

LLORED A & CIA. S. A.

A B O G A D

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-120181- -00003-0000

Fecha: 2007-09-19 16:49:41 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 37

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

BOGOTA - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLORED A
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jlcco@lloredacamacho.com

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS TERAPÉUTICOS: PIRIDINA COMO ESTRUCTURA".-Clase C07D 213/81.-Expediente número 06-120.181.-

1. Me refiero a mi memorial radicado ante ese Despacho el 23 de Febrero de 2007.

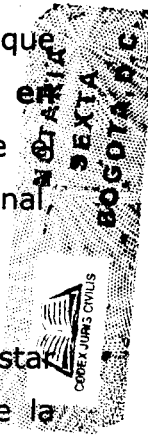
2. Debidamente autorizado por mi representado, y siguiendo los lineamientos de la respuesta emitida por ese Despacho al Derecho de Petición cuyo número de radicación es 07-089.021, me permito allegar el capítulo reivindicatorio que **deberá ser tenido en cuenta para el trámite de la presente solicitud en Fase Nacional**, y en el cual constan las modificaciones voluntarias que solicitante realizó al capítulo reivindicatorio presentado en Fase Internacional, junto con el pago de la tasa correspondiente.

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

3. Anexo me permito presentar:

(a) Formulario único de correcciones y modificaciones;

(b) Recibo número 07-74,054, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la modificación mencionada; y



(c) Copia del capítulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado en Fase Internacional.

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

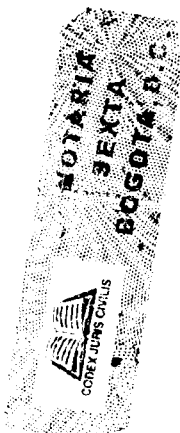
T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. 118 SEP 2007
Ante el JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA

Comparador: Alicia Lloreda Ricaurte

quien (as) exhibió (ron) (s) C.C.
cc/ 39690713 Usaquén
TP 53.215

y declaró (n) (n) (n) (n) (n) que aparece (n)
en el presente documento es (son) (s) (s) y
que el contenido del mismo es cierto. En constan-
cia se firma esta diligencia




ALICIA LLOREDA RICAURTE

C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **ASTRAZENECA AB**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Suecia.

Dirección: SE-151 85 Södertälje, Suecia.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Södertälje, Suecia.

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 5° Piso

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

06-120.181

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al Capítulo
Reivindicatorio presentado en Fase Internacional.

⑥

Comprobante de pago No. 07-74,054

Fecha 13 de Septiembre de 2007

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

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

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713 T.P. 53.215

38

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 06-120181-00003.0000

Fecha: 2007-09-13 14:01
Tra 11 PATENTISYI E 8370 PASUNACIONALII
Act. 329 CTOINFORMATION Folios 37

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 74,054
FECHA : SEPTIEMBRE 13 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999528	13/09/2007	3,960,000.00

***** CONCEPTO *****

NT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

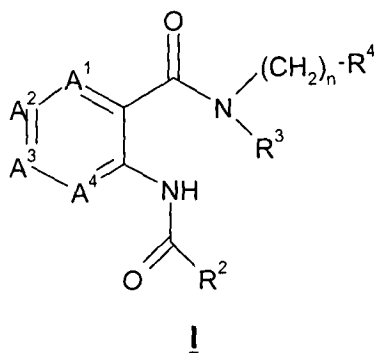
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

387

Reivindicaciones:

1. Un compuesto de formula I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, diastereómeros, enantiómeros, o mezclas del mismo:

5

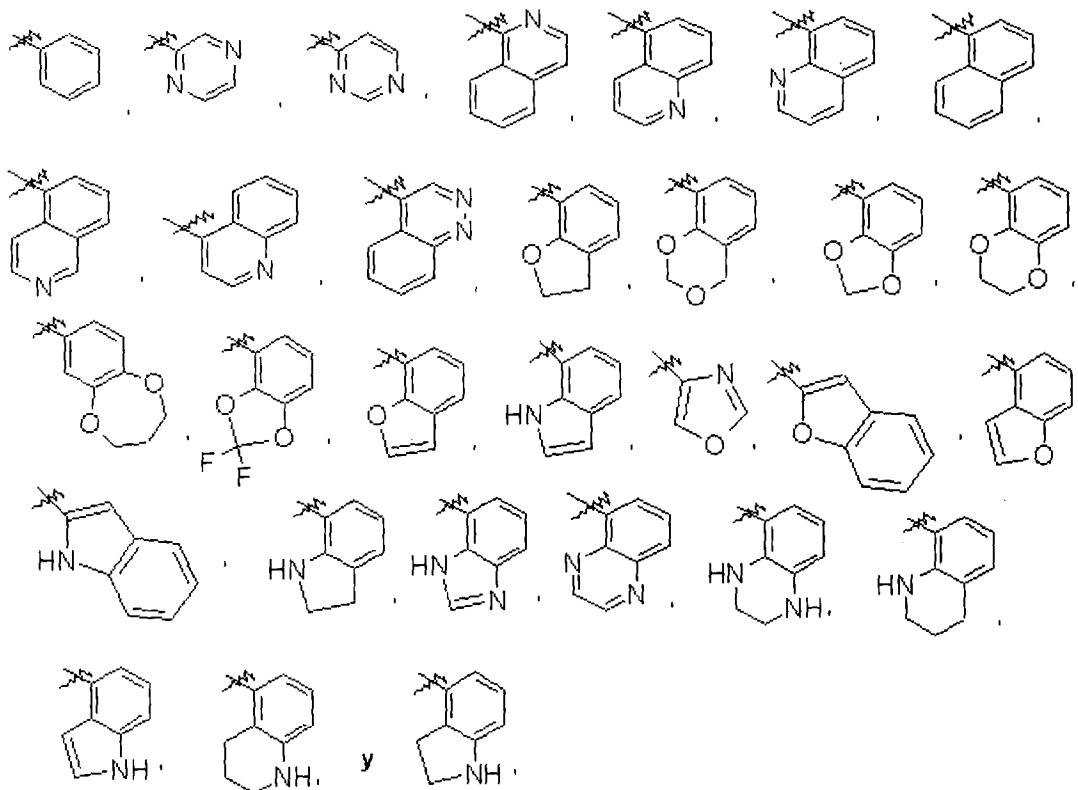


en donde:

10 uno de A¹, A², A³ o A⁴ es N y el resto son cada uno e independientemente CR¹; y

R¹ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, amino, acetilamino, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, alquileo, 15 alquilo halogenado, alquileo halogenado y NR⁵R⁶;

R² se selecciona de



387
384

en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alcoxi, hidroxí, hidroxí-alquilo, amino, alquilo-arilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilocarbonil, alcoxycarbonil, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heteroarilo-carbonil, heterociclilo-carbonil, arilocarbonil, heterociclilo, cicloalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, arilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$;

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

10

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$; y

20

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxí C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y

35

298
385

heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆; en donde dicho alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆,
alcoxialquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo, hidroxialquiloC₁₋₆,
alcoxi, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonil,
heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆ usados para definir R⁵ y R⁶
5 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de
halógeno, ciano, nitro, alcoxiC₁₋₆, alquiloC₁₋₆ y hidroxil;

con una condición que cuando n=0 entonces R⁴ no es tiazolilo o 5-
cloropiridinilo;

