

Señor Director
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-115817- -00006-0000

Fecha: 2013-10-22 16:49:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 449 RESPUESOPOSICI Folios: 39

Trámite : **011** Evento : **378** Actuación : **449**

Referencia : Expediente No. **12-115817**
Asunto : Solicitud de patente para la invención DERIVADOS DE
 PIRAZOL COMO INHIBIDORES DE JAK
Solicitante : ALMIRALL, S.A.
Opositor : LAFRANCOL S.A.

I. ALEGATOS CONTESTACIÓN OPOSICIÓN

Yo, Luz Clemencia de Páez, en mi condición de apoderada de la sociedad solicitante ALMIRALL, S.A., por el presente escrito doy respuesta a la oposición formulada a nombre de la sociedad LAFRANCOL S.A., contra la solicitud de patente para la invención denominada DERIVADOS DE PIRAZOL COMO INHIBIDORES DE JAK que se tramita en el expediente de la referencia.

II. CONTESTACIÓN DENTRO DEL TÉRMINO LEGAL

El Oficio N° 7444, que dispone el traslado de la oposición formulada fue notificado por fijación en lista el 30 de abril de 2013, por lo que el término de la prórroga solicitada mediante memorial radicado el 24 de julio de 2013 vence el 28 de octubre de 2013; de manera que la oposición está siendo contestada en término legal.

III. RESPUESTA A LA PETICIÓN

Me opongo a las peticiones de la sociedad LAFRANCOL S.A., y en consecuencia solicito se declare infundada la oposición presentada en su nombre y se otorgue el privilegio de la patente solicitada para la invención denominada DERIVADOS DE PIRAZOL COMO INHIBIDORES DE JAK a favor de la sociedad ALMIRALL, S.A. que se tramita en el expediente de la referencia.

IV. FUNDAMENTO FÁCTICO DE LA OPOSICIÓN

Fundamenta el opositor su petición, en los siguientes argumentos principales:

- 4.1. En primer lugar, llama la atención del Despacho sobre el hecho que las reivindicaciones 29 a 32 se refieren a usos, que constituyen materia no patentable conforme la legislación vigente.
- 4.2. En segundo lugar, señala que la presente solicitud de patente carece del requisito de NOVEDAD, de conformidad con las enseñanzas del documento WO 2010/0160085 del 11 de febrero de 2010.
- 4.3. Adicionalmente menciona que, en su opinión, "además de que el *compuesto de formula (I)* y sus dependientes 2 a 35 carecen de total novedad, *composiciones* como las de la reivindicación 36 y *combinaciones* de otros fármacos de diferentes entidades farmacológicas con el compuesto de fórmula (I) como las que se pretenden proteger en las reivindicaciones 37 y 38 ya habían sido

consideradas en el arte previo mencionado, por lo cual tampoco son nuevas.”

- 4.4. Por los anteriores hechos, se solicita al Despacho abstenerse de otorgar el privilegio de la patente solicitada.

V. MODIFICACIÓN

Presento con este memorial un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 27 reivindicaciones, el cual solicito sea tenido en cuenta al momento de ser efectuado el examen de patentabilidad de la invención solicitada por mi representada en el expediente de la referencia.

Para los efectos pertinentes, se acompaña el correspondiente formulario de modificación debidamente diligenciado, junto con el respectivo recibo de pago por el valor de la tasa fijada por la Resolución No. 173 del 11 de enero de 2013 por concepto de modificaciones.

VI. RESPUESTA A LOS HECHOS Y ALEGATOS

A continuación me permito presentar a consideración de este Despacho, las razones que demuestran la improcedencia de la pretensión de la sociedad LAFRANCOL S.A., por lo que la oposición formulada a su nombre deberá ser declarada infundada:

- 6.1. Reivindicaciones referentes a usos:

Sobre el particular me permito llamar respetuosamente la atención de este Despacho, acerca del hecho que en el nuevo capítulo reivindicatorio que se presenta a su consideración junto con este escrito, se han eliminado las referencias a usos y métodos de tratamiento.

Así, en este nuevo pliego de reivindicaciones la nueva reivindicación 1 corresponde a la combinación de las antiguas reivindicaciones 37, 38 y 39, por lo que:

- ✓ las definiciones de m, Z y los sustituyentes R1 a R9 corresponden a las definiciones de la antigua reivindicación 1;
- ✓ T representa un grupo –CR9; y
- ✓ X es un átomo de nitrógeno e Y un grupo –CR9 o bien X es un grupo –CR9 e Y un átomo de nitrógeno donde se ha especificado que en donde cuando R8 representa un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, dicho grupo heterocíclico está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico, y siempre que este sustituyente sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico sea distinto de un grupo terc-butoxicarbonilo.

Adicionalmente, teniendo en cuenta la modificación de la reivindicación 1, se eliminaron las reivindicaciones 2, 3, 4; de igual modo las reivindicaciones 29 a 36 y las reivindicaciones 42 y 43.

Las demás reivindicaciones se han reenumerado.

Por otro lado, de la reivindicación 25 (antigua reivindicación 28) se han excluido los compuestos 3-{6-[(Ciclohexilmetil)amino]piridin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo (ejemplo 9); 3-{6-[(2,2-Dimetilpropil)amino]piridin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo (ejemplo 10); 3-{6-[(3-Fluorobencil)amino]piridin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo (ejemplo 11); 3-[6-(Bencilamino)piridin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo (ejemplo 12); y 3-(6-{[(1S)-1-Feniletil]amino}piridin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo (ejemplo 13).

Por lo tanto, se demuestra así que las pretensiones de la sociedad opositora en este punto no tienen vocación de prosperar.

6.2. Examen de novedad de la invención solicitada, teniendo en cuenta las enseñanzas del documento WO 2010/0160085:

Al efectuar el correspondiente análisis comparativo entre la invención solicitada por mi representada y el documento citado por la sociedad opositora, que se denominará en adelante como D1, este Despacho podrá concluir fácilmente lo siguiente:

(i) El documento D1 describe derivados de 2-heterociclilamino pirazina como inhibidores CHK-1.

