

LLORED A & CIA. S. A.

ABOGADOS

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-081299- -00001-0000

Fecha: 2007-09-26 16:42 09 Dep 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve 378 FASENACIONALI
Act 329 CTOINFORMACION Folios 19

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION 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
jllico@lloredacamacho.com

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE 2-PIRIDINA COMO INHIBIDORES DE LA ELASTASA NEUTROFILA".-Clase A61K 31/4412 Y C07D 213/82.-Expediente número 07-081.299.-

1. Me refiero a la solicitud radicada ante ese Despacho el 09 de Agosto de 2007, cuyo numero se encuentra arriba mencionado.

2. Debidamente autorizado por mí representado, y siguiendo los lineamientos de la respuesta emitida por ese Despacho al Derecho de Petición cuyo numero de radicación es 07-089.021, me permito allegar el capitulo 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 el solicitante realizó al capitulo 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. Anexos me permito presentar:

- (a) Recibo No. 07-77,017, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (b) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (c) Copia de capitulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado en fase internacional; y
- (D) Documento que acredita el traspaso que los autores del invento de la referencia hacen a favor de **ASTRAZENECA AB**, de sus derechos sobre el mismo, debidamente apostillado.

LLOREDA & CIA. S. A.

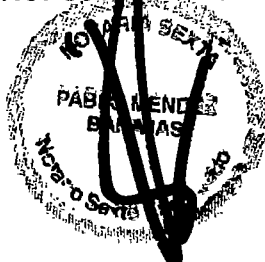
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. 25 SEP 2007
Ante mi PABLO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE
BOGOTÁ
Comparecieron: *Alicia Lloreda Ricaurte*
Ficaurte
quien (es) exhibió(n) C.C. 39.690.713
y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparece(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(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 A.B**

Dirección: SE-151 85 Södertälje, Suecia.

Lugar de Constitución: 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 LLORED RICAURTE**

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

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____ TP 53.215

④

Número de expediente:

07-081.299

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada Modificaciones voluntarias que el Solicitante
realizó al Capítulo reivindicatorio presentado en fase internacional.

⑥

Comprobante de pago No. 07-77,017

Fecha 24 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 LLORED RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

150
148

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-081299-00001-0000

NIT : 8001

Fecha 2007-09-26 16:42:09 Dep 2020 NUECREACIONE
Tra 11 PATENTEY... Eve. 378 FASENACIONALI
Act 329 CTO:INFORMACION Fojos. 19

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 77,017
FECHA : SEPTIEMBRE 24 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999506	24/09/2007	2,772,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	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

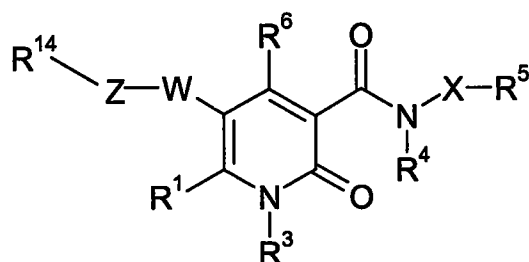
SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula (I)



(I)

en donde

R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

W representa S(O)_m en donde m representa un entero 0, 1 o 2;

Z representa un enlace sencillo, -CH₂- o -NR²⁵-;

R¹⁴ representa un átomo de hidrógeno u OH o un grupo seleccionado de alquilo C₁-C₆ y un sistema de anillo de 3 a 10 miembros saturado o insaturado que comprende opcionalmente al menos un heteroátomo de anillo seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre; estando cada grupo opcionalmente sustituido con al menos un sustituyente seleccionado de fenilo, alcóxicarbonilo C₁-C₆, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, CN, OH, NO₂, alquilo C₁-C₃ sustituido por uno o más átomos de F, alcoxi C₁-C₃ sustituido por uno o más átomos de F, NR¹²R¹³, C≡CR³⁰, CONR³¹R³², CHO, C₂-C₄ alcanoilo, S(O)_pR³³ y OSO₂R³⁴;

R¹² y R¹³ representan independientemente H, alquilo C₁-C₆, formilo o alcanoilo C₂-C₆; o el grupo -NR¹²R¹³ junto representa un anillo azacíclico de 5 a 7 miembros que incorpora opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y NR²⁶;

