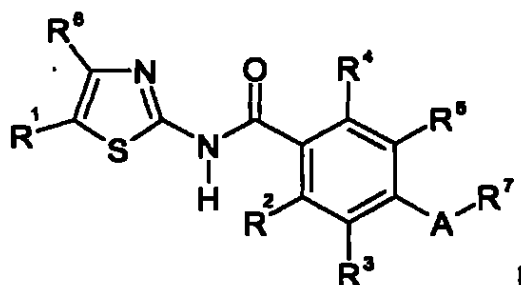


FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: H. LUNDBECK A/S sociedad constituida y existente bajo las leyes de Dinamarca. Dirección: Ottiliavej 9, 2500 Copenhagen, Dinamarca Domicilio: Copenhagen, Dinamarca Lugar de Constitución: Dinamarca Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@camyp.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 38 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: <u>438.019</u> TP <u>31.929</u>
4	Número de expediente: <u>06.039.105</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: <u>Junto con el presente escrito presento el nuevo pliego reivindicatorio</u> <u>que debe ser estudiado por su Despacho al momento de realizar el</u> <u>Examen de Patentabilidad. El nuevo pliego reivindicatorio consta</u> <u>de 50 reivindicaciones.</u>	
6	Comprobante de pago No. <u>07-32,671</u> Fecha: <u>23 de abril de 2007</u>	
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$99.000.00 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA: 	
C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929		
FBH		

REIVINDICACIONES

1. El uso de un compuesto de fórmula I



en donde R¹ y R⁶ son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o halógeno;

R²-R⁵ se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, OH, NH₂, nitro, alquilo C₁₋₆, arilo, aril-alquilo-C₁₋₆, heteroaril-alquilo-C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquil-C₃₋₆-alquilo-C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, aril-alcoxi C₁₋₆, alquilamino C₁₋₆ y aril-alquilamino C₁₋₆ en donde cada alquilo, alcoxi o arilo puede ser opcionalmente sustituido con uno o más halógenos, ciano, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, o alcoxi C₁₋₆-alcoxi C₁₋₆;

o R⁴ y R⁵ juntos son X-(CH₂)_n-Y, en donde X y Y se selecciona independientemente del grupo que consiste de CH₂, y NH y O, n es 1,2 o 3, y R² y R³ son como se definió anteriormente;

A es *NR⁸-CO, *CO-NR⁸, *NR⁸-CS o *CS-NR⁸ en el que R⁸ y R⁹ se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo C₁₋₆, o R⁸ junto con R³ son alquileno C₂₋₃ o CH₂CH₂O en donde el oxígeno está unido al anillo de fenilo, y el * indica el átomo que está unido al anillo fenilo;

y R^7 se selecciona del grupo que consiste de alquilo C_{1-6} , arilo, heteroarilo, aril-alquilo- C_{1-6} , heteroaril-alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquil- C_{3-6} -alquilo- C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , aril-alcoxi C_{1-6} , heteroaril-alcoxi C_{1-6} , alquilamino C_{1-6} , aril-alquilamino C_{1-6} , heteroaril-alquilamino C_{1-6} , di-(alquil C_{1-6})-amino, 2,3-dihidrobenczo[1,4]dioxin-2-ilo o adamantan-1-il-metilo en donde cada alquilo y cicloalquilo puede ser opcionalmente sustituido con uno o más halógenos, ciano, hidroxilo, oxo, alcoxi C_{1-6} o $NR^{10}R^{11}$, en donde R^{10} y R^{11} son independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-6} , o R^{10} y R^{11} junto con el nitrógeno forman un anillo alifático de 5, 6 o 7 miembros que opcionalmente puede contener un heteroátomo adicional seleccionado de N y O, y cada arilo puede ser opcionalmente sustituido con uno o más halógeno, ciano, hidroxilo, nitro, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , acilo C_{1-6} , aciloxi C_{1-6} , $NR^{10}R^{11}$ en donde R^{10} y R^{11} son independientemente hidrógeno o alquilo C_{1-6} o R^{10} y R^{11} junto con el nitrógeno forman un anillo alifático de 5, 6 o 7 miembros que opcionalmente puede contener un heteroátomo adicional seleccionado de N y O, o un grupo $Z-(CH_2)_m-W$, en donde Z y W se unen a dos átomos de carbono adyacentes y se seleccionan independientemente del grupo que consiste de CH_2 , NH y O, y m es 1, 2 o 3, dado que cuando R^7 se une al nitrógeno, entonces R^7 no es alcoxi C_{1-6} , aril-alcoxi C_{1-6} , heteroaril-alcoxi C_{1-6} , alquil- C_{1-6} -amino, aril-alquilamino- C_{1-6} , heteroaril-alquilamino- C_{1-6} o di-(alquil- C_{1-6})-amino;