Los compuestos descritos de D1 presentan un anillo central heterocíclico del tipo pirazina en el cual el grupo en posición R8 es un grupo heterocíclico que contiene nitrógeno el cual no presenta una sustitución en el átomo de nitrógeno del anillo.

Por su parte, en la nueva reivindicación 1 de la invención solicitada por mi representada, (a) o bien Y representa un grupo $-\text{CR}_9$ y, por lo tanto, el anillo central no es un grupo pirazina, o (b) cuando Y representa un átomo de nitrógeno y R8 representa un grupo heterocíclico que contiene nitrógeno, este átomo de nitrógeno presenta un sustituyente diferente del grupo terc-butoxicarbonilo.

De acuerdo con lo anterior se tiene que es indudable que la nueva reivindicación 1 presenta novedad frente a D1.

(ii) Las reivindicaciones 2-25, dependientes de la reivindicación 1, también presentan novedad frente a D1.

(iii) La reivindicación 26 (composición farmacéutica), al reivindicar la combinación de un compuesto nuevo (compuesto según se ha definido en las reivindicaciones 1-25) con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable, también es nueva.

(iv) Finalmente, la reivindicación 27 (producto de combinación), al reivindicar la combinación de un compuesto nuevo (compuesto según se ha definido en las reivindicaciones 1-25) con otro ingrediente farmacéuticamente activo, también es nueva.

Por lo tanto, es evidente que tampoco las pretensiones del apoderado de la sociedad opositora en este punto tienen vocación de prosperar, toda vez que, como se ha demostrado, la patente solicitada por mi representada en el expediente de la referencia cumple con el supuesto exigido en el artículo 17 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, según el cual:

“Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica.”

6.3. Examen de novedad y nivel inventivo de las reivindicaciones 37 y 38 (que corresponden a las reivindicaciones 26 y 27 en el nuevo capítulo reivindicatorio), frente a las enseñanzas del documento WO 2010/0160085:

Finalmente, la sociedad opositora considera que las reivindicaciones 37 y 38 (nuevas reivindicaciones 26 y 27) no son nuevas e inventivas frente a WO 2010/016005 (D1).

Tal y como se ha mencionado anteriormente, D1 describe derivados de 2-heterociclílamino pirazina como inhibidores CHK-1. Los compuestos descritos de D1 presentan un anillo central heterocíclico del tipo pirazina en el cual el grupo en posición R8 es un grupo heterocíclico que contiene nitrógeno el cual no presenta una sustitución en el átomo de nitrógeno del anillo.

Así, partiendo de D1, el problema objetivo a resolver es obtener compuestos para su utilización como inhibidores de la quinasa JAK. Según la sociedad opositora esto sería obvio para el experto en la materia. Sin embargo, para llegar a los compuestos de la presente invención partiendo de los compuestos descritos en D1 habría que realizar diferentes cambios estructurales.

Estas modificaciones no serían obvias para el experto en la materia debido a que los compuestos descritos en D1 son inhibidores CHK-1.

Por el contrario, los compuestos de la presente invención son inhibidores pan-JAK, es decir, son simultáneamente potentes inhibidores JAK1, JAK2 y JAK3

(véase la página 8, líneas 33-35 del documento WO 2011/101161) Esta particularidad no ha sido descrita previamente en el estado de la técnica.

Es conocido para el experto en la materia que cada enzima presenta unos puntos de unión concretos. Una misma molécula o sustrato puede “encajar” en el lugar de unión de una enzima pero no necesariamente en el de otra enzima diferente. Si, además, se realizan cambios estructurales en el sustrato, resulta más inviable que el sustrato de una enzima pueda también ser el sustrato de otra enzima totalmente diferente.

Así las cosas se puede concluir sin ninguna duda, que la invención de mi representada presenta novedad y además nivel inventivo frente a D1.

VII. PETICIONES

Por los anteriores hechos, solicito respetuosamente a este Despacho proceder a:

- 7.1. Declarar infundada la oposición presentada a nombre de la sociedad LAFRANCOL S.A.
- 7.2. Proceder a efectuar el correspondiente examen de patentabilidad de la invención solicitada en este expediente, el cual fue solicitado mediante memorial radicado el 3 de abril de 2013.

VIII. PRUEBAS

Comedidamente solicito se tengan como pruebas en este asunto todos y cada uno de los documentos que obran en el expediente de la referencia, y adicionalmente los siguientes:

- 8.1. Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 27 reivindicaciones.
- 8.2. Formulario de modificación debidamente diligenciado.
- 8.3. Recibo de pago por valor el valor de la tasa fijada por la Resolución No. 173 del 11 de enero de 2013 por concepto de modificaciones.

IX. ANEXOS

Presento junto con este escrito los siguientes documentos:

- 9.1. Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 27 reivindicaciones.
- 9.2. Formulario de modificación debidamente diligenciado.
- 9.3. Recibo de pago por valor el valor de la tasa fijada por la Resolución No. 173 del 11 de enero de 2013 por concepto de modificaciones.

IX. NOTIFICACIONES

Mi representada y yo recibiremos notificaciones en la Secretaría de su Despacho o en mi oficina de abogado ubicada en la carrera 4ª N° 72 - 35 de esta ciudad de Bogotá, D.C.

Señor Director,

Luiz Clemencia de Páez
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

T.P.A. 23.555

C.C. 35.456.344

CO
COLO-17153-0841-026-6
COLO-17153-0264-014-0
SCT\SCT\ID-253789\WPC17153
No. M-2013-253789\SCT

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	Espacio reservado para el adhesivo de radicación
---	--

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

☐ Error material ☒ Modificación a una Solicitud en trámite

☒ Patente de Invención

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☐ Registro de Diseño Industrial

☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

ALMIRALL, S.A.

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
España	Ronda del General Mitre 151, Barcelona, España	Barcelona
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre Documento de identificación Tarjeta profesional
De Páez Luz Clemencia C.C. 35.456.344 T.P.A. 23.555

Dirección y domicilio	Ciudad	
Carrera 4ª No. 72 –35	Bogotá	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
cavelier@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

4. Datos del trámite

Corrección:

Expediente No 12.115.817

Aparece

Debe ser

Modificación:



Modificación al capítulo reivindicatorio.

