

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.
ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6060700 Fax: 6060704

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077067-00002-0000

Fecha: 2008-06-16 16:18:54 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 21

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077067-00002-0000

Fecha: 2008-06-16 16:18:54 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICIÓN Folios: 21

Re: P1. ARENA PHARMACEUTICALS, INC.-Solicitud de Patente de
Invencción en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DEL
PIRIMIDINIL Y PIRIDINIL SUSTITUIDOS COMO
MODULADORES DEL METABOLISMO Y EL TRATAMIENTO DE
DESÓRDENES RELACIONADOS CON EL MISMO".-Clase C07D
401/14.-Expediente número 07-077.067.-

1. Me refiero a mi memorial de 26 de Septiembre de 2007.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número **583** de 18 de Diciembre de 2007, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. De otro modo, me permito manifestar que es deseo del solicitante presentar, en forma voluntaria, un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al originalmente presentado, que consta de 62 reivindicaciones en las que se han realizado los siguientes modificaciones al capítulo reivindicatorio que se describen a continuación:
 - Las reivindicaciones 11, 19, 23, 25, 42, 53 a 57 y 59 a 72 fueron canceladas.
 - Se agregaron las nuevas reivindicaciones 53, 57, 59 y 61 correspondientes a realizaciones particulares de la presente solicitud, cuyo sustento se encuentra a lo largo de la descripción.

3/8/86
3.166

- De acuerdo con las cancelaciones descritas anteriormente, las reivindicaciones restantes fueron reenumeradas y sus dependencias también corregidas de conformidad con este hecho.
- El lenguaje fue modificado con el fin de proporcionar mayor claridad sobre el objeto de las reivindicaciones objeto de modificación.
- Las reivindicaciones fueron adicionalmente modificadas para proteger no solo los compuestos enunciados sino también las sales, solvatos, e hidratos farmacéuticamente aceptables de los mismos, tal como se establece en la descripción de la invención.

De manera especial, me permito manifestar al señor Examinador que la anterior modificación **no amplía** de ninguna manera el alcance de la invención tal como fue presentada originalmente, toda vez que la misma solamente obedece a aclarar y limitar aún más el alcance del capítulo reivindicatorio.

4. Anexo me permito presentar:

- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (b) Recibo número 08-44.781, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas;
- (c) Recibo número 08-45.195, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa; y
- (d) Copia del nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza al presentado originalmente con mi solicitud de patente y en el cual se han realizado las modificaciones expuestas anteriormente.

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

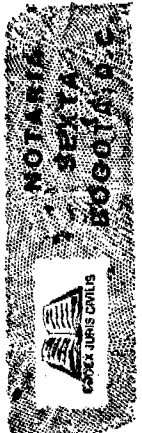
Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

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

Señor Superintendente,

Alicia Lloreda Ricaurte
ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215



NOTARIA S E X T A DE BOGOT A
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. **06 JUN 2008**
Ante mi **PABLO MENDEZ BARRIAS**
NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE
BOGOT A
Comparecieron: *Alicia Lloreda Ricaurte*
quien (es) exhibió(eron) C.C. **39.690.713**
55215
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
ALICIA LLORED A RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una Solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: **ARENA PHARMACEUTICALS, INC.**,
sociedad existente y organizada de conformidad con
las leyes del Estado de Delaware, USA.

Dirección: 6166 Nancy Ridge Drive San Diego,
California 92121, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: San Diego, Estado de California, USA.

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

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

Teléfono: 3 264270

Fax: 2 126426

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

07-077.067

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificaciones voluntarias al capítulo
reivindicatorio.

⑥

Comprobante de pago No. 08 - 44.781

Fecha 05-06-2008

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

347
368
369

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 44,781
FECHA : JUNIO 5 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077067- -00002-0000

Fecha: 2008-06-16 16:18:54 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 21

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2756091	05/06/2008	6,040,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEVAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

SOM: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

369
370
371

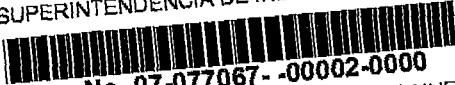
369
370
371

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 45,195
FECHA : JUNIO 6 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077067- -00002-0000

Fecha: 2008-06-16 16:18:54 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 21

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2756088	06/06/2008	8,815,200.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILID	210,000.00
		TOTAL :	\$ 210,000.00

SON: DOSCIENTOS DIEZ MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

371
372

"m", "n" y "q" son cada uno independientemente 0, 1, 2 o 3;

"r" es 0, 1 o 2; y "t" es 0 o 1;

R₆ es H o halógeno; y

R₇ es H o C₁₋₄ alquilo.

5

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde X es N.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde X es CR₈.

10

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde R₈ es H o F.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde Y es NH.

15

6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde Y es O.

7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde Z es CH.

20

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde Z es N.

25

9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R₁ es carbo-C₁₋₆-alcoxi opcionalmente sustituido con C₃₋₅ cicloalquilo.