10

con una condición adicional que cuando R² es fenilo entonces n=0 y
R⁴ no es metilo no sustituido, alquilo C₃ o alquilo C₄ no sustituido; y

con una condición adicional que dicho compuesto de formula I no sea
15 ninguno de

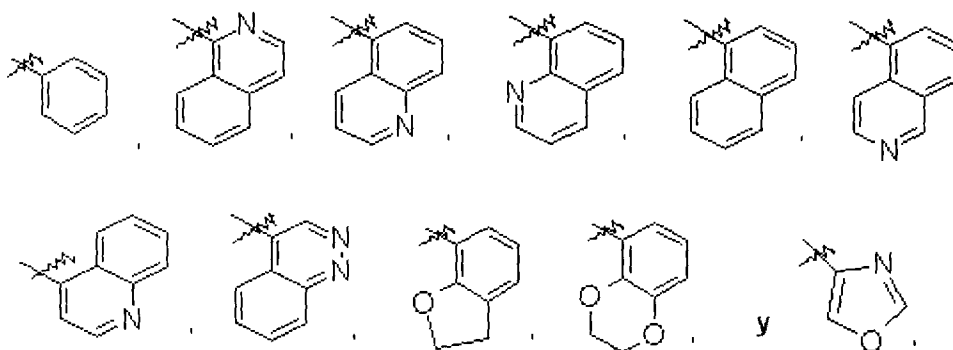
- 3-(benzoilamino)-N-bencilpiridina-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-piridin-3-ilpiridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-fenilpiridin-2-carboxamida;
- 20 3-(benzoilamino)-N-(3-nitrofenil)piridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-(4-metoxifenil)piridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-[4-(dimetilamino)fenil]piridin-2-carboxamida;
- N-(2-hidroxietil)-4-(2-naftoilamino)nicotinamida;
- 4-(benzoilamino)-N-(2-hidroxietil)nicotinamida;
- 25 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-N-fenilisonicotinamida;
- 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-N-(3-nitrofenil)isonicotinamida;
- 2-(benzoilamino)-N-[ciano(2-tienil)metil]nicotinamida; y
- 2-(benzoilamino)-N-[ciano(fenil)metil]nicotinamida.

- 30 2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
R¹ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno,
hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, y alquilo halogenado; y

R² se selecciona de

35

386



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alquilo-alcoxi, hidroxialquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heterociclilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$;

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilo-carbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxialquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxialquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxialquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo,

290
387

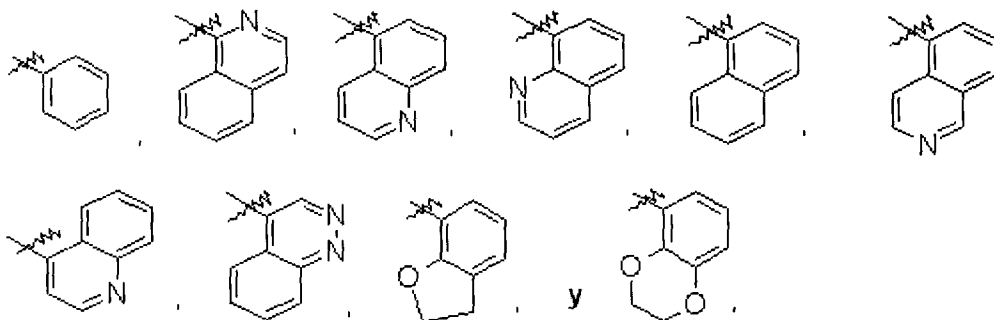
heterocíclico-alquilo, hidroxi-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquiloC₁₋₆ y -NR⁵R⁶,

en donde cada uno de R⁵ y R⁶ se selecciona independientemente de
 5 hidrógeno, alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alcoxialquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonil, alcoxyc₁₋₆carbonilo, hidroxialquiloC₁₋₆, alcoxyc, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquilC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆; en donde dicho alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alcoxialquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxyc₁₋₆carbonilo, hidroxialquiloC₁₋₆, alcoxyc, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆ usado para definir R⁵ y R⁶ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, ciano, nitro, alcoxyc₁₋₆, alquiloC₁₋₆ y hidroxi.

15 3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde R¹ se selecciona independientemente de hidrógeno, fluoro, cloro, hidroxilo, alcoxyc, alquilo, alcoxyc halogenado, y alquilo halogenado; y

R² se selecciona de

20



en donde dicho grupo usado para definir R² está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxyc halogenado, alquilo-alcoxyc, hidroxi-alquilo, alcoxyc, alcoxialquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heterociclilo, heteroarilo, heteroariloalquilo y -NR⁵R⁶;

R³ se selecciona de hidrógeno y alquilo;

30

241
388

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilo-carbonil, ciano, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y $-NR^5R^6$; y

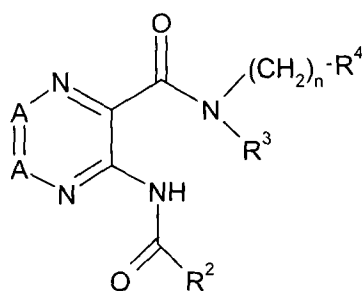
n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxi-alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxil-alquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxi-alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxil-alquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usado para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alcoxi C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxil.

4. Un compuesto de formula IB o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, diastereómeros, enantiómeros, o mezclas de los mismos:

248
389

**IB**

en donde:

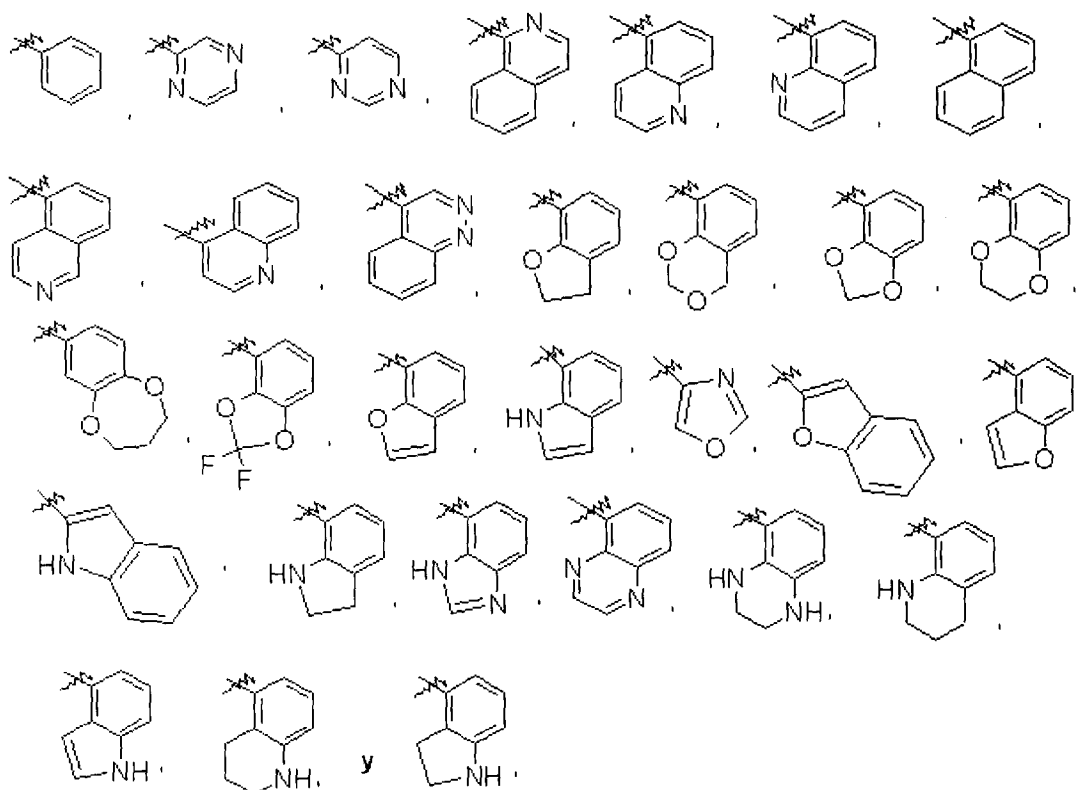
5

A es cada uno independientemente CR¹; y

R¹ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, amino, acetilamino, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, alquileo, alquilo halogenado, alquileo halogenado y NR⁵R⁶;

10

R² se selecciona de



15

en donde dicho grupo usado para definir R² está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alcoxi, hidroxilo, hidroxilo-alquilo, amino,

88

590

alquilo-arilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilocarbonil, alcoxycarbonil, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heteroarilo-carbonil, heterociclilo-carbonil, arilocarbonil, heterociclilo, cicloalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo-, arilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$;

5

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$; y

15

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} y $-NR^5R^6$,

25

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxil C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxil C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo,

30

35

391

heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆ usados para definir R⁵ y R⁶ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, ciano, nitro, alcoxiC₁₋₆, alquiloC₁₋₆ e hidroxí;

- 5 con una condición que dicho compuesto de formula IB no sea ninguno de 3-[(4-ter-butilbenzoilo)amino]-N-(5-cloro-piridin-2-il)pirazin-2-carboxamida; N-[2-(1H-imidazol-2-il)etil]-3-[[4-(1,1-dimetiletil)benzoilo]amino]-2-pirazincarboxamida y 3-(benzoilamino)-N-(metoxicarbonilmetil)pirazin-2-carboxamida.

10

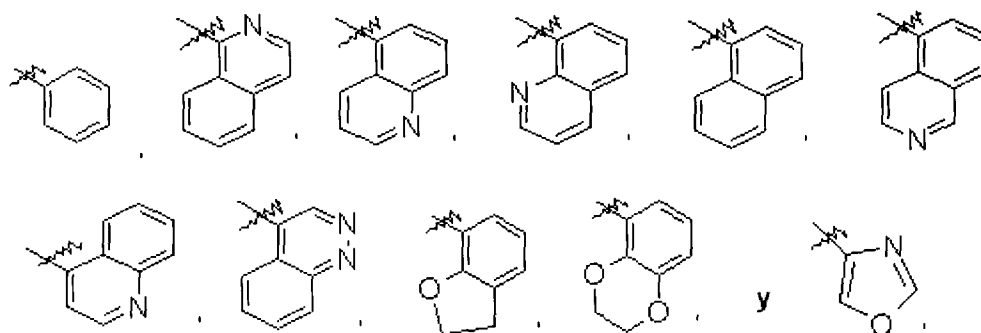
5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde

A es cada uno individualmente CR¹;

15

R¹ se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, y alquilo halogenado;

R² se selecciona de



20

- en donde dicho grupo usado para definir R² está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alquilo-alcoxi, hidroxí-alquilo, alcoxi, 25 alcóxialquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heterociclilo, heteroarilo, heteroariloalquilo, arilo-alquilo y -NR⁵R⁶;

R³ se selecciona de hidrógeno y alquilo;

gff
392

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde said alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilo-carbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxí.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 o 5, en donde

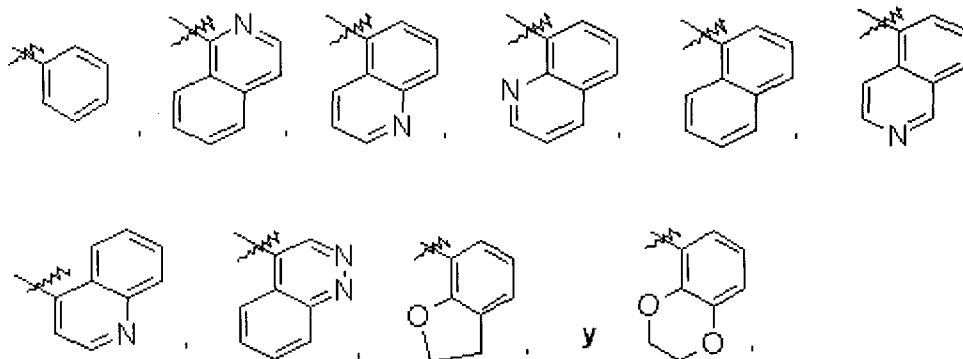
A es cada uno individualmente CR^1 ;

393

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, fluoro, cloro, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, y alquilo halogenado;

R^2 se selecciona de

5



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, alquilo-alcoxi, hidroxil-alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heterociclilo, heteroarilo, heteroariloalquilo y $-NR^5R^6$;

15

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilo-carbonil, ciano, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente

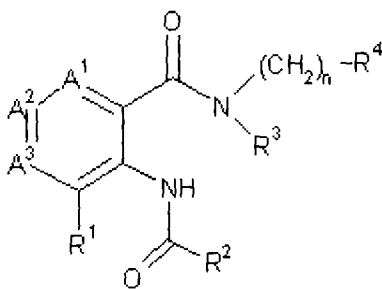
30

398
399

fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxilo-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxialquilo C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxialquilo C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxilo.

7. Un compuesto de formula IA o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, diastereómeros, enantiómeros, o mezclas de los mismos:



IA

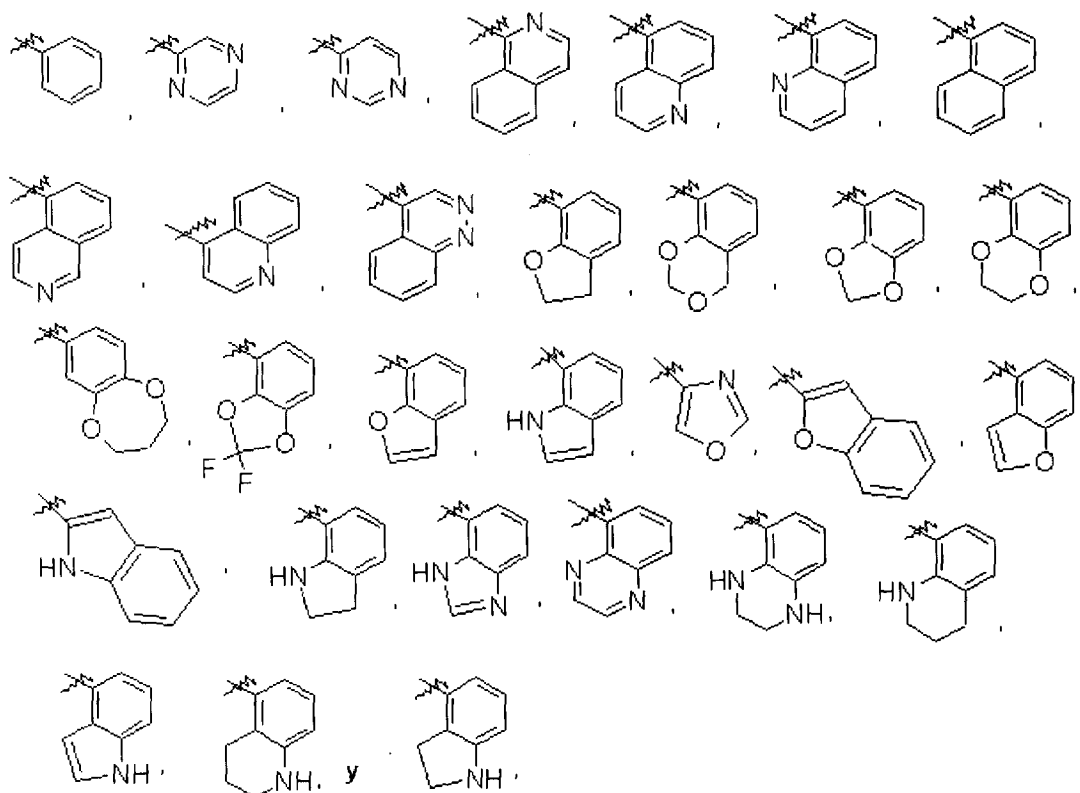
En donde:

uno de A^1 , A^2 o A^3 es N y el resto son cada uno e independientemente CR^1 ; y

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, amino, acetilamino, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, alqueno, alquilo halogenado, alqueno halogenado y NR^5R^6 ;

~~348~~
345

R^2 se selecciona de



5 en donde dicho grupo usado para definir R² está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alcoxi, hidroxilo, hidroxilo-alquilo, amino, alquilo-arilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonilo, heteroarilo-carbonilo, 10 heterociclilo-carbonilo, arilcarbonilo, heterociclilo, cicloalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, arilo, arilo-alquilo y NR⁵R⁶;

R³ se selecciona de hidrógeno y alquilo;

15 R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquienilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquienilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o mas grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxilo, alcoxi-
20 alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonilo, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxilo-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$; y

396

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonilo, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxilo-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} , y $-NR^5R^6$;

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, nitro, alcoxi C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxilo;

con una condición que cuando $n=0$ entonces R^4 no es tiazolilo o 5-cloropiridinilo;

con una condición adicional que cuando R^2 es fenilo, entonces $n=0$ y R^4 no es metilo no sustituido, alquilo C_3 o alquilo C_4 no sustituido; y

con una condición adicional que dicho compuesto de formula IA no es ninguno de

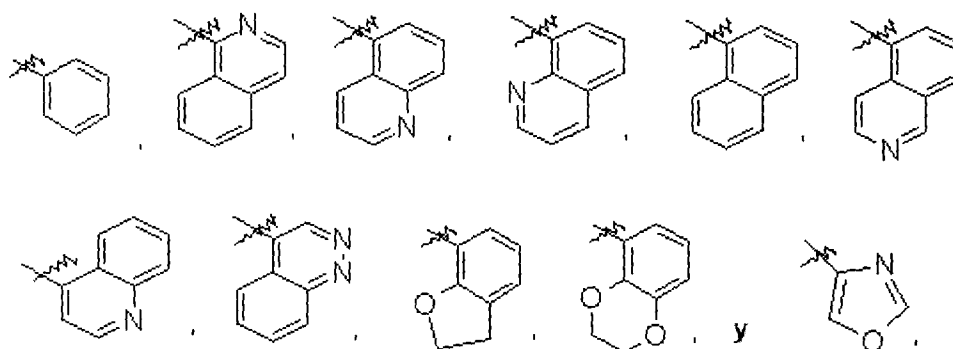
- 3-(benzoilamino)-*N*-bencilpiridina-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-*N*-piridin-3-ilpiridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-*N*-fenilpiridin-2-carboxamida;

3-(benzoilamino)-*N*-(3-nitrofenil)piridin-2-carboxamida;
 3-(benzoilamino)-*N*-(4-metoxifenil)piridin-2-carboxamida;
 3-(benzoilamino)-*N*-[4-(dimetilamino)fenil]piridin-2-carboxamida;
N-(2-hidroxietil)-4-(2-naftoilamino)nicotinamida;
 4-(benzoilamino)-*N*-(2-hidroxietil)nicotinamida;
 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-*N*-fenilisonicotinamida; y
 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-*N*-(3-nitrofenil)isonicotinamida.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, en donde

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado y alquilo halogenado; y

R^2 se selecciona de



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alquilo-alcoxi, hidroxil-alquilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonilo, heterociclilo, heteroarilo, heteroarilalquilo-, arilo-alquilo y NR^5R^6 ;

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquienilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquienilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o mas grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilo-carbonilo,

398

ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonilo, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y $-NR^5R^6$; y

5

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonilo, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo C_{1-6} , y $-NR^5R^6$;

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxí C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxí C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, nitro, alcoxí C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxí.

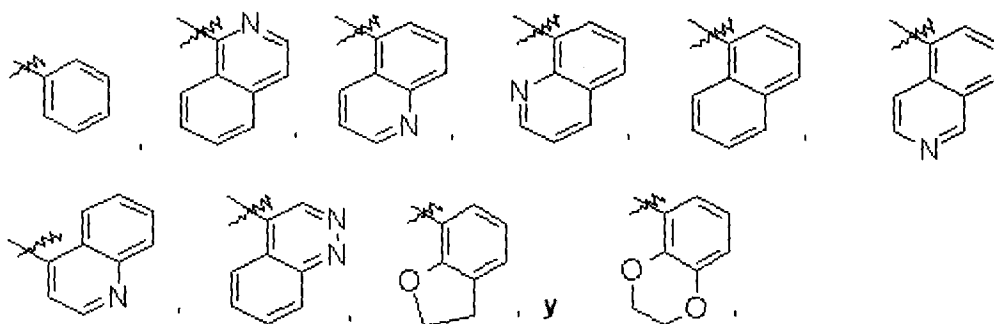
30

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7 u 8, en donde

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, fluoro, cloro, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado y alquilo halogenado; y

35

R^2 se selecciona de



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido
 5 por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado,
 alquilo, alcoxi halogenado, alquilo-alcoxi, hidroxialquilo, alcoxi, alcoxi-
 alquilo, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonilo, heterociclilo,
 heteroarilo, heteroarilalquilo-, y $-NR^5R^6$;

10 R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alqueno, cicloalquilo,
 cicloalqueno, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo,
 alqueno, cicloalquilo, cicloalqueno, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo
 15 usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos
 seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonil,
 ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxialquilo,
 alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo,
 heterocíclico-alquilo, hidroxialquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, y
 20 $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden
 25 formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente
 fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más
 heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente
 fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más
 heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por
 30 uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo,
 ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxialquilo,

2157
400

alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxialquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquiloC₁₋₆ y -NR⁵R⁶,

5 en donde cada uno de R⁵ y R⁶ se selecciona independientemente de hidrógeno, alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alcoxialquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo, hidroxialquiloC₁₋₆, alcoxi, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆; en donde dicho alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆,
10 alcoxialquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo, hidroxialquiloC₁₋₆, alcoxi, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆ usados para definir R⁵ y R⁶ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alcoxiC₁₋₆, alquiloC₁₋₆ e hidroxil.