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 27 reivindicaciones y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas. Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.



Modificación al capítulo descriptivo.



Modificación al resumen.



Modificación a los dibujos.



Modificación al solicitante.

5. Anexos



Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación por \$125.000.



Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma

Nombre y apellidos

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

C.C. 35.456.344 DE Usaqué

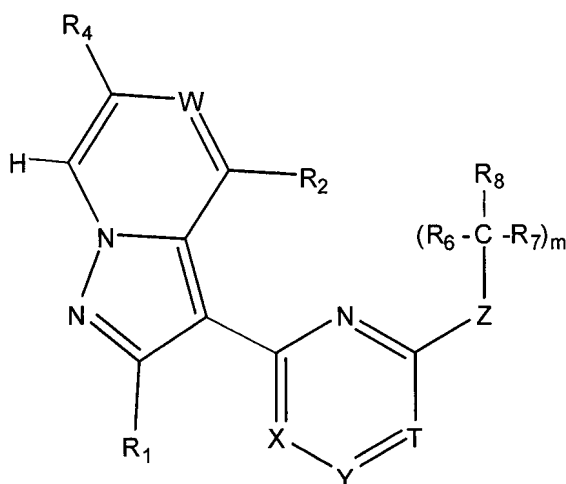
Firma

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

Tarjeta Profesional 23.555

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

1. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable, o solvato, o N-óxido, o estereoisómero o derivado deuterado del mismo:



Fórmula (I)

en donde

m es 0 o un número entero de 1 a 3;

Z representa un átomo de oxígeno o un grupo NR₅;

W representa un átomo de nitrógeno o un grupo -CR₃;

T representa un grupo -CR₉;

X representa un átomo de nitrógeno e Y representa un grupo -CR₉; o X representa un grupo -CR₉ e Y representa N, en donde cuando R₈ representa un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, dicho grupo heterocíclico está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico, y siempre que este sustituyente sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico sea distinto de un grupo terc-butoxicarbonilo;

R₁, R₂, R₃, R₄ y R₉, cada uno independientemente, representan un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo alquenilo C₂-C₄, un grupo alquinilo C₂-C₄, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, un grupo cicloalquenilo C₃-C₁₀, un grupo arilo C₅-C₁₄ monocíclico o policíclico, un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que

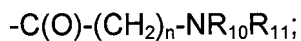
contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo bicíclico que contiene un grupo arilo o heteroarilo C_5-C_9 monocíclico directamente unido a un grupo cicloalquilo o heterocíclico de 5 a 9 miembros, conteniendo dicho grupo heteroarilo o heterocíclico al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo aza-bicicloalquilo que tiene hasta 12 átomos de carbono o un grupo aza-bicicloalquenilo que tiene hasta 12 átomos de carbono,

en donde los grupos alquenilo, alquinilo, haloalquilo, hidroxialquilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heteroarilo, heterocíclico, bicíclico, aza-bicicloalquilo y aza-bicicloalquenilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_a , y los grupos alquilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de R_b ;

o R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y R_9 independientemente representan un grupo $-SR_{13}$, un grupo $-SOR_{13}$, un grupo $-S(O)_2R_{13}$, un grupo $-S(O)_2NR_{13}R_{14}$, un grupo $-NR_{13}S(O)_2R_{14}$, un grupo $-NR_{13}S(O)_2NR_{14}$, un grupo $-(CH_2)_nOR_{13}$, un grupo $-C(O)OR_{13}$, un grupo $-O-C(O)R_{13}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R_{13}$, un grupo $-NR_{13}R_{14}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-NR_{13}R_{14}$, un grupo $-NR_{13}C(O)-(CH_2)_n-R_{14}$, o un grupo $-NR_{13}C(O)-(CH_2)_n-NR_{14}R_{15}$, en donde cada n es 0, 1 o 2;

o en el que caso en que dos grupos $-CR_9$ adyacentes están presentes, los dos grupos $-CR_9$ adyacentes y los átomos de carbono a los que están unidos forman opcionalmente un grupo arilo C_5-C_{12} o un grupo heteroarilo, cicloalquilo o heterocíclico de 4 a 12 miembros, donde dichos grupos heteroarilo y heterocíclico contienen al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, donde los grupos arilo, heteroarilo, cicloalquilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo arilo monocíclico o policíclico C_5-C_{14} , un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, o un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, en donde los sustituyentes alquilo, arilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

R_5 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} , un grupo fenilo o un anillo heterocíclico saturado de 6 miembros que contiene N, o R_5 representa un grupo $-S(O)_2R_{10}$, un grupo $-S(O)_2NR_{10}R_{11}$, un grupo $-C(O)OR_{10}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R_{10}$ o un grupo



R_6 y R_7 , cada uno independientemente, representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo alcóxicarbonilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo o un anillo heterocíclico saturado de 6 miembros que contiene N;

R_8 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo alqueno C_2-C_4 , un grupo alquino C_2-C_4 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} , un grupo cicloalqueno C_3-C_{10} , un grupo arilo monocíclico o policíclico C_5-C_{14} , un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo bicíclico que contiene un grupo arilo o heteroarilo monocíclico C_5-C_9 directamente unido a un grupo cicloalquilo o heterocíclico de 5 a 9 miembros, donde dicho grupo heteroarilo o heterocíclico contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo aza-bicicloalquilo que tiene hasta 12 átomos de carbono o un grupo aza-bicicloalqueno que tiene hasta 12 átomos de carbono,

en donde los grupos alqueno, alquino, haloalquilo, hidroxialquilo, cicloalquilo, cicloalqueno, arilo, heteroarilo, heterocíclico, bicíclico, aza-bicicloalquilo y aza-bicicloalqueno están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de R_a , grupos $-(\text{alquil } C_1-C_4)-CN$, o grupos $-(\text{alquil } C_1-C_4)-C(O)NR'R''$ en donde R' y R'' son iguales o diferentes y se seleccionan de átomos de hidrógeno y grupos alquilo lineales o ramificados C_1-C_4 ; y los grupos alquilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de R_b ;