y sales de adición farmacéuticamente aceptable de estos;

para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad en donde está implicado un receptor A_{2A} .

2. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde la enfermedad se selecciona del grupo que consiste de Enfermedad de Parkinson,

Enfermedad de Alzheimer, Enfermedad de Huntington, epilepsia, isquemia cerebral, apoplejía hemorrágica, isquemia neonatal e hipoxia, hemorragia subarahnóidea, daño cerebral traumático, daño cerebral seguido por paro cardíaco, y para el tratamiento de trastornos de depresión y psicosis.

5

3. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde la enfermedad es enfermedad de Parkinson.

4. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 1-3, en donde A es $^*NR^8-CO$ o $^*CO-NR^9$.

10

5. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde A es $^*NR^8-CO$.

15

6. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 1-5, en donde R^7 se selecciona del grupo que consiste de alquilo C_{1-8} , cicloalquil- C_{3-8} -metilo, cicloalquilo C_{3-8} , metilfenilo, metoxibencilo y tiofen-2-il-metilo, en donde cada alquilo o cicloalquilo puede ser no sustituido o sustituido con oxo.

20

7. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, en donde R^7 es alquilo C_{3-8} .

8. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, en donde R^7 es alquilo C_{4-8} que es ramificado en la posición β .

25

9. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 1-8, en donde R^8 es hidrógeno.

18. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, en donde alcoxí C₁₋₆-alcoxí C₁₋₆ es 2-metoxi-etoxi.

19. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 14-18, en donde R³ y R⁵ se seleccionan del grupo que consiste el grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁₋₆, alcoxí C₁₋₆, alcoxí C₁₋₆-alcoxí C₁₋₆, trifluorometilo y trifluorometoxi.

20. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 19, en donde alquilo C₁₋₆ es metilo.

21. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 19 o 20, en donde alcoxí C₁₋₆ es metoxi.

22. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 19-21, en donde alcoxí C₁₋₆-alcoxí C₁₋₆ es 2-metoxi-etoxi.

23. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 19, en donde alquilo C₁₋₆ es metilo, alcoxí C₁₋₆ es metoxi y alcoxí C₁₋₆-alcoxí C₁₋₆ es 2-metoxi-etoxi.