15

10. Un compuesto seleccionado de:

N-(ciclobutilmetil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-[2-(4-morfolinil)etil]-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
20 N-4-morfolinil-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-N-[(tetrahydro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
N-ciclohexil-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-(3-metilciclohexil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
25 N-ciclobutil-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-(ciclohexilmetil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-N-(tetrahydro-2H-piran-4-il)-2-piridincarboxamida;
3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-N-[2-(1-piperidinil)etil]-2-piridincarboxamida;
30 N-(2-hidroxipropil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-(2-hidroxibutil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-(ciclopentilmetil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-N-(2-piperidinilmetil)-2-piridincarboxamida;
N-(2,2-dimetilpropil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
35 N-(2-metoxi-1-metiletil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
N-[(1-hidroxiciclohexil)metil]-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;

404
401

- N-(ciclobutilmetil)-3-[[[4-metil-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-metil-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 5 3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[[4-metoxi-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 3-[(4-metoxi-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 10 N-(ciclohexilmetil)-3-[[[4-(dimetilamino)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-(dimetilamino)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[[4-(dimetilamino)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-
- 15 piridincarboxamida;
- N-(ciclobutiloxi)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclopentiloxi)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclohexiloxi)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclohexiloxi)-3-[(4-metoxi-1-naftalenilcarbonil)amino]-2-
- 20 piridincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[(2-metoxibenzoil)amino]-2-piridincarboxamida;
- N-[2-[[[ciclobutilmetil]amino]carbonil]-3-piridinil]-4-quinolincarboxamida;
- N-[2-[[[ciclobutilmetil]amino]carbonil]-3-piridinil]-5-isoquinolincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[[2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-5-il]carbonil]amino]-2-
- 25 piridincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[[2,3-dihidro-7-benzofuranil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[(3-metoxi-2-metilbenzoil)amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(2-[[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il)quinolin-4-
- 30 carboxamida;
- N-(2-[[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il)isoquinolin-5-carboxamida;
- N-(2-[[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il)quinolin-5-carboxamida;
- 35 N-(ciclohexilmetil)-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-(ciclobutilmetil)-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-(1-naftoilamino)isonicotinamida;

445
402

- N-ciclobutil-3-(1-naftoilamino)isonicotinamida;
 3-(1-naftoilamino)-N-(tetrahydro-2H-piran-4-ilmetil)pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclohexilmetil)-3-(1-naftoilamino)pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclobutilmetil)-3-(1-naftoilamino)pirazin-2-carboxamida;
 5 N-(ciclopentilmetil)-3-(1-naftoilamino)pirazin-2-carboxamida;
 N-(2-ciclohexiletil)-3-(1-naftoilamino)pirazin-2-carboxamida;
 3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-pentilopirazin-2-carboxamida;
 N-(3-metilbutil)-3-[(4-metil-1-naftoil)amino]pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclobutilmetil)-3-[(4-metil-1-naftoil)amino]pirazin-2-carboxamida;
 10 3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-(tetrahydro-2H-piran-4-ilmetil)pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclobutilmetil)-3-[(4-etil-1-naftoil)amino]pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclohexilmetil)-3-[(4-etil-1-naftoil)amino]pirazin-2-carboxamida;
 3-[(4-etil-1-naftoil)amino]-N-(tetrahydro-2H-piran-4-ilmetil)pirazin-2-
 15 carboxamida;
 N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 20 N-(tetrahydro-2H-piran-4-ilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 N-(3-metilbutil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]-N-(tetrahydro-2H-piran-4-ilmetil)pirazin-2-
 25 carboxamida;
 N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
 3-[[5-bromo-4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]-N-(ciclohexilmetil)pirazin-2-carboxamida;
 30 3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]-N-(tetrahydrofuran-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
 N-(1,4-dioxan-2-ilmetil)-3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
 3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]-N-(tetrahydro-2H-piran-4-il)piridin-2-carboxamida;
 35 3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]-N-[2-(tetrahydro-2H-piran-4-il)etil]piridin-2-carboxamida;
 3-[[4-metoxi-1-naftoil]amino]-N-[(2R)-piperidin-2-ilmetil]piridin-2-carboxamida;

- 3-[(4-metoxi-1-naftoil)amino]-N-(morfolin-3-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1-hidroxiciclohexil)metil]-3-[(4-metoxi-1-naftoil)amino]piridin-2-
carboxamida;
N-(ciclohexilmetil)-3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
5 3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]-N-pentilpiridin-2-carboxamida;
3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
N-(ciclopentilmetil)-3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]-N-[2-(tetrahidro-2H-piran-4-il)etil]piridin-2-
10 carboxamida;
N-(ciclobutilmetil)-3-[(4-etoxi-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
N-ciclobutil-3-[(5-metil-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
3-(1-naftoilamino)-N-[(2R)-piperidin-2-ilmetil]piridin-2-carboxamida;
3-(1-naftoilamino)-N-[(2S)-piperidin-2-ilmetil]piridin-2-carboxamida;
15 3-(1-naftoilamino)-N-(piridin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
3-(4-metilo-1-naftoilamino)-N-(piridin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
3-[(4-amino-1-naftoil)amino]-N-(ciclohexilmetil)piridin-2-carboxamida;
N-(ciclohexilmetil)-3-[(4-metil-1-naftalenilcarbonil)amino]-2-
piridincarboxamida;
20 N-(ciclohexilmetil)-3-[(2,2-dimetilbutanoil)amino]piridin-2-carboxamida;
3-[(4-amino-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
3-[(4-(acetilamino)-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
25 3-[(4-[(metilamino)carbonil]amino)-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-
ilmetil)piridin-2-carboxamida;
Metil (4-[(2-[(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)amino]carbonil}piridin-3-
il)amino]carbonil)-1-naftil)carbamato;
N-(ciclohexiloxi)-3-[(4-metil-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
30 3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-[(1-metilpiperidin-2-il)metil]piridin-2-
carboxamida;
3-[(4-etil-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
3-[(4-etil-1-naftoil)amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
35 3-[(4-isopropil-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
N-(2-hidroxietil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;