o R_8 representa un grupo $-SR_{13}$, un grupo $-SOR_{13}$, un grupo $-S(O)_2R_{13}$, un grupo $-S(O)_2NR_{13}R_{14}$, un grupo $-NR_{13}S(O)_2R_{14}$, un grupo $-NR_{13}S(O)_2NR_{14}$, un grupo $-(CH_2)_nOR_{13}$, un grupo $-C(O)OR_{13}$, un grupo $-O-C(O)R_{13}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R_{13}$, un grupo $-NR_{13}R_{14}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-NR_{13}R_{14}$, un grupo $-NR_{13}C(O)-(CH_2)_n-R_{14}$, o un grupo $-NR_{13}C(O)-(CH_2)_n-NR_{14}R_{15}$, en donde cada n es 0, 1 o 2,

o R_8 junto con R_5 y el átomo de nitrógeno al que R_5 está unido forman un grupo heterocíclico saturado, de 4 a 10 miembros, que contiene, como heteroátomos, uno o dos átomos de nitrógeno y que está sustituido con un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo arilo monocíclico o policíclico C_5-C_{14} , un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo heterocíclico

de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, un grupo $-\text{SO}_2\text{R}_{10}$, un grupo $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{R}_{10}$, o un grupo $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$, en donde cada n es 0, 1 o 2,

en donde los grupos alquilo, arilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 lineal o ramificado o un grupo haloalquilo C_1-C_4 , y en donde los grupos alquilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

siempre que cuando m es cero, R_8 es distinto de un grupo $-\text{SR}_{13}$, un grupo $-\text{SOR}_{13}$, un grupo $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{13}$, un grupo $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{13}\text{R}_{14}$, un grupo $-\text{NR}_{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$, un grupo $-\text{NR}_{13}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}$, un grupo $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}_{13}$, un grupo $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_{13}$, un grupo $-\text{NR}_{13}\text{R}_{14}$, un grupo $-\text{NR}_{13}\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{R}_{14}$, o un grupo $-\text{NR}_{13}\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_{14}\text{R}_{15}$,

en donde

R_a es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 o un grupo cicloalqueno C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo arilo monocíclico o policíclico C_5-C_{14} no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo $-\text{SR}_{10}$, un grupo $-\text{SOR}_{10}$, un grupo $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$, un grupo $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$, un grupo $-\text{NR}_{10}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$, un grupo $-\text{NR}_{10}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{11}$, un grupo $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}_{10}$, un grupo $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$, un grupo $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_{10}$, un grupo $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{R}_{10}$, un grupo $-\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$, un grupo $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$, un grupo $-\text{NR}_{10}\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{R}_{11}$ o un grupo $-\text{NR}_{10}\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_{11}\text{R}_{12}$, en donde cada n es 0, 1 o 2;

R_b es un grupo ciano, un grupo haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 o un grupo cicloalqueno C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo arilo C_5-C_{14} monocíclico o policíclico no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e , un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N no sustituido o sustituido con

uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re, un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re, un grupo $-SR_{10}$, un grupo $-SOR_{10}$, un grupo $-S(O)_2R_{10}$, un grupo $-S(O)_2NR_{10}R_{11}$, un grupo $-NR_{10}S(O)_2R_{11}$, un grupo $-NR_{10}S(O)_2NR_{11}$, un grupo $-(CH_2)_nOR_{10}$, un grupo $-C(O)OR_{10}$, un grupo $-O-C(O)R_{10}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R_{10}$, un grupo $-NR_{10}R_{11}$, un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-NR_{10}R_{11}$, un grupo $-NR_{10}C(O)-(CH_2)_n-R_{11}$ o un grupo $-NR_{10}C(O)-(CH_2)_n-NR_{11}R_{12}$, en donde cada n es 0, 1 o 2;

R_{10} , R_{11} y R_{12} , cada uno independientemente, representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo alcóxicarbonilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, un grupo bicíclico que contiene un grupo arilo o heteroarilo monocíclico C_5-C_6 directamente unido a un grupo cicloalquilo o heterocíclico de 5 o 6 miembros, donde el grupo heteroarilo o heterocíclico contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno y donde los grupos haloalquilo, hidroxialquilo, alcóxicarbonilo, cicloalquilo, fenilo, heteroarilo, heterocíclico y bicíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Rc, y donde los grupos alquilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Rd;

Rc es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, o un grupo heterocicloalquil C_3-C_7 cetona que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, siendo dicho grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno, y donde dichos grupos heteroarilo, heterocíclico y heterocicloalquil cetona están no sustituidos o sustituidos con uno o más grupos alquilo lineales o ramificados C_1-C_3 ;

Rd es un grupo ciano, un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, o un grupo heterocicloalquil C_3-C_7 cetona que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno, y dichos

grupos heteroarilo, heterocíclico y heterocicloalquil cetona están no sustituidos o sustituidos con uno o más grupos alquilo lineales o ramificados C₁-C₃;

Re es un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆ o un grupo haloalquilo C₁-C₄;

R₁₃, R₁₄, y R₁₅, cada uno independientemente, representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄, un alcóxicarbonilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₇, un grupo arilo monocíclico o policíclico C₅-C₁₄, un grupo heteroarilo de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, o un grupo heterocíclico de 5 a 14 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado de O, S y N, en donde los grupos haloalquilo, hidroxialquilo, alcóxicarbonilo, cicloalquilo, arilo, donde los grupos heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Ra, y los grupos alquilo están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de Rb.

2. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde

R₁ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀ o un grupo -NR'R''; en donde R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄ o un grupo hidroxialquilo C₁-C₄;

R₂, R₃ y R₄ son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄, o un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀;

R₅ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxil, un grupo ciano, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄ o un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀;

R₆ y R₇ son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄ o un grupo hidroxialquilo C₁-C₄;

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 ;

R_8 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} , un grupo arilo C_6-C_{10} , un grupo heteroarilo de 5 a 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo $-L-Het-R''$, $-L-A$, $-A-SO_2-R'$, $-A-SO-R''$, $-A-A'$,

$-A-L-C(O)NR'R''$, $-A-L-CN$, $-A-C(O)-Het'-L-CN$, $-A-C(O)-NR'R''$, $-A-C(O)_Z-A''$,

$-A-C(O)-R'''$, $-A-CO_2-R'$, $-A-C(O)_Z-L-A'''$, $-A-C(O)_Z-L-R'''$, $-A-C(O)_Z-L-CN$, o

$-A-C(O)_Z-L-Het-R'$, en donde z es 1 o 2, R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , y R''' representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , donde los grupos heterocíclico y heteroarilo están opcionalmente condensados con un grupo fenilo, y en donde los grupos cicloalquilo, heterocíclico, arilo y heteroarilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , o un grupo alcoxi C_1-C_4 , y en donde

L es un grupo alquilenos lineal o ramificado C_1-C_6 ,

Het representa O o NR^{IV} , y Het' representa NR^{IV} , en donde R^{IV} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_4 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 ,

A , A' , A'' y A''' son iguales o diferentes y cada uno representa un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} , un grupo heterocíclico de 5 a 10 miembros, un grupo arilo C_6-C_{10} , o un grupo heteroarilo de 5 a 10 miembros, donde los grupos cicloalquilo, heterocíclico, arilo y heteroarilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , o un grupo alcoxi C_1-C_4 ,

o donde R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 o un grupo $-NR'R''$; en donde R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un

grupo haloalquilo C₁-C₄ o un grupo hidroxialquilo C₁-C₄ y R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, L, Het, A, A', A'' y A''' son como se han definido más arriba.

3. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R₈ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, un grupo arilo C₆-C₁₀, un grupo heteroarilo de 5 a 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo -L-Het-R''', -L-A, -A-A', -A-L-CN, -A-C(O)-R''', -A-C(O)_z-L-R''', -A-C(O)_z-L-CN, o -A-C(O)_z-L-Het-R', en donde z es 1 o 2 y R''' representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃, un grupo haloalquilo C₁-C₃ o un grupo hidroxialquilo C₁-C₃, y en donde los grupos cicloalquilo, heterocíclico, arilo y heteroarilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, o un grupo alcoxi C₁-C₄, y en donde

L es un grupo alquileo lineal o ramificado C₁-C₃,

Het representa O o NR^{IV}, en donde R^{IV} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₄, un grupo haloalquilo C₁-C₄, o un grupo hidroxialquilo C₁-C₄,

A y A' son iguales o diferentes y cada uno representa un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, un grupo heterocíclico de 5 a 10 miembros, un grupo arilo C₆-C₁₀, o un grupo heteroarilo de 5 a 10 miembros, donde los grupos cicloalquilo, heterocíclico, arilo y heteroarilo están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, o un grupo alcoxi C₁-C₄.

4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde Z es un grupo NR₅, en donde R₅ es como se ha definido en la reivindicación 1.

5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R₈ representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₇, un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o un

grupo $-(CH_2)_nOR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

en donde los grupos haloalquilo, cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de R_a ; y el grupo alquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de R_b ;

R_a es un átomo de halógeno; un grupo ciano; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo alcoxi C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 6 miembros, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1,

R_b es un grupo ciano; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo alcoxi C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 6 miembros, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes R_e ; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1;

R_e es un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

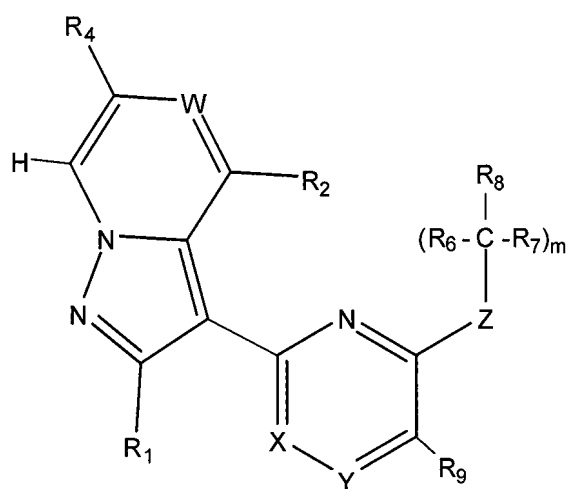
R' es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 5 a 6 miembros;

y

R" es -NH_2 , un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 5 a 6 miembros; en donde los grupos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ lineal o ramificado o un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$.

6. Un compuesto según la reivindicación 5, en donde R" es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 5 a 6 miembros; en donde los grupos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ lineal o ramificado o un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$.

7. Un compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I-c):



Fórmula (I-c)

en donde

m es 0 o un número entero de 1 a 3;

Z representa un átomo de oxígeno o un grupo NR_5 ;

W representa un átomo de nitrógeno o un grupo $-CR_3$;

X representa un átomo de nitrógeno e Y representa un grupo $-CR_9$; o X representa un grupo $-CR_9$ e Y representa N, en donde cuando R_8 representa un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, dicho grupo heterocíclico está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico, y siempre que este sustituyente sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico sea distinto de un grupo terc-butoxicarbonilo;

R_1 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} o un grupo $-NR'R''$; en donde R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 ;

R_2 , R_3 y R_4 son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , o un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} ;

R_5 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_{10} , un grupo fenilo, un grupo piridilo o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 6 miembros;

R_6 y R_7 son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 ;

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 o un grupo $-NR'R''$; en donde R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo hidroxialquilo C_1-C_4 ;

R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N,

O y S, o un grupo $-(CH_2)_nOR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

en donde los grupos haloalquilo, cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de Ra; y el grupo alquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de Rb;

Ra es un átomo de halógeno; un grupo ciano; un grupo hidroxil; un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo alcoxi C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 6 miembros, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1,

Rb es un grupo ciano; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo alcoxi C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 6 miembros, no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de los sustituyentes Re; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1;

Re es un átomo de halógeno, un grupo hidroxil, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ;

R' es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 5 a 6 miembros;
y

R'' es -NH_2 , un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S o un anillo heterocíclico que contiene N, saturado, de 5 a 6 miembros; en donde los grupos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ lineal o ramificado o un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$.