24. El uso de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto se selecciona del grupo que consiste de:

4-Butirilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-metoxi-4-(3-metil-4-oxo-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-4-(3-metil-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- 4-hexanoilamino-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(2-cicloheptil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-metoxi-4-(3-metil-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(2-cicloheptil-acetilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
5 *rac*-4-[2-(2-oxo-ciclopentil)-acetilamino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-hexanoilamino-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-metil-4-(4-fenil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(2-ciclohexil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-4-(2-biciclo[2.2.1]hept-2-il-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
10 4-(3,3-dimetil-butirilamino)-*N*-(4,5-dimetil-tiazol-2-yl)-benzamida,
4-(2-adamantan-1-il-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3-benzo[1,3]dioxol-5-il-propionilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3-idroxi-3-metil-butirilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(4-fluoro-benzoilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
15 4-benzoilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
ácido tiofeno-3-carboxílico [4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
N-tiazol-2-il-4-(2-*o*-tolil-acetilamino)-benzamida,
N-tiazol-2-il-4-(2-tiofen-3-il-acetilamino)-benzamida,
4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
20 4-(3,3-dimetil-butirilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3,3-dimetil-butirilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3,3-dimetil-butirilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-cloro-4-(3-metil-butirilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-bromo-4-(3,3-dimetil-butirilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
25 4-(3-metil-butirilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-bromo-4-(3-metil-butirilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(2-ciclopentil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- 3-metil-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-cloro-4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-cloro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-bromo-4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
5 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(ciclopentanocarbonil-amino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
ácido de cicloheptanocarboxílico [2-bromo-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
4-isobutilamino-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
ácido 8-(3,3-dimetil-butilamino)-2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxina-5-carboxílico tiazol-
10 2-ilamida,
3-bromo-4-butilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
2-metoxi-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
ácido cicloheptanocarboxílico [4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
rac-2-metoxi-4-(2-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
15 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-bromo-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-cloro-4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(2-ciclopentil-acetilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
20 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-(3-metil-butilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
3-fluoro-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-butilamino-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
4-butilamino-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
25 3-fluoro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
ácido cicloheptanocarboxílico de [2-fluoro-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
4-(ciclopentanocarbonil-amino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-fluoro-4-(3-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,
 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-2-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5 ácido 4-(2-metil-benzoil)-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina-7-carboxílico de tiazol-
 2-il-amida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5-cloro-4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 10 4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-(5-metil-tiazol-2-il)-benzamida,
 5-cloro-2-metoxi-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-(5-metil-tiazol-2-il)-benzamida,
 ácido 1-(3,3-dimetil-butil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolina-6-carboxílico de tiazol-2-il-
 amida,
 15 5-cloro-2-metoxi-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido 1-(3-metil-butil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolina-6-carboxílico de tiazol-2-
 ilamida,
 ácido 1-(3,3-dimetil-butil)-2,3-dihidro-1H-indole-5-carboxílico de tiazol-2-ilamida,
 4-[(3,3-dimetil-butil)-metil-amino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 20 4-[(2-ciclopentil-acetil)-propil-amino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 2-(2-metoxi-etoxi)-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,
rac-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,
 4-(3-ciclopentil-propionilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 25 35 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido cicloheptanocarboxílico [2-metil-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 3-metoxi-4-(3-fenil-propionilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- ácido cicloheptanocarboxílico [2-cloro-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 4-[2-(3-metoxi-fenil)-acetilamino]-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-bromo-4-(2-ciclopentil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-butilamino-3-cloro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5 5-cloro-4-(2-ciclopentil-acetilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5-cloro-4-(ciclopentanocarbonil-amino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(ciclohexanocarbonil-amino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 2-metoxi-4-(4-metoxi-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-metoxi-4-fenilacetilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 10 3-metil-*N*-tiazol-2-il-4-(2-tiofen-2-il-acetilamino)-benzamida,
 3-cloro-4-(2-ciclopentil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(4-metoxi-benzoilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-butilamino-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-cloro-benzoilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 15 4-(2,5 di-cloro-benzoilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-cloro-benzoilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-etil-butilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 2-metoxi-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-metil-4-(3-fenil-propionilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 20 4-(3,3-dimetil-butilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-metil-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,
 ácido *rac*-2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxina-2-carboxílico [2-metoxi-4-(tiazol-2-il-
 carbamoil)-fenil]-amida,
 4-(2,2-dimetil-propionilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 25 2-metoxi-4-(4-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido tiofeno-2-carboxílico [3-metoxi-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 4-(3-metoxi-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- ácido 8-(2-ciclopentil-acetilamino)-2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxina-5-carboxílico
tiazol-2-ilamida,
- ácido 6-(2-ciclopentil-acetilamino)-bifenil-3-carboxílico tiazol-2-ilamida,
- 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida
- 5 4-(3,3-dimetil-butililamino)-2-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 2-cloro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(2-fluoro-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(2-metoxi-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- ácido benzo[*b*]tiofeno-2-carboxílico [2-metil-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
- 10 ácido 5-(3,3-dimetil-butililamino)-bifenil-2-carboxílico tiazol-2-ilamida,
- N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(3,3-dimetil-butililamino)-benzamida,
- N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(3-metil-butililamino)-benzamida,
- N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(2-ciclopropil-acetilamino)-benzamida,
- 4-butililamino-*N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-benzamida,
- 15 4-benzoilamino-*N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-benzamida,
- 3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-4-(4,4,4-trifluoro-3-metil-butililamino)-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-*N*-tiazol-2-il-3-trifluorometoxi-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-3-metoximetil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-3-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 20 3-cloro-4-(3,3-dimetil-butililamino)-5-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-3,5-difluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-3,5-dimetil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(3,3-dimetil-butililamino)-*N*-tiazol-2-il-3-trifluorometil-benzamida,
- 3-cloro-4-(3,3-dimetil-butililamino)-*N*-tiazol-2-il-5-trifluorometil-benzamida,
- 25 *N*-(2,2-dimetil-propil)-*N'*-tiazol-2-il-tereftalamida,
- 3,5-dicloro-4-(3,3-dimetil-butililamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 4-(3-*terc*-butil-ureido)-*N*-tiazol-2-il-benzamida, y