R³⁰ representa H, alquilo C₁-C₃, Si(CH₃)₃ o fenilo;

R³³ y R³⁴ representan independientemente H o alquilo C₁-C₃; estando dicho alquilo opcionalmente sustituido por uno o más átomos de F;

R^6 representa H o F;

R^3 representa fenilo o un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros que contiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados independientemente de O, S y N; estando dicho anillo opcionalmente sustituido con al menos un sustituyente seleccionado de halógeno, alquilo C_1-C_6 , ciano, alcoxi C_1-C_6 , nitro, metilcarbonilo, $NR^{35}R^{36}$, alquilo C_1-C_3 sustituido por uno o más átomos de F o alcoxi C_1-C_3 sustituido por uno o más átomos de F;

10

R^{35} y R^{36} representan independientemente H o alquilo C_1-C_3 ; estando dicho alquilo opcionalmente adicionalmente sustituido por uno o más átomos de F;

R^4 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con al menos un sustituyente seleccionado de fluoro, hidroxilo y alcoxi C_1-C_6 ;

15

X representa un enlace sencillo, O, NR^{24} o un grupo $-alquileo\ C_1-C_6-Y-$, en donde Y representa un enlace sencillo, átomo de oxígeno, NR^{24} o $S(O)_w$; y estando dicho alquileo opcionalmente adicionalmente sustituido por OH, halógeno, CN, $NR^{37}R^{38}$, alcoxi C_1-C_3 , $CONR^{39}R^{40}$, SO_2R^{41} y $SO_2NR^{42}R^{43}$;

20

o R^4 y X están unidos juntos de forma que el grupo $-NR^4X$ junto representa un anillo azacíclico de 5 a 7 miembros que incorpora opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y NR^{44} ; estando dicho anillo opcionalmente sustituido por alquilo C_1-C_6 o $NR^{45}R^{46}$; estando dicho alquilo opcionalmente adicionalmente sustituido por OH;

25

ya sea R^5 representa un sistema de anillo monocíclico seleccionado de

- 30 i) fenoxi,
ii) fenilo,
iii) un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que comprende al menos un heteroátomo de anillo seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre,
iv) un anillo hidrocarbilo C_3-C_6 saturado o parcialmente insaturado, o
35 v) un anillo de 4 a 7 miembros saturado o parcialmente insaturado que comprende al menos un heteroátomo de anillo seleccionado de oxígeno,

$S(O)_r$ y NR^{20} , en donde al menos uno de los átomos de carbono del anillo puede ser opcionalmente reemplazado por un grupo carbonilo,

o R^5 representa un sistema de anillo bicíclico en el cual los dos anillos son seleccionados independientemente de los sistemas de anillo monocíclicos definidos en ii), iii), iv) y v) anteriores, en donde los dos anillos están fusionados juntos, unidos directamente uno al otro o están separados uno del otro por un grupo enlazante seleccionado de oxígeno, $S(O)_t$ o alquileo C_1-C_6 que comprende opcionalmente uno o más heteroátomos internos o terminales seleccionados de oxígeno, azufre y NR^{27} y que están opcionalmente sustituidos por al menos un sustituyente seleccionado de hidroxilo, oxo y alcoxi C_1-C_6 ,

estando el sistema de anillo monocíclico o bicíclico opcionalmente sustituido por al menos un sustituyente seleccionado de oxígeno, CN, OH, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , halógeno, $NR^{47}R^{48}$, NO_2 , OSO_2R^{49} , CO_2R^{50} , $C(=NH)NH_2$, $C(O)NR^{51}R^{52}$, $C(S)NR^{53}R^{54}$, $SC(=NH)NH_2$, $NR^{55}C(=NH)NH_2$, $S(O)_vR^{21}$, $SO_2NR^{56}R^{57}$, C_1-C_3 alcoxi sustituido por uno o más átomos de F y alquilo C_1-C_3 sustituido por SO_2R^{58} o por uno o más átomos de F; estando dicho alquilo C_1-C_6 opcionalmente adicionalmente sustituido con al menos un sustituyente seleccionado de ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 y $-C(O)NR^{22}R^{23}$;

o R^5 también puede representar H;

R^{20} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 o alcoxycarbonilo C_1-C_6 ;