8. Un compuesto según la reivindicación 7, en donde en el compuesto de fórmula (I-c) Z representa un grupo NR_5 .

9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R_1 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$ o un grupo $\text{-NR}'\text{R}''$, en donde R' y R'' son iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, un grupo haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$; preferiblemente R_1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo -NH_2 ; más preferiblemente R_1 representa un átomo de hidrógeno.

10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R_2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$ o un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$; preferiblemente R_2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_3$; más preferiblemente R_2 representa un átomo de hidrógeno.

11. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R_3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$ o un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$; preferiblemente R_3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_3$; más preferiblemente R_3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo ciano.

12. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R_4 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$ o un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$; preferiblemente R_4

representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃; más preferiblemente R₄ representa un átomo de hidrógeno.

13. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R₅ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo hidroxialquilo C₁-C₄ o un grupo cicloalquilo C₃-C₇; preferiblemente R₅ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃; más preferiblemente R₅ representa un átomo de hidrógeno.

14. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R₆ y R₇ independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆; preferiblemente R₆ y R₇ independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃.

15. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 5 a 14, en donde R₈ representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄, un grupo cicloalquilo C₃-C₇, un grupo fenilo, un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o un grupo -(CH₂)_nOR en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆ o un grupo haloalquilo C₁-C₄; en donde los grupos haloalquilo, cicloalquilo, fenilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de Ra; y el grupo alquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de Rb;

Ra es un átomo de halógeno; un grupo ciano; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₄; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆ o un grupo haloalquilo C₁-C₄; un grupo -C(O)OR' o un grupo -C(O)-(CH₂)_n-R'', en donde n es 0 o 1,

Rb es un grupo ciano; un grupo haloalquilo C₁-C₄; un grupo alcoxi C₁-C₄; un cicloalquilo C₃-C₇ no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo fenilo no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados

de un átomo de halógeno, un grupo hidroxí, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1,

R' es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ; y

R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ,

o

en donde R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 , un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , un grupo fenilo, un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o un grupo $-(CH_2)_nOR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; en donde los grupos haloalquilo, cicloalquilo, fenilo y heterocíclico están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de R_a ; y el grupo alquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de R_b , en donde

R_b es como se ha definido más arriba; y

R_a es un átomo de halógeno; un grupo ciano; un grupo hidroxí; un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo heteroarilo monocíclico de 5 a 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo hidroxí, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo $-C(O)OR'$ o un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1,

R' es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ; y

R'' es $-NH_2$, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 .

16. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; preferiblemente R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 , o

en donde R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 o un grupo $-NH_2$; preferiblemente R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 o un grupo $-NH_2$.

17. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 16, en donde el compuesto es de fórmula (I-c) y

m es 0, 1 o 2;

W representa un átomo de nitrógeno o un grupo $-CR_3$, preferiblemente un grupo $-CR_3$;

Z representa un grupo $-NR_5$;

X representa un átomo de nitrógeno e Y representa un grupo $-CR_9$; o X representa un grupo $-CR_9$ e Y representa N , en donde cuando R_8 representa un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, dicho grupo heterocíclico está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico, y siempre que este sustituyente sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico sea distinto de un grupo terc-butoxicarbonilo;

R_1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo $-NH_2$;

R_2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_5 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_6 y R_7 independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ,

R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo $-(CH_2)_n-OR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ; un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; un grupo tetrahidropiraniilo, donde dicho grupo tetrahidropiraniilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

- un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;
- un átomo de halógeno;
- un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano;
- un grupo 1,2,4-triazolilo; y
- un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1 y R'' es $-NH_2$, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ; y

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 o un grupo $-NH_2$.

18. Un compuesto según la reivindicación 17, en donde R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo $-(CH_2)_n-OR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ; un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; un grupo tetrahidropiraniilo, donde dicho grupo tetrahidropiraniilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de átomos de halógeno y grupos hidroxilo; y un grupo piperidinilo, en donde dicho grupo piperidinilo está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos en el nitrógeno del anillo del grupo piperidinilo, donde dichos sustituyentes se seleccionan de

- un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;
- un átomo de halógeno;

- un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano;
- un grupo 1,2,4-triazolilo; y
- un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1 y R'' es $-NH_2$, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 .

19. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde en el compuesto de fórmula (I)

m es 0, 1 o 2;

W representa un átomo de nitrógeno o un grupo $-CR_3$, preferiblemente un grupo $-CR_3$;

Z representa un grupo $-NR_5$;

X representa un átomo de nitrógeno e Y representa un grupo $-CR_9$; o X representa un grupo $-CR_9$ e Y representa N, en donde cuando R_8 representa un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, dicho grupo heterocíclico está sustituido con uno o más sustituyentes, donde dicha sustitución está al menos sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico, y siempre que este sustituyente sobre el nitrógeno del anillo del grupo heterocíclico sea distinto de un grupo terc-butoxicarbonilo;

T representa un grupo $-CR_9$;

R_1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo $-NH_2$;

R_2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_5 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_6 y R_7 independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ,

R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , en donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos hidroxilo; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo $-(CH_2)_n-OR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

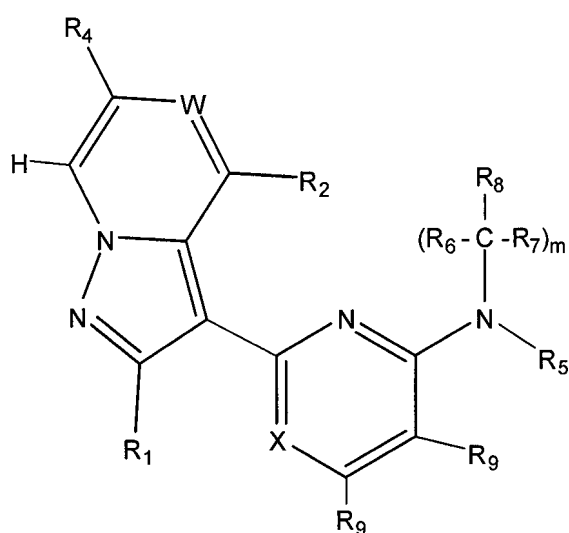
-un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano; y

-un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1 y R'' es $-NH_2$, un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ; y

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 .

