHF
imidazo[1,2- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	CHF
4-fluorofenilo	COOH	CHF
4-fluorofenilo	CONMe ₂	CHF
[1,2,4]triazolo[1,5- <i>a</i>]piridin-6-ilo	CONMe ₂	CHF

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. El compuesto de la reivindicación 16 de la fórmula estructural
5 seleccionada del grupo que consta de:



<u>R⁴</u>	<u>R²</u>	<u>X</u>
4-fluorofenilo	Me	CHF
1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-ilo	Me	CHF
[1,2,4]triazolo[4,3- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	CHF
imidazo[1,2- <i>a</i>]piridin-6-ilo	Me	CHF

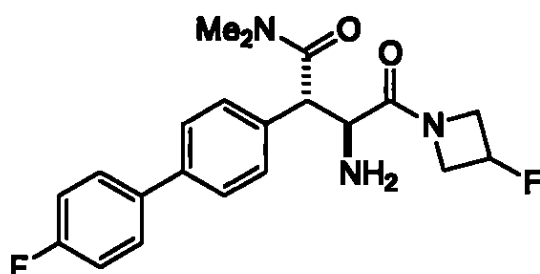
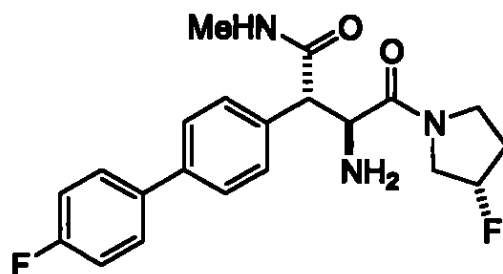
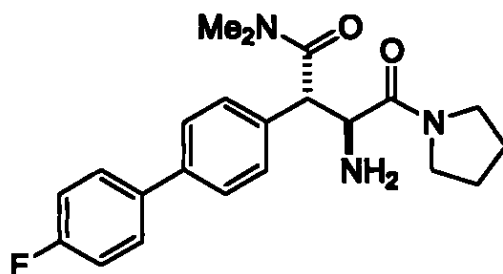
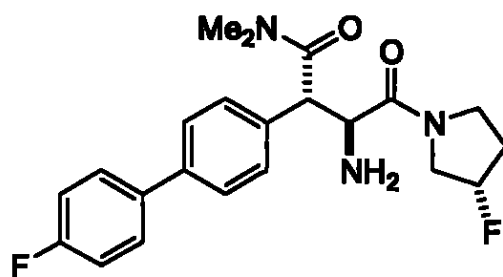
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

103

236
246

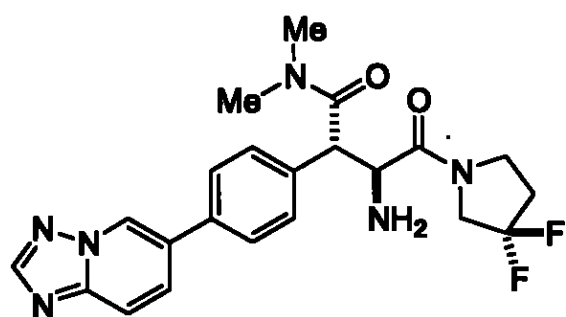
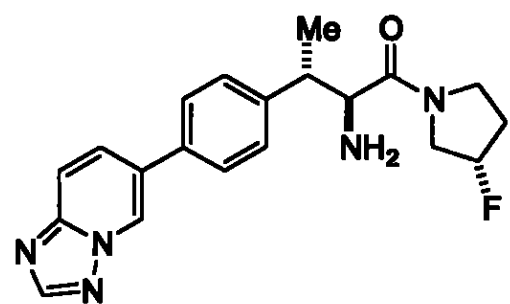
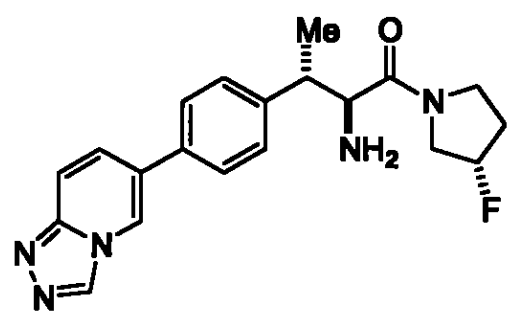
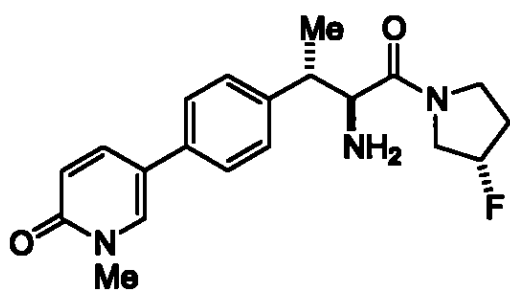
22. El compuesto de la reivindicación 16 seleccionado del grupo que consta