R^{21} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_8 ; estando dicho grupo alquilo o cicloalquilo opcionalmente adicionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de OH, CN, alcoxi C_1-C_3 y $CONR^{59}R^{60}$;

R^{37} y R^{38} representan independientemente H, alquilo C_1-C_6 , formilo o alcanilo C_2-C_6 ;

R^{47} y R^{48} representan independientemente H, alquilo C_1-C_6 , formilo, alcanilo C_2-C_6 , $S(O)_qR^{61}$ o $SO_2NR^{62}R^{63}$; estando dicho grupo alquilo

opcionalmente adicionalmente sustituido por halógeno, CN, alcoxi C₁-C₄ o CONR⁶⁴R⁶⁵;

R⁴¹ y R⁶¹ representan independientemente H, alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆;

p es 0, 1 o 2;

q es 0, 1 o 2;

r es 0, 1 o 2;

t es 0, 1 o 2;

w es 0, 1 o 2;

v es 0, 1 o 2;

R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R³¹, R³², R³⁹, R⁴⁰, R⁴², R⁴³, R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶, R⁴⁹, R⁵⁰, R⁵¹, R⁵², R⁵³, R⁵⁴, R⁵⁵, R⁵⁶, R⁵⁷, R⁵⁸, R⁵⁹, R⁶⁰, R⁶², R⁶³, R⁶⁴ y R⁶⁵ cada uno representan independientemente hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R¹⁴ representa fenilo opcionalmente sustituido por uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de CN, F, Cl, Br, CF₃, NO₂ y C≡CH.

3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o Reivindicación 2, en donde Z representa un enlace sencillo.

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, en donde R³ representa un grupo fenilo sustituido con un sustituyente trifluorometilo.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, en donde R⁵ representa fenilo o piridinilo sustituido por -S(O)_vR²¹ en donde v representa el entero 2.

6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, en donde R⁵ representa H.

7. Un compuesto de formula (I) como se definió en la Reivindicación 1 seleccionado de:

- N*-ciclopropil-5-[(4-metoxifenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5 2-oxo-*N*-[3-(2-oxopirrolidin-1-il)propil]-5-(fenilsulfinil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-bromofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 10 5-[(2,4-dimetoxibencil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-ciclopropil-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- N*-{[5-(ciclopropilsulfonil)piridin-2-il]metil}-2-oxo-5-(fenilsulfinil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 15 6-metil-5-(metilsulfinil)-*N*-{[5-(metilsulfonil)piridin-2-il]metil}-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- N*-ciclopropil-5-[(3-metoxifenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 20 *N*-ciclopropil-5-[(2-metoxifenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-[(2*S*)-2-hidroxiopropil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 25 3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(2-cianoetil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 30 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-ciclopropil-1-(3,5-difluorofenil)-6-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-{[5-(etilsulfonil)piridin-2-il]metil}-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-difluorofenil)-*N*-{[5-(etilsulfonil)piridin-2-il]metil}-6-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 35 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-diclorofenil)-*N*-{[5-(etilsulfonil)piridin-2-il]metil}-6-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;

- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-diclorofenil)-*N*,6-dimetil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-difluorofenil)-*N*-[2-(1*H*-imidazol-4-il)etil]-6-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-difluorofenil)-6-metil-*N*-(2-morfolin-4-iletil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-1-(3,5-difluorofenil)-*N*,6-dimetil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 10 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- N*-ciclopropil-5-[(4-hidroxifenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 15 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-[3-(1*H*-imidazol-1-il)propil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-*N*-[3-(1*H*-1,2,3-triazol-1-il)propil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-[(1-hidroxiciclopropil)metil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 20 1-(3-cianofenil)-5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[[5-(metilsulfonil)piridin-2-il]metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-metoxietil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 25 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-hidroxil-2-metilpropil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-clorofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-5-[(4-metilfenil)sulfinil]-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 30 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-5-[(4-nitrofenil)sulfinil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-5-[[4-(trifluorometil)fenil]sulfinil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 35 5-[[4-(acetilamino)fenil]sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;