20. Un compuesto según la reivindicación 19, en donde R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 .

21. Un compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I-a):



Fórmula (I-a)

en donde

m es 0, 1 o 2;

W representa un átomo de nitrógeno o un grupo $-CR_3$, preferiblemente un grupo $-CR_3$;

X representa un átomo de nitrógeno;

R_1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo $-NH_2$;

R_2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_5 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_6 y R_7 independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ,

R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , en donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos hidroxil; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo $-(CH_2)_n-OR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

-un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano; y

-un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1 y R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_4 o un grupo cicloalquilo C_3-C_7 ; y

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 .

22. Un compuesto según la reivindicación 21, donde:

m es 0 o 1;

R_1 representa un átomo de hidrógeno;

R_2 representa un átomo de hidrógeno;

R_3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo ciano;

R_4 representa un átomo de hidrógeno;

R_5 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ;

R_6 y R_7 independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ,

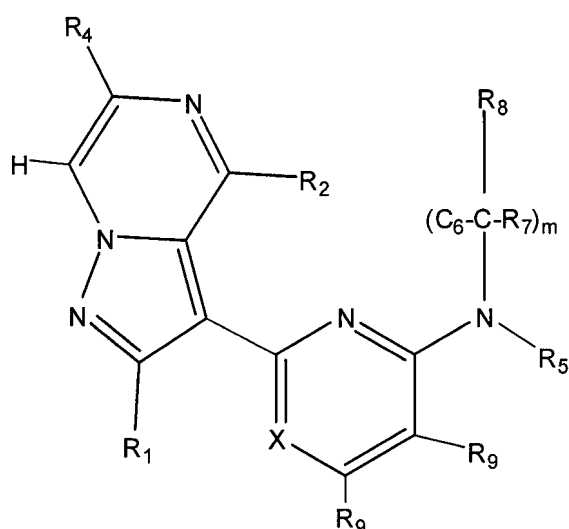
R_8 representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_6 ; un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; un grupo cicloalquilo C_3-C_7 , en donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos hidroxilo; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo $-(CH_2)_n-OR$ en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 ; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

-un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano; y

-un grupo $-C(O)-(CH_2)_n-R''$, en donde n es 0 o 1 y R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 , o un grupo haloalquilo C_1-C_4 ; y

R_9 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C_1-C_3 .

23. Un compuesto según la reivindicación 1, de fórmula (I-b):



Fórmula (I-b)

en donde

m es 0, 1 o 2;

X representa un átomo de nitrógeno;

R₁ representa un átomo de hidrógeno o un grupo -NH₂;

R₂ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃;

R₄ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃;

R₅ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃;

R₆ y R₇ independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃,

R₈ representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆; un grupo haloalquilo C₁-C₄; un grupo cicloalquilo C₃-C₇, en donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos hidroxil; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo -(CH₂)_n-OR en donde n es 0 o 1 y R representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

-un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano; y

-un grupo -C(O)-(CH₂)_n-R'', en donde n es 0 o 1 y R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₄ o un grupo cicloalquilo C₃-C₇; y

R₉ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃.

24. Un compuesto según la reivindicación 23, donde

m es 0 o 1;

X representa un átomo de nitrógeno;

R₁ representa un átomo de hidrógeno;

R₂ representa un átomo de hidrógeno;

R₄ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃;

R₅ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃;

R₆ y R₇ independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃,

R₈ representa un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₆; un grupo cicloalquilo C₃-C₇, en donde dicho grupo cicloalquilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos hidroxil; un grupo fenilo, donde dicho grupo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más átomos de halógeno; y un grupo piperidinilo, donde dicho grupo piperidinilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de

- un grupo piridilo, donde dicho grupo piridilo está no sustituido o sustituido con uno o más grupos ciano; y
- un grupo -C(O)-(CH₂)_n-R'', en donde n es 0 o 1 y R'' es un grupo ciano, un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃, o un grupo haloalquilo C₁-C₃; y

R₉ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo lineal o ramificado C₁-C₃.

25. Un compuesto según la reivindicación 1, que es uno de:

- 3-(4-([(1S)-1-Feniletil]amino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-{4-[(Ciclohexilmetil)amino]pirimidin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-[4-(Bencilamino)pirimidin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-{4-[(2,2-Dimetilpropil)amino]pirimidin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-(4-([(1S)-2-Metoxi-1-metiletil]amino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-{4-[(Ciclopropilmetil)amino]pirimidin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-{4-[(2,2,2-Trifluoroetil)amino]pirimidin-2-il}pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- N-(1-Feniletil)-2-pirazolo[1,5-a]piridin-3-ilpirimidin-4-amina;
- 3-(4-([(3R)-1-(Cianoacetil)piperidin-3-il]amino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-(4-([(3R)-1-Acetilpiperidin-3-il]amino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;
- 3-(4-([(3R)-1-(5-Cianopiridin-2-il)piperidin-3-il]amino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;

3-(4-[(3*R*)-1-(3,3,3-Trifluoropropanoil)piperidin-3-il]amino}pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-
a]piridina-5-carbonitrilo;

3-{4-[(3*R*)-1-(Cianoacetil)piperidin-3-il](metil)amino}pirimidin-2-il} pirazolo[1,5-a]piridina-5-
carbonitrilo;

3-(4-((*Trans*)-4-Hidroxiciclohexilamino)pirimidin-2-il)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carbonitrilo;

N-(Ciclohexilmetil)-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-amina;

(*S*)-*N*-(1-feniletil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidin-4-amina;

N-Bencil-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-amina;

N-(2,2-Dimetilpropil)-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-amina;

3-Oxo-3-[(3*R*)-3-[(2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-
il]propanonitrilo;

6-[(3*R*)-3-[(2-Pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-il] nicotinonitrilo;

2-Pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il-*N*-[(3*R*)-1-(3,3,3-trifluoropropanoil)piperidin-3-il]pirimidin-4-
amina;

3-[(3*R*)-3-[Metil(2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-il]-3-
oxopropanonitrilo;

3-[(3*R*)-3-[(5-Cloro-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-il]-3-
oxopropanonitrilo;

3-[(3*R*)-3-[(5-Fluoro-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-il]-3-
oxopropanonitrilo;