2,2-dimetil-propilo éster de ácido [4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-carbámico

25. El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-23, en donde el compuesto es un antagonista del receptor A_{2A} que tiene una afinidad de unión A_{2A} humana (K_i) de 200 nM o menos.

26. El uso de acuerdo con la reivindicación 25, en donde el compuesto es un antagonista del receptor A_{2A} que tiene una afinidad de unión A_{2A} humana (K_i) de 50 nM o menos.

27. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-26 dado que si A es $^*NR^8-CO$, y R^{1-6} y R^8 son todos hidrógeno, entonces R^7 no es tiofen-2-ilo;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^{2-6} y R^8 son todos hidrógeno, y R^1 es *i*-propilo entonces R^7 no es metilo o bencilo;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^2 , R^{4-6} y R^8 son todos hidrógeno, R^3 es yodo y R^1 es *i*-propilo entonces R^7 no es metilo;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^1 , R^{3-6} y R^8 son todos hidrógeno y R^2 es hidroxí entonces R^7 no es metilo o etoxi.

28. La composición de acuerdo con la reivindicación 27, en donde dicho compuesto es un antagonista del receptor A_{2A} que tiene una afinidad de unión A_{2A} humana (K_i) de 200 nM o menos.

29. La composición de acuerdo con la reivindicación 28, en donde dicho compuesto es un antagonista del receptor A_{2A} que tiene una afinidad de unión A_{2A} humana (K_i) de 50 nM o menos.

5 30. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 27-29 que está en la forma de tableta o cápsula.

31. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 27-30, que comprende un portador farmacéuticamente aceptable, diluyente o excipiente.

10

32. Un compuesto de fórmula 1 de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-26 dado que si A es $^*NR^8-CO$, y R^{1-6} y R^8 son todos hidrógeno, entonces R^7 no se selecciona del grupo que consiste de alquilo C_{1-4} , pentan-3-ilo, trifluorometilo, pirimidilo, furan-2-ilo, tiofen-2-ilo, fenilo sustituido o no sustituido o
15 bencilo sustituido o no sustituido;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^{2-6} y R^8 son todos hidrógeno, y R^1 es *i*-propilo entonces R^7 no es metilo o bencilo;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^2 , R^{4-6} y R^8 son todos hidrógeno, R^3 es yodo y R^1
20 es *i*-propilo entonces R^7 no es metilo;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^1 , R^{3-6} y R^8 son todos hidrógeno y R^2 es hidroxilo entonces R^7 no es metilo o etoxi;

y dado que si A es $^*NR^8-CO$, R^2 , R^{4-6} y R^8 son todos hidrógeno, R^2 es nitro y R^7 es metilo entonces R^1 no es hidrógeno o metilo;

25

y dado que si A es $^*CO-NR^9$, R^1 , R^6 y R^9 son todos hidrógeno, y R^7 es tiazol-2-ilo, entonces R^{2-5} no son todos hidrógeno o todos flúo;

y dado que si A es $^*\text{CO-NR}^9$, R^{2-5} y R^9 son todos hidrógeno, y R^6 es metilo, entonces R^1 puede no ser hidrógeno si R^7 es 4-metil-tiazol-2-ilo y R^1 puede no ser metilo si R^7 es 4,5-dimetil-tiazol-2-ilo.