- 5-[(4-etilfenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonyl)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-fluorofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonyl)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-1-(3-metilfenil)-*N*-[[5-(metilsulfonyl)piridin-2-il]metil]-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-etil-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-clorofenil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 10 *N*-etil-5-[(4-fluorofenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-fluorofenil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 15 5-[(4-bromofenil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-hidroxi-etil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(ciclopropilmetil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 20 *N*-metil-2-oxo-5-(fenilsulfinil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- N*-(cianometil)-5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 25 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-[2-(1*H*-imidazol-4-il)etil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-hidroxi-propil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-*N*-(2-morfolin-4-iletal)-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 30 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-hidroxi-1,1-dimetiletal)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 35 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-[(2*R*)-2-hidroxi-propil]-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;

- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-6-metil-2-oxo-*N*-[3-(2-oxopirrolidin-1-il)propil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfinil]-*N*-(2-metoxipropil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5 6-metil-5-(metilsulfonil)-*N*-[[5-(metilsulfonil)piridin-2-il]metil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 2-oxo-*N*-[3-(2-oxopirrolidin-1-il)propil]-5-(fenilsulfonil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfonil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-
- 10 dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[[4-(acetilamino)fenil]sulfonil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-etilfenil)sulfonil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 15 5-[(4-cianofenil)sulfonil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(4-cianofenil)sulfonil]-*N*-(2-hidroxi-1,1-dimetiletil)-6-metil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- N*-[(3-ciclopropilisoxazol-5-il)metil]-6-metil-5-(metilsulfonil)-2-oxo-1-[3-
- 20 (trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(6-cianopiridin-3-il)sulfonil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-5-({4-[(trimetilsilil)ethinil]fenil}sulfinil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 25 5-[(4-etinilfenil)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-[[4-(feniletinil)fenil]sulfinil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-[(4-prop-1-in-1-ilfenil)sulfinil]-1-[3-
- 30 (trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(5-cianopiridin-2-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-({2-metil-5-(metilcarbamoil)-6-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,6-dihidropiridin-3-il}sulfinil)nicotinamida;
- 35 5-[(5-cloropiridin-2-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;

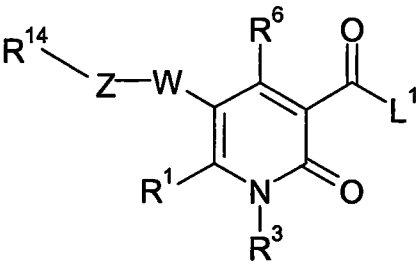
- 5-[(5-bromopiridin-2-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(5-cianopiridin-2-il)sulfinil]-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5 5-[(5-bromopirimidin-2-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(6-bromopiridazin-3-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-[(6-cianopiridin-3-il)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 10 5-[(5-ciano-2-tienil)sulfinil]-*N*,6-dimetil-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-(1*H*-imidazol-2-ilsulfinil)-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 15 6-metil-5-[(metilamino)sulfonil]-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 5-(anilinosulfonil)-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-5-[(2-morfolin-4-iletil)amino]sulfonil}-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 20 5-[(2-cianoetil)(metil)amino]sulfonil}-6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-5-[(6-morfolin-4-ilpiridin-3-il)amino]sulfonil}-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 25 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-5-(morfolin-4-ilsulfonil)-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-[(piridin-3-ilamino)sulfonil]-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- Ácido 2-metil-5-([4-(metilsulfonil)bencil]amino)carbonil}-6-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,6-dihidropiridin-3-sulfónico;
- 30 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-(feniltio)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-(fenilsulfinil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
- 35 6-metil-*N*-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-5-(fenilsulfonil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;

- 6-metil-5-(metilsulfinil)-N-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-
1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
6-metil-5-(metilsulfonil)-N-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-
1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
5 5-(bencilsulfinil)-6-metil-N-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-
1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
5-(etilsulfinil)-6-metil-N-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-(trifluorometil)fenil]-
1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
Metil 3-({2-metil-5-({[4-(metilsulfonil)bencil]amino}carbonil)-6-oxo-1-[3-
10 (trifluorometil)fenil]-1,6-dihidropiridin-3-il}sulfinil)propanoato;
5-(ciclohexilsulfinil)-6-metil-N-[4-(metilsulfonil)bencil]-2-oxo-1-[3-
(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
5-(ciclopropilsulfonil)-N-[4-(ciclopropilsulfonil)bencil]-6-metil-2-oxo-1-[3-
(trifluorometil)fenil]-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida;
15 Y sales farmacéuticamente aceptables de uno cualquiera de los mismos.