407
404

- 3-[(4-isopropil-1-naftoil)amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-
carboxamida;
3-[[4-(etoximetil)-1-naftoil]amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
5 N-(piperidin-2-ilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-
2-carboxamida;
N-(piperidin-2-ilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-
2-carboxamida;
N-(piperidin-2-ilmetil)-3-[[4-(2H-1,2,3-triazol-2-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-
10 2-carboxamida;
3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-[2-(tetrahidro-2H-piran-4-il)etil]piridin-2-
carboxamida;
3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]-N-[2-(tetrahidro-2H-piran-4-il)etil]piridin-2-
carboxamida;
15 3-[(4-metil-1-naftoil)amino]-N-(morfolin-3-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
N-ciclopentil-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
N-butil-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-
piridincarboxamida;
N-(ciclopropilmetil)-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-
20 naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
N-(ciclopentilmetil)-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-
naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
N-hexil-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-
piridincarboxamida;
25 N-[3-(dimetilamino)propil]-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-
naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
N-[2-(4-morfolinil)etil]-3-[[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-
naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-
30 carboxamida;
N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(2H-1,2,3-triazol-2-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-
carboxamida;
N-pentil-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-
carboxamida;
35 N-[2-(tetrahidro-2H-piran-4-il)etil]-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-
naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;

405

- N*-[2-(1*H*-pirrol-1-il)etil]-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-[3-(1*H*-imidazol-1-il)propil]-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- 5 *N*-[3-(1*H*-pirazol-1-il)propil]-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-[2-(1*H*-imidazol-1-il)etil]-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-[2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)etil]-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- 10 *N*-(2-metoxietil)-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-(2-etoxietil)-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- 15 *N*-(2-propoxietil)-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-(3-metoxipropil)-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-(3-etoxipropil)-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- 20 *N*-alil-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-propil-3-[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino}piridin-2-carboxamida;
- N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 25 *N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(4*H*-1,2,4-triazol-4-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(1*H*-1,2,4-triazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 30 3-[[[4-(1-pirrolidinilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-*N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-(1*H*-pirazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-*N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- N*-[(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(2*H*-tetrazol-2-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- 35 *N*-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)-3-[[[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;

401

406

- 3-[[[4-(1H-imidazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-il)-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-(1H-pirazol-1-ilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-il)-2-piridincarboxamida;
- 5 3-[[[4-(metoximetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-(metoximetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 3-[(4-bencil-1-naftoil)amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-
- 10 carboxamida;
- 3-[[[4-(3-furanilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 3-[[[4-(2-furanilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-2-piridincarboxamida;
- 15 N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(2-tienilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- N-[(tetrahidro-2H-piran-4-il)metil]-3-[[[4-(3-tienilmetil)-1-naftalenil]carbonil]amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(2-metilciclohexil)-3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-2-piridincarboxamida;
- 20 3-[(1-naftalenilcarbonil)amino]-N-[2-(1-pirrolidinilo)etil]-2-piridincarboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[2-(4-morfolinil)benzoil]amino]-2-piridincarboxamida;
- N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)-3-[(4-[(3H-[1,2,3]triazolo[4,5-b]piridin-3-iloxi)metil]-1-naftoil)amino]piridin-2-carboxamida;
- 3-(1-naftoilamino)-N-(pirrolidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 25 N-[(1-metilpirrolidin-2-il)metil]-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- N-[(1-metilopiperidin-2-il)metil]-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- N-[(1-acetilpiperidin-2-il)metil]-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- Metil 2-[[[3-(1-naftoilamino)piridin-2-il]carbonil]amino]metil]piperidin-1-carboxilato;
- 30 N-(ciclopentilmetil)-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-ciclopentil-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-(ciclopropilmetil)-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-isobutil-4-(1-naftoilamino)nicotinamida;
- N-(ciclobutilmetil)-4-[(4-metil-1-naftoil)amino]nicotinamida;
- 35 N-(ciclopentilmetil)-4-[(4-metil-1-naftoil)amino]nicotinamida;
- 3-[[4-(hidroximetil)-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;

410

107

- 3-[[4-(piperidin-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-[[2-(hidroxi)etil]amino]metil]-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 5 3-[[4-[(dimetilamino)metil]-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(1H-imidazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(azetidin-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 10 Metil 4-[[2-[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il]amino]carbonil]-1-naftoato;
- N,N-dimetil-N'-(2-[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil)piridin-3-il)naftalen-1,4-dicarboxamida;
- 15 2-hidroxi)etil 4-[[2-[[tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il]amino]carbonil]-1-naftoato;
- 3-[[1-benzofuran-2-ilcarbonil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-yodo-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 20 N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-piperidin-1-il-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-azetidin-1-il-1-naftoil]amino]-N-(ciclohexilmetil)piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-[etil(metil)amino]-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-pirrolidin-1-il-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 25 N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(4-isopropilpiperazin-1-il)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-[3-(dietilamino)pirrolidin-1-il]-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N'-(2-[[ciclohexilmetil]amino]carbonil)piridin-3-il)-N,N-dimetilnaftalen-1,4-
- 30 dicarboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-[(dimetilamino)metil]-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(1H-pirrol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-
- 35 carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;

- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(1H-pirazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-[[etil(metil)amino]metil]-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 5 N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(1H-imidazol-1-ilmetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-[(dimetilamino)metil]-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(metoximetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 10 N-(ciclobutilmetil)-3-[[4-(etoximetil)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- N'-(2-[[ciclobutilmetil]amino]carbonil]piridin-3-il)-N,N-dimetilnaftalen-1,4-dicarboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]pirazin-2-carboxamida;
- 15 N-(ciclohexilmetil)-3-[[5-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-(piperidin-2-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-pentilpiridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-hexilpiridin-2-carboxamida;
- 20 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-[3-(dimetilamino)propil]piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-propilpiridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-(2-etilbutil)piridin-2-carboxamida;
- N-(ciclohexilmetil)-3-[[5-fenil-1,3-oxazol-4-ilo]carbonil]amino]piridin-2-
- 25 carboxamida;
- N-butyl-3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]piridin-2-carboxamida;
- 3-[[5-fenil-1,3-oxazol-4-il]carbonil]amino]-N-(tetrahidro-2H-piran-4-ilmetil)piridin-2-carboxamida;
- 3-[[4-(dimetilamino)-1-naftoil]amino]-N-[3-(1H-imidazol-1-il)propil]piridin-2-
- 30 carboxamida;
- N-(4,4-difluorociclohexil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- N-(3,5-difluorobencil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- N-(4-morfolin-4-ilbencil)-3-(1-naftoilamino)piridin-2-carboxamida;
- ciclohexilmetil-amida del ácido 6-metoxi-3-[[4-[1,2,3]triazol-1-ilmetil-naftalen-
- 35 1-carbonil]-amino]-piridin-2-carboxílico;
- ciclohexilmetil-amida del ácido 6-hidroxi-3-[[4-[1,2,3]triazol-1-ilmetil-naftalen-
- 1-carbonil]-amino]-piridin-2-carboxílico;

4/12
1109

(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-amida del ácido 6-metoxi-3-[(4-[1,2,3]triazol-1-ilmetil-naftalen-1-carbonil)-amino]-piridin-2-carboxílico;

(tetrahidro-piran-4-ilmetil)-amida del ácido 6-hidroxi-3-[(4-[1,2,3]triazol-1-ilmetil-naftalen-1-carbonil)-amino]-piridin-2-carboxílico;

5 ciclohexilmetil-amida del ácido 6-propoxi-3-[(4-[1,2,3]triazol-1-ilmetil-naftalen-1-carbonil)-amino]-piridin-2-carboxílico;

y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

10 11. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-10 para uso como un medicamento.