5 33. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 32, en donde R^6 es hidrógeno o halógeno.

34. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 33, en donde R^6 es hidrógeno.

10

35. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 32, en donde si A es $^*\text{NR}^8\text{-CO}$, R^{1-5} y R^8 son todos hidrógeno, y R^6 es metilo entonces R^7 no es n-propilo.

36. El compuesto de acuerdo con la reivindicación cualquiera de las
15 reivindicaciones 32-35, en donde dicho compuesto esta en la forma de una sal.

37. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 32-36, en donde dicho compuesto es un antagonista del receptor $\text{A}_{2\text{A}}$ que tiene una afinidad de unión $\text{A}_{2\text{A}}$ humana (K_i) de 200 nM o menos.

20

38. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 37, en donde dicho compuesto es un antagonista del receptor $\text{A}_{2\text{A}}$ que tiene una afinidad de unión $\text{A}_{2\text{A}}$ humana (K_i) de 50 nM o menos.

25 39. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 38, en donde dicho compuesto es un antagonista del receptor $\text{A}_{2\text{A}}$ que tiene una afinidad de unión $\text{A}_{2\text{A}}$ humana (K_i) de 50 nM o menos.

40. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste de:

- 4-Butirilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 5 *rac*-3-metoxi-4-(3-metil-4-oxo-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-4-(3-metil-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-hexanoilamino-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-cicloheptil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-metoxi-4-(3-metil-pentanoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 10 4-(2-cicloheptil-acetilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-4-[2-(2-oxo-ciclopentil)-acetilamino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-hexanoilamino-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-metil-4-(4-fenil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-ciclohexil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 15 *rac*-4-(2-biciclo[2.2.1]hept-2-il-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-(4,5-dimetil-tiazol-2-il)-benzamida,
 4-(2-adamantan-1-il-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3-benzo[1,3]dioxol-5-il-propionilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3-hidroxi-3-metil-butilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
- 20 4-(4-fluoro-benzoilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-benzoilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido tiofeno-3-carboxílico [4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
N-tiazol-2-il-4-(2-*o*-tolil-acetilamino)-benzamida,
N-tiazol-2-il-4-(2-tiofen-3-il-acetilamino)-benzamida,
- 25 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-cloro-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-bromo-4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5 3-bromo-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-metil-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-cloro-4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-cloro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 10 3-bromo-4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-3-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido cicloheptanocarboxílico [2-bromo-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 4-isobutilamino-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 15 ácido 8-(3,3-dimetil-butilamino)-2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxina-5-carboxílico tiazol-
 2-ilamida,
 3-bromo-4-butilamino-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 2-metoxi-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido cicloheptanocarboxílico [4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 20 *rac*-2-metoxi-4-(2-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-bromo-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-cloro-4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 25 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3-metil-butilamino)-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