de



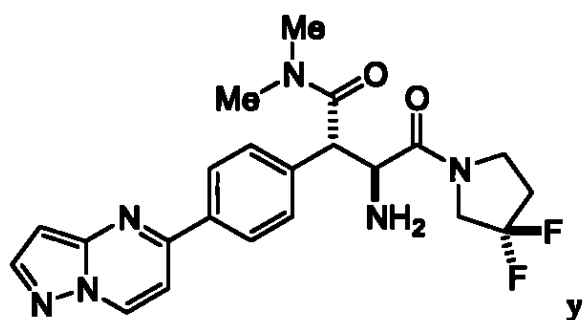
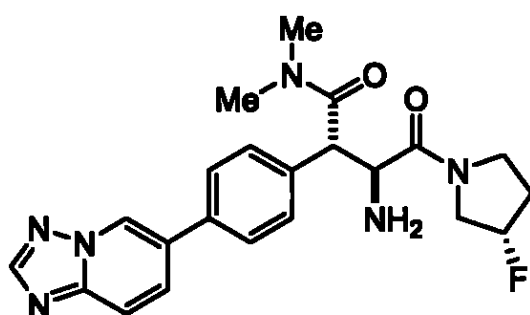
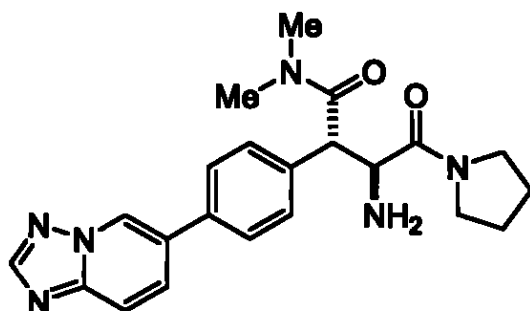
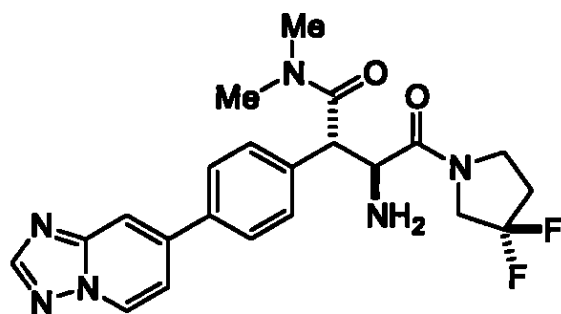
5

237
247

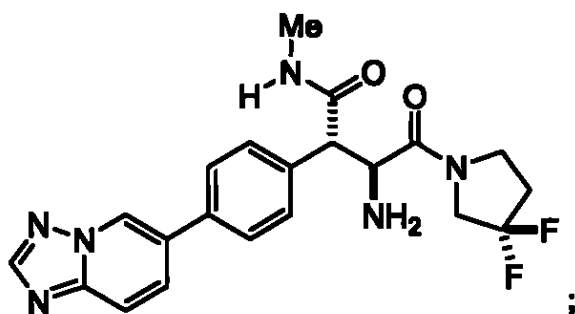


237
247

238
240

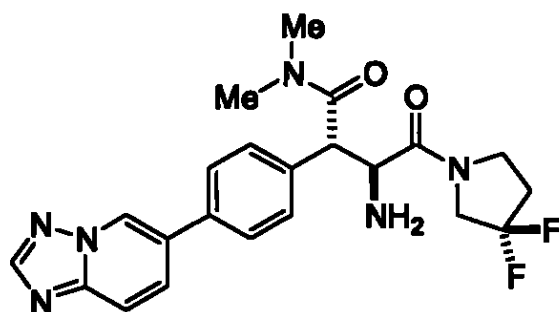


239
29
8X



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

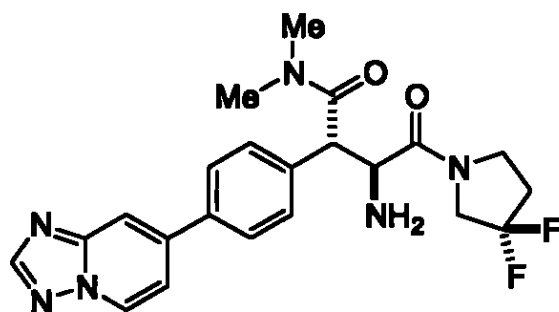
23. El compuesto de la reivindicación 22 el cual es



5

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

24. El compuesto de la reivindicación 22 el cual es

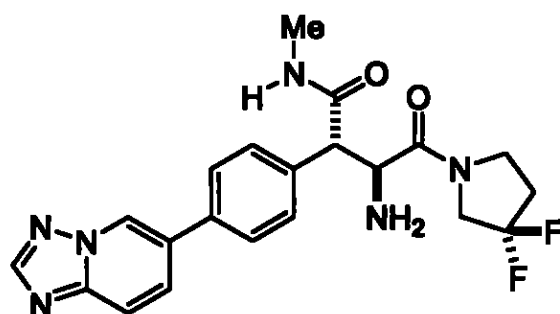


10 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

25. El compuesto de la reivindicación 22 el cual es

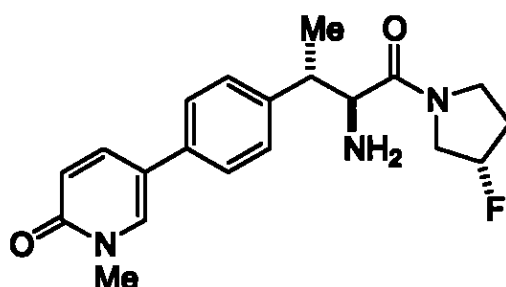
60

240
250



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

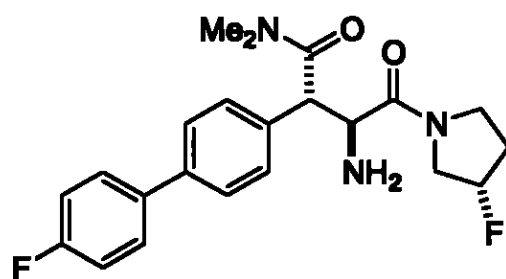
26. El compuesto de la reivindicación 22 el cual es



5

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

27. El compuesto de la reivindicación 22 el cual es



10 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

28. Una composición farmacéutica la cual comprende un compuesto de la reivindicación 1 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

15