15 12. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la fabricación de un medicamento para la terapia del dolor.

13. El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la fabricación de un medicamento para la terapia de trastornos funcionales gastrointestinales.

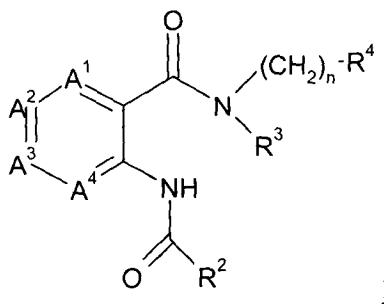
20 14. El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento del síndrome de intestino irritable.

25 15. El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de ansiedad, cáncer, esclerosis múltiple, enfermedad de Parkinson, corea de Huntington, enfermedad de Alzheimer, y trastornos cardiovasculares.

30 16. El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-10 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento del trastorno de reflujo gastroesofágico.

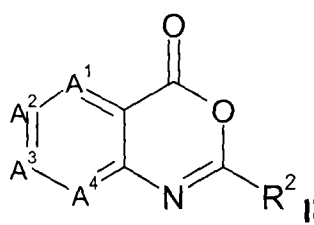
35 17. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-10 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

18. Un método para preparar un compuesto de formula I,



que comprende el paso de hacer reaccionar un compuesto de formula II,

5



con un compuesto de $R^3(CH_2)_nR^4NH$, en la presencia de una base, tal como DIPEA, un solvente tal como DMF,

10

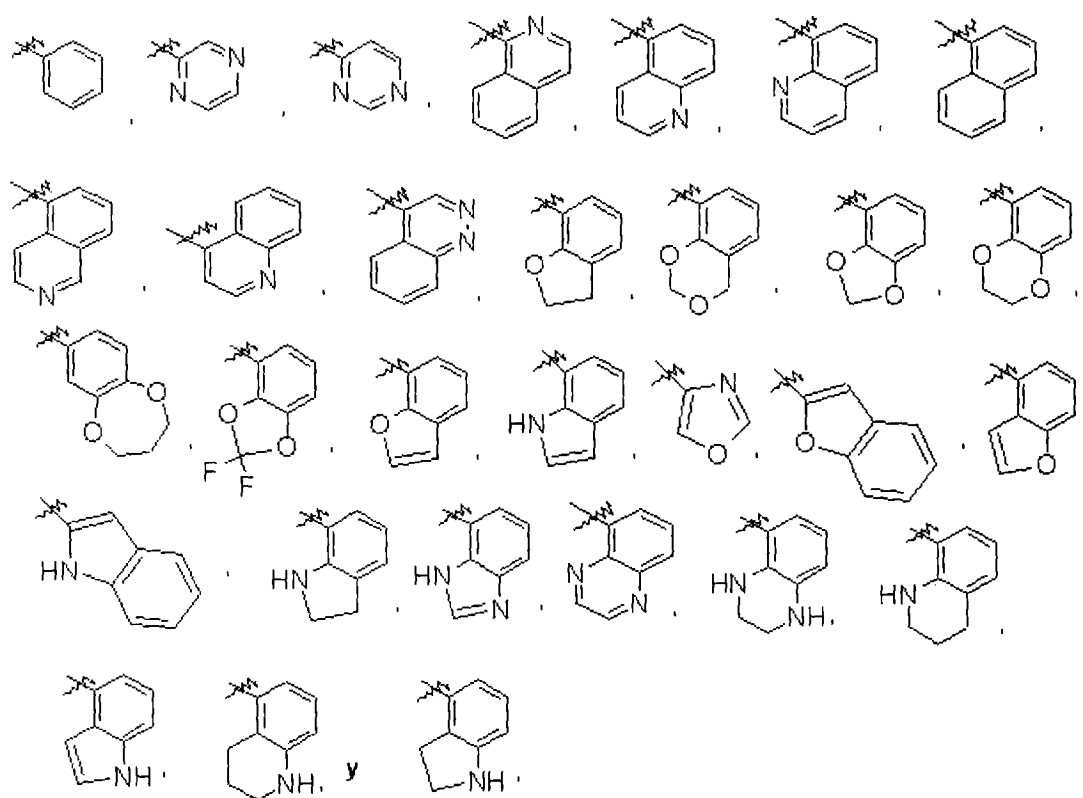
en donde

uno de A^1 , A^2 , A^3 o A^4 es N y los restantes son cada uno e independientemente CR^1 ; y

15

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, amino, acetilamino, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, alquilenilo, alquilo halogenado, alquilenilo halogenado y NR^5R^6 ;

R^2 se selecciona de



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alcoxi, hidroxilo, hidroxilo-alquilo, amino, alquilo-arilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilocarbonil, alcoxycarbonil, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heteroarilo-carbonil, heterociclilo-carbonil, arilocarbonil, heterociclilo, cicloalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo-, arilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$;

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxilo-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

415

412

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquiloC₁₋₆ y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alcoxi-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo, hidroxil-alquiloC₁₋₆, alcoxi, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆; en donde dicho alquiloC₁₋₆, alquenoC₂₋₆, alcoxi-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, alcoxiC₁₋₆carbonilo, hidroxil-alquiloC₁₋₆, alcoxi, cicloalquiloC₃₋₆, cicloalquiloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆, alquiloC₁₋₆carbonilo, heterocicliloC₃₋₆ y heterocicliloC₃₋₆-alquiloC₁₋₆ usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, ciano, nitro, alcoxiC₁₋₆, alquiloC₁₋₆ e hidroxil;

con una condición que cuando $n=0$ entonces R^4 no es tiazolil o 5-cloropiridinil;

con una condición adicional que cuando R^2 es fenilo entonces $n=0$ y R^4 no es metilo sustituido, alquilo C₃ o alquilo C₄ no sustituido; y

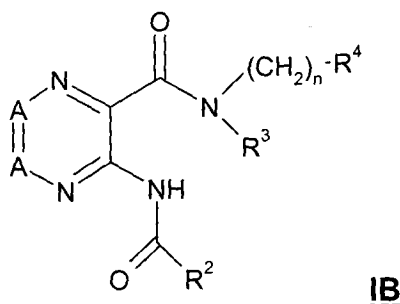
con una condición adicional que dicho compuesto de formula I no es ninguno de

- 3-(benzoilamino)-N-bencilpiridina-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-piridin-3-ilpiridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-fenilpiridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-(3-nitrofenil)piridin-2-carboxamida;
- 3-(benzoilamino)-N-(4-metoxifenil)piridin-2-carboxamida;

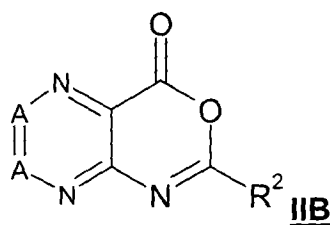
4/6
113

3-(benzoilamino)-*N*-[4-(dimetilamino)fenil]piridin-2-carboxamida;
N-(2-hidroxietil)-4-(2-naftoilamino)nicotinamida;
 4-(benzoilamino)-*N*-(2-hidroxietil)nicotinamida;
 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-*N*-fenilisonicotinamida;
 3-(benzoilamino)-2,6-dimetil-*N*-(3-nitrofenil)isonicotinamida;
 2-(benzoilamino)-*N*-[ciano(2-tienil)metil]nicotinamida; y
 2-(benzoilamino)-*N*-[ciano(fenil)metil]nicotinamida.