5-Fluoro-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il-*N*-[(3*R*)-1-(3,3,3-trifluoropropanoil) piperidin-3-
il]pirimidin-4-amina;

3-[(3*R*)-3-[(5-Metil-2-pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilpirimidin-4-il)amino]piperidin-1-il]-3-
oxopropanonitrilo;

(*S*)-*N*-(1-(5-fluoropiridin-2-il)etil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidin-4-amina;

N-((5-fluoropiridin-2-il)metil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidin-4-amina;

5-cloro-*N*-((5-fluoropiridin-2-il)metil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidin-4-amina;

*N*⁴-(4,4-difluorociclohexil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidina-4,5-diamina;

(*S*)-5-cloro-*N*-(1-(5-fluoropiridin-2-il)etil)-2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirimidina-4-amina;

2-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)-*N*⁴-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)pirimidina-4,5-diamina;

(*R*)-3-oxo-3-(3-(6-(pirazolo[1,5-a]pirazin-3-il)pirazin-2-ilamino)piperidin-1-il)propanonitrilo;

(*R*)-3-oxo-3-(3-(6-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirazin-2-ilamino)piperidin-1-il)propanonitrilo;

(*R*)-3-oxo-3-(3-(2-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirimidin-4-ilamino)piperidin-1-il)propanonitrilo;

3-(3-(5-fluoro-2-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirimidin-4-ilamino)piperidin-1-il)-3-
oxopropanonitrilo;

3-(3-(5-cloro-2-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirimidin-4-ilamino)piperidin-1-il)-3-
oxopropanonitrilo;

3-(4-fluoro-3-(6-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirazin-2-ilamino)piperidin-1-il)-3-
oxopropanonitrilo;

3-(4-metil-3-(6-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirazin-2-ilamino)piperidin-1-il)-3-oxopropanonitrilo;

N-(1-(4H-1,2,4-Triazol-3-il)piperidin-3-il)-6-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirazina-2-amina;

N-(1-(4H-1,2,4-Triazol-3-il)piperidin-3-il)-2-(pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)pirimidin-4-amina;

N-[(3R)-1-(Aminoacetil)piperidin-3-il]-6-pirazolo[1,5-a]piridin-3-ilpirazin-2-amina;

y sales farmacéuticamente aceptables, solvatos, N-óxidos o derivados deuterados de los mismos.

26. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 en asociación con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

27. Un producto de combinación, que comprende (i) un compuesto como se ha definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25; y (ii) otro compuesto seleccionado de:

- a) Inhibidores de dihidrofolato reductasa, tales como Metotrexato o CH-1504;
- b) Inhibidores de DHODH tales como leflunomida, teriflunomida, o los compuestos descritos en las solicitudes internacionales de patentes núms. WO2008/077639 y WO2009/021696;
- c) Inmunomoduladores tales como acetato de Glatiramer o Laquinimod;
- d) inhibidores de la síntesis y reparación del ADN, tales como Mitoxantrone o Cladribine;
- e) Anticuerpos anti-integrina alfa 4, tales como Natalizumab (Tysabri);
- f) antagonistas de integrina alfa 4 tales como R-1295, TBC-4746, CDP-323, ELND-002, Firategrast o TMC-2003;
- g) Corticoides y glucocorticoides tales como prednisona o metilprednisolona, fluticasona, mometasona, o beta-metasona;
- h) Ésteres de ácido fumárico, tales como BG-12;
- i) Anticuerpos anti-TNF alfa, tales como Infliximab, Adalimumab, o Certolizumab pegol;
- j) Receptores solubles de TNF alfa tales como etanercept;
- k) Anticuerpos monoclonales anti-CD20 tales como Rituximab, Ocrelizumab, Ofatumumab o TRU-015;
- l) Anti-CD52 tales como alemtuzumab;
- m) Anti-CD25 tales como daclizumab;
- n) Anti-CD88, tales como eculizumab o pexilizumab;
- o) Anti-IL12R /IL23R, tales como ustekinumab;

- p) Inhibidores de calcineurina tales como ciclosporina A o tacrolimus;
- q) Inhibidores de IMPDH, tales como micofenolato mofetil;
- r) Agonistas de los receptores de cannabinoides tales como Sativex;
- s) Antagonistas de quimioquinas CCR1 tales como MLN-3897 o PS-031291;
- t) Antagonistas de quimioquinas CCR2 tales como INCB-8696;
- u) Inhibidores de la activación de NF-kappaB tales como MLN-0415;
- v) Agonistas del receptor S1P tales como fingolimod, BAF-312, ACT128800, o los compuestos descritos en las solicitudes internacionales de patentes núms. PCT/EP2009/007348 y PCT/EP2009/008968;
- w) Inhibidores de S1P liasa tales como LX2931;
- x) Inhibidores de Syk, tales como R-112;
- y) Inhibidores de PKC, tales como NVP-AEB071;
- z) Antagonistas de M3 tales como tiotropio o aclidinio;
- aa) Agonistas beta-adrenérgicos de acción prolongada tales como formoterol;
- bb) Derivados de la vitamina D, como el calcipotriol (Daivonex);
- cc) Inhibidores de fosfodiesterasa IV tales como roflumilast o GRC-4039;
- dd) Inhibidores de p38 tales como ARRY-797;
- ee) Inhibidores de MEK, tales como ARRY-142886 o ARRY-438162;
- ff) Inhibidores de PI3K $\delta\gamma$;
- gg) Interferones que comprenden Interferón beta 1a tal como Avonex de Biogen Idec, CinnoVex de CinnaGen y Rebif de EMD Serono, e Interferón beta 1b tal como Betaferon de Schering y Betaseron de Berlex; y
- hh) Interferón alfa tal como Sumiferon MP.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 103733

Bogotá D.C., Octubre 15 de 2013 - 13:23:15

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	650540671	15/10/2013	13.950.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION	125.000.00	125.000.00
				\$125.000.00

SON: **CIENTO VEINTICINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable:

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-115817- -00006-0000

Fecha: 2013-10-22 16:49:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 449 RESPUESOPOSICI Folios: 39

0010:17153-264-014-0

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Octubre 15 de 2013 - 13:23:20