- 3-fluoro-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-butilamino-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-butilamino-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-fluoro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 5 ácido cicloheptanocarboxílico [2-fluoro-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,
 4-(ciclopentanocarbonil-amino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 3-fluoro-4-(3-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,
 10 4-(2-ciclopentil-acetilamino)-2-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido 4-(2-metil-benzoil)-3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oxazina-7-carboxílico tiazol-2-il-
 amida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 15 5-cloro-4-(3,3-dimetil-butilamino)-2-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(3,3-dimetil-butilamino)-*N*-(5-metil-tiazol-2-il)-benzamida,
 5-cloro-2-metoxi-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-(5-metil-tiazol-2-il)-benzamida,
 ácido 1-(3,3-dimetil-butil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolina-6-carboxílico tiazol-2-il-
 20 amida,
 5-cloro-2-metoxi-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 ácido 1-(3-metil-butil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolina-6-carboxílico tiazol-2-ilamida,
 ácido 1-(3,3-dimetil-butil)-2,3-dihidro-1H-indol-5-carboxílico tiazol-2-ilamida,
 4-[(3,3-dimetil-butil)-metil-amino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 25 4-[(2-ciclopentil-acetil)-propil-amino]-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
 2-(2-metoxi-etoxi)-4-(3-metil-butilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,
rac-2-propoxi-*N*-tiazol-2-il-4-(3,5,5-trimetil-hexanoilamino)-benzamida,

carbamoil)-fenil]-amida,

4-(2,2-dimetil-propionilamino)-3-metoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

2-metoxi-4-(4-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

ácido tiofeno-2-carboxílico [3-metoxi-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-amida,

5 4-(3-metoxi-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

ácido 8-(2-ciclopentil-acetilamino)-2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxina-5-carboxílico
tiazol-2-ilamida,

ácido 6-(2-ciclopentil-acetilamino)-bifenil-3-carboxílico tiazol-2-ilamida,

4-(2-ciclopentil-acetilamino)-3-(2-metoxi-etoxi)-*N*-tiazol-2-il-benzamida

10 4-(3,3-dimetil-butililamino)-2-fluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

2-cloro-4-(2-metil-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

4-(2-fluoro-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

4-(2-metoxi-benzoilamino)-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

ácido benzo[b]tiofeno-2-carboxílico [2-metil-4-(tiazol-2-ilcarbamoil)-fenil]-

15 amida,

ácido 5-(3,3-dimetil-butililamino)-bifenil-2-carboxílico tiazol-2-ilamida,

N-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(3,3-dimetil-butililamino)-benzamida,

N-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(3-metil-butililamino)-benzamida,

N-(5-cloro-tiazol-2-il)-4-(2-ciclopropil-acetilamino)-benzamida,

20 4-butililamino-*N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-benzamida,

4-benzoilamino-*N*-(5-cloro-tiazol-2-il)-benzamida,

3-fluoro-*N*-tiazol-2-il-4-(4,4,4-trifluoro-3-metil-butililamino)-benzamida,

4-(3,3-dimetil-butililamino)-*N*-tiazol-2-il-3-trifluorometoxi-benzamida,

4-(3,3-dimetil-butililamino)-3-metoximetil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

25 4-(3,3-dimetil-butililamino)-3-propoxi-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

3-cloro-4-(3,3-dimetil-butililamino)-5-metil-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

4-(3,3-dimetil-butililamino)-3,5-difluoro-*N*-tiazol-2-il-benzamida,

47. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 32-45 para el uso en una enfermedad seleccionada el grupo que consiste de: Enfermedad de Parkinson, Enfermedad de Alzheimer, Enfermedad de Huntington, epilepsia, isquemia cerebral, apoplejía hemorrágica, isquemia neonatal e hipoxia, hemorragia subaracnoide, daño cerebral traumático, daño cerebral seguido por paro cardíaco, trastornos de depresión y psicosis.

48. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 47, en donde la enfermedad es enfermedad de Parkinson.

10

49. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 32-45 para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad seleccionada del grupo que consiste de: Enfermedad de Parkinson, Enfermedad de Alzheimer, Enfermedad de Huntington, epilepsia, isquemia cerebral, apoplejía hemorrágica, isquemia neonatal y hipoxia, hemorragia subaracnoide, daño cerebral traumático, daño cerebral seguido por paro cardíaco, trastornos de depresión y psicosis.

50. El uso de acuerdo con la reivindicación 49, en donde la enfermedad es Enfermedad de Parkinson.

20

198

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 32,671
FECHA : ABRIL 23 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-039105-00003-0000

Fecha: 2007-04-30 16:40:40 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 22

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55600351	23/04/2007	39,336,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
	12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____ 6060 03003 841 0483