19. Un método para preparar un compuesto de formula IB,



que comprende el paso de hacer reaccionar un compuesto de formula IIB,



con un compuesto de $R^3(CH_2)_nR^4NH$, en la presencia de una base, tal como DIPEA, un solvente tal como DMF,

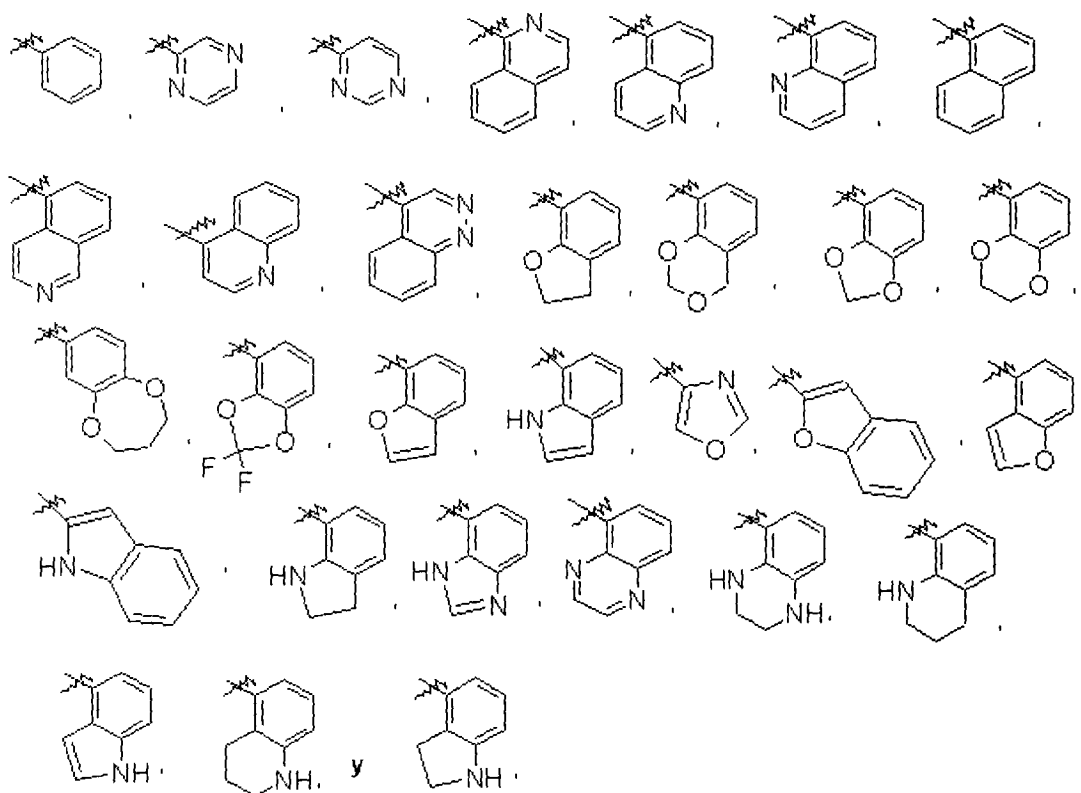
en donde:

A es cada uno ondependientemente CR^1 ; y

R^1 se selecciona independientemente de hidrógeno, halógeno, ciano, amino, acetilamino, hidroxilo, alcoxi, alquilo, alcoxi halogenado, alquileo, alquilo halogenado, alqueno halogenado y NR^5R^6 ;

R^2 se selecciona de

917
414



en donde dicho grupo usado para definir R^2 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alcoxi halogenado, ciano, nitro, alcoxi, hidroxí, hidroxí-alquilo, amino, alquilo-arilo, alcoxi, alcoxi-alquilo, alquilocarbonil, alcoxycarbonil, alquilamino, amino-alquilo, alquilo-amino-carbonil, heteroarilo-carbonil, heterociclilo-carbonil, arilocarbonil, heterociclilo, cicloalquilo, heteroarilo, heteroariloalquilo-, arilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$;

R^3 se selecciona de hidrógeno y alquilo;

R^4 se selecciona de alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo; en donde dicho alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, alcoxi, arilo, heteroarilo y heterociclilo usado para definir R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, alquilocarbonil, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxí, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxí-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo-alquilo y $-NR^5R^6$; y

n se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4 y 5; o

418
415

R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un grupo seleccionado de heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos; en donde dicho heterociclilo que está opcionalmente fusionado a un anillo de cinco o seis miembros que contiene uno o más heteroátomos usado para definir R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados de halógeno, alquilo halogenado, alquilo, ciano, nitro, amino, amino-alquilo, alcoxi, alcoxi halogenado, hidroxil, alcoxi-alquilo, alcoxi-arilo, alcoxi-carbonil, mitad heterocíclica, arilo, arilo-alquilo, heterocíclico-alquilo, hidroxil-alquilo, heteroarilo, alquilo-heteroarilo, arilo- C_{1-6} alquilo y $-NR^5R^6$,

en donde cada uno de R^5 y R^6 se selecciona independientemente de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} ; en donde dicho alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alcoxialquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, alcoxi C_{1-6} carbonilo, hidroxialquilo C_{1-6} , alcoxi, cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} carbonilo, heterociclilo C_{3-6} y heterociclilo C_{3-6} -alquilo C_{1-6} usados para definir R^5 y R^6 están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados de halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_{1-6} , alquilo C_{1-6} e hidroxil;

con una condición que dicho compuesto de formula IB no es ninguno de 3-[(4-ter-butilbenzoil)amino]-N-(5-cloro-piridin-2-il)pirazin-2-carboxamida; N-[2-(1H-imidazol-2-il)etil]-3-[[4-(1,1-dimetiletil)benzoil]amino]-2-pirazincarboxamida y 3-(benzoilamino)-N-(metoxicarbonilmetil)pirazin-2-carboxamida.

479
4/6

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 419

2020
Bogotá D.C.,

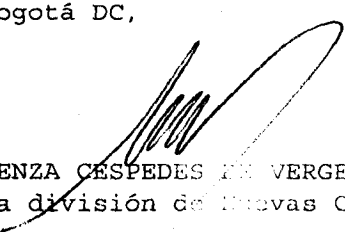
Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA AB

REFERENCIA	Radicación No.	06 120181
	Solicitud internacional	PCT/SE2005/000753
	Fecha inicio fase nacional	25/12/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	4276
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

18 OCT 2007


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa10

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-120181

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**
FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **582** DE
FECHA **30 DE NOVIEMBRE DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA
LEY EXPIRA EL **27 DE FEBRERO DE 2008**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____ NO X