8. Un proceso para la preparación de un compuesto de formula (I) o una sal
farmacéuticamente aceptable del mismo como se definió en la reivindicación 1,
que comprende,

20

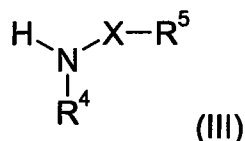
(a) la reacción de un compuesto de formula (II)



(II)

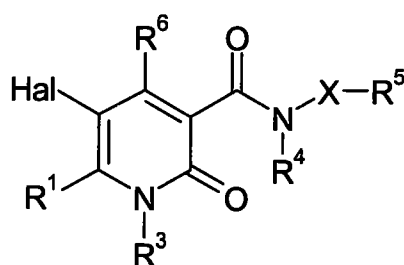
25 en donde L¹ representa un grupo saliente (tal como halógeno o hidroxilo) y R¹, R³,
R⁶, R¹⁴, W y Z son como se definieron en la formula (I),

con un compuesto de formula



en donde X, R⁴ y R⁵ son como se definieron en la formula (I); o

- 5 (b) cuando W representa -S- y Z representa un enlace sencillo o -CH₂-, la reacción de un compuesto de formula (IV)



(IV)

- 10 en donde Hal representa un átomo de halógeno y X, R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se definieron en la formula (I),

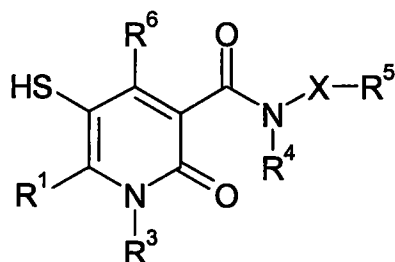
con un nucleófilo R¹⁴-Z-S-M en donde R¹⁴ y Z son como se definieron en la formula (I) y M representa un grupo organo-estaño o ácido organo borónico; o

15

- (c) cuando W representa -S- y Z representa un enlace sencillo o -CH₂-, la reacción de un compuesto de formula (IV) en donde Hal representa un átomo de halógeno y X, R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se definieron en la formula (I),

- 20 con un tiol R¹⁴-Z-S-H en donde R¹⁴ y Z son como se definieron en la formula (I) en la presencia de una sal de cobre (I); o

- (d) cuando W representa -S- y Z representa un enlace sencillo o -CH₂-, la reacción de un compuesto de formula (V)



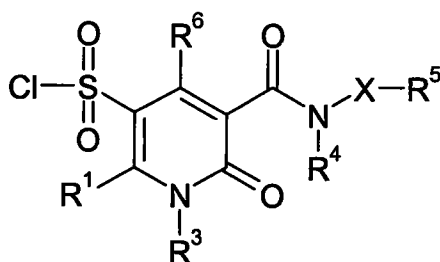
(V)

en donde X, R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se definieron en la formula (I),

- 5 con un electrófilo R¹⁴-Z-L² en donde L² representa un grupo saliente tal como halógeno y R¹⁴ y Z son como se definieron en la formula (I); o

(e) cuando W representa -SO₂- y Z representa -NR²⁵-, la reacción de un compuesto de formula (VI)

10



(VI)

en donde X, R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se definieron en la formula (I),

- 15 con una amina R¹⁴-NHR²⁵ en donde R¹⁴ y R²⁵ son como se definieron en la formula (I); o

(f) cuando W representa un grupo sulfinilo (-S(O) -) o un grupo sulfonilo (-S(O)₂-), oxidar el compuesto correspondiente, en donde W representa un
20 grupo tio (-S -);

y opcionalmente después de (a), (b), (c), (d), (e) o (f) realizar uno o más de los siguientes:

- 25 • convertir el compuesto obtenido a un compuesto adicional de la invención

póvil

comp

comp

- formar una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto.

9. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de formula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como se reivindicó en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en asociación con un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

10. Un proceso para la preparación de una composición farmacéutica como se reivindicó en la reivindicación 9 que comprende mezclar un compuesto de formula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como se reivindicó en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 con un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.