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R₁ es seleccionado de C(O)OCH₂CH₃, C(O)OCH(CH₃)₂, C(O)OCH(CH₃)(CH₂CH₃), C(O)OCH₂-ciclopropilo y C(O)OCH(CH₃)(ciclopropilo).

30

11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R₁ es oxadiazolilo opcionalmente sustituido con un grupo C₁₋₄ alquilo.

347
378
373

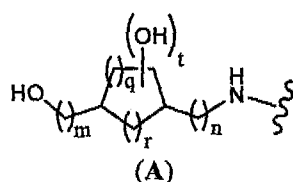
12. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R_1 es 5-isopropil-[1,2,4]oxadiazol-3-ilo.
- 5 13. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R_1 es pirimidinilo opcionalmente sustituido con un grupo C_{1-4} alcoxi.
14. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde R_1 es 5-metoxi-pirimidin-2-ilo.
- 10 15. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 donde R_2 es H.
16. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 donde R_2 es CH_3 .
- 15 17. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 donde R_3 es C_{1-4} alcoxi.
18. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 donde R_3 es OCH_3 u OCH_2CH_3 .
- 20 19. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 donde R_3 es OH u $O-C\equiv CH$.
- 25 20. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 donde R_4 es seleccionado de H, OCH_3 , CH_3 , CH_2CH_3 , F, Cl y $C\equiv CH$.
- 30 21. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 donde R_5 es seleccionado de: $OCH_2CH_2CH_3$, $OCH_2CH_2CH_2OH$, $S(O)_2CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $NHCH_2CH_2OH$, ciano, $CH_2CH_2OCH_3$, CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2CH(CH_3)OH$, $CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $S(O)_2NHC(O)CH_2CH_3$, CH_2CH_2O -ciclopropilo, $NHCH_2CH_2OCH_3$, $OCH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $NHCH_2CH(CH_3)OH$, $CH_2CH_2CH_2OH$, $CH_2CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $NHCH_2CH(CH_3)S(O)_2CH_3$, $N(CH_3)CH_2CH(CH_3)S(O)_2CH_3$, 3-metanosulfonil-pirrolidin-1-ilo, 3-metanosulfonil-piperidin-1-ilo, $CH_2C(O)N(CH_3)_2$, 3-metanosulfonil-azetidin-1-ilo, $CH_2C(O)NHCH_2CH_2OH$, SCH_2CH_2OH , $S(O)_2CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $S(O)_2CH_2CH_3$,
- 35

348
373
374

NHCH₂CH(OH)CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₂OH, OCH₂CH₂OP(O)(OH)₂,
OCH₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂ y S(O)₂NH₂.

22. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 donde R₅ es seleccionado de OCH₂CH₂CH₂OH, S(O)₂CH₃, CH₂CH₂S(O)₂CH₃, NHCH₂CH₂OH, ciano, CH₂CH₂OH, CH₂CH₂CH(CH₃)OH, CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, S(O)₂NHC(O)CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₃, NHCH₂CH(OH)CH₂OH, amino, NHCH₂CH₃, NHCH(CH₃)₂ y NHCH(CH₃)CH₂CH₃.

23. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 donde R₅ es un grupo de la Fórmula (A):



donde "m", "n" y "q" son cada uno independientemente 0, 1, 2 o 3;

"r" es 0, 1 o 2; y

"t" es 0 o 1.

24. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 23 donde "m" y "n" son cada uno independientemente 0 o 1.

25. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 23 o 24 donde "q" es 0 o 1 y "r" es 1 o 2.

26. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 donde R₆ es H.

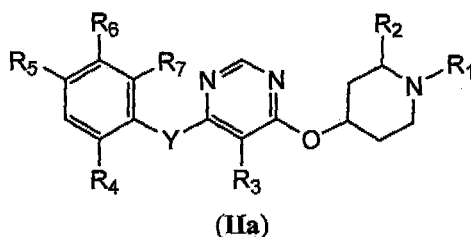
27. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 donde R₆ es F.

28. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 donde R₇ es H.

319
324
325

29. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 donde R_7 es CH_3 .

30. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (IIa), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:



donde:

Y es NH u O;

R_1 es carbo- C_{1-6} -alcoxi opcionalmente sustituido con C_{3-5} cicloalquilo;

R_2 es H o CH_3 ;

R_3 es C_{1-4} alcoxi;

R_4 es seleccionado de H, OCH_3 , CH_3 , CH_2CH_3 , F y Cl;

R_5 es seleccionado de:

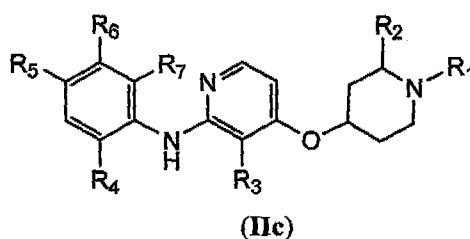
$\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$,
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, ciano, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$,
 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O-ciclopropilo}$,
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$,
 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$, $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$,
 $\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$, 3-metanosulfonil-pirrolidin-1-ilo, 3-metanosulfonil-
piperidin-1-ilo, $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, 3-metanosulfonil-azetidin-1-ilo,
 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$, $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$,
 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ y $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$;

R_6 es H o F; y

R_7 es H o CH_3 .

31. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (IIc), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:

375
376



donde:

R₁ es carbo-C₁₋₆-alcoxi opcionalmente sustituido con C₃₋₅ cicloalquilo;

R₂ es H o CH₃;

R₃ es C₁₋₄ alcoxi;

R₄ es seleccionado de: H, OCH₃, CH₃, CH₂CH₃, F y Cl;

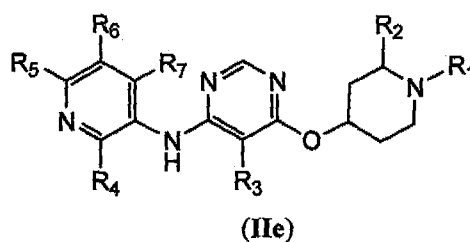
R₅ es seleccionado de:

OCH₂CH₂CH₃, OCH₂CH₂CH₂OH, S(O)₂CH₃, CH₂CH₂S(O)₂CH₃,
NHCH₂CH₂OH, ciano, CH₂CH₂OCH₃, CH₂CH₂OH, CH₂CH₂CH(CH₃)OH,
CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, S(O)₂NHC(O)CH₂CH₃, CH₂CH₂O-ciclopropilo,
NHCH₂CH₂OCH₃, OCH₂CH₂S(O)₂CH₃, NHCH₂CH(CH₃)OH, CH₂CH₂CH₂OH,
CH₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, NHCH₂CH(CH₃)S(O)₂CH₃,
N(CH₃)CH₂CH(CH₃)S(O)₂CH₃, 3-metanosulfonil-pirrolidin-1-ilo, 3-metanosulfonil-
piperidin-1-ilo, CH₂C(O)N(CH₃)₂, 3-metanosulfonil-azetidin-1-ilo,
CH₂C(O)NHCH₂CH₂OH, SCH₂CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, S(O)₂CH₂CH₃,
NHCH₂CH(OH)CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₂OH, OCH₂CH₂OP(O)(OH)₂,
OCH₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂ y S(O)₂NH₂;

R₆ es H o F; y

R₇ es H o CH₃.

32. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (IIe), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:



donde:

R₁ es carbo-C₁₋₆-alcoxi opcionalmente sustituido con C₃₋₅ cicloalquilo;

R₂ es H o CH₃;

354
326
377

R_3 es C_{1-4} alcoxi;

R_4 es seleccionado de H, OCH_3 , CH_3 , CH_2CH_3 , F y Cl;

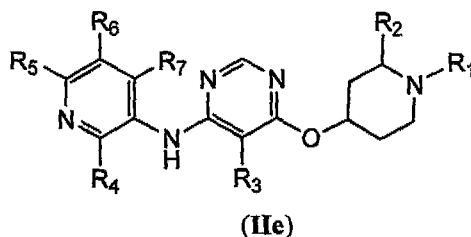
R_5 es seleccionado de:

$OCH_2CH_2CH_3$, $OCH_2CH_2CH_2OH$, $S(O)_2CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$,
 5 $NHCH_2CH_2OH$, ciano, $CH_2CH_2OCH_3$, CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2CH(CH_3)OH$,
 $CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $S(O)_2NHC(O)CH_2CH_3$, CH_2CH_2O -ciclopropilo,
 $NHCH_2CH_2OCH_3$, $OCH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $NHCH_2CH(CH_3)OH$, $CH_2CH_2CH_2OH$,
 $CH_2CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $NHCH_2CH(CH_3)S(O)_2CH_3$,
 $N(CH_3)CH_2CH(CH_3)S(O)_2CH_3$, 3-metanosulfonil-pirrolidin-1-ilo, 3-metanosulfonil-
 10 piperidin-1-ilo, $CH_2C(O)N(CH_3)_2$, 3-metanosulfonil-azetidin-1-ilo,
 $CH_2C(O)NHCH_2CH_2OH$, SCH_2CH_2OH , $S(O)_2CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $S(O)_2CH_2CH_3$,
 $NHCH_2CH(OH)CH_2OH$, $S(O)_2CH_2CH_2OH$, $OCH_2CH_2OP(O)(OH)_2$,
 $OCH_2CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$ y $S(O)_2NH_2$;

R_6 es H o F; y

R_7 es H o CH_3 .

33. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (IIe), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:



donde:

R_1 es carbo- C_{1-6} -alcoxi opcionalmente sustituido con C_{3-5} cicloalquilo;

R_2 es H o CH_3 ;

R_3 es C_{1-4} alcoxi;

R_4 es seleccionado de: H, OCH_3 , CH_3 , CH_2CH_3 , F y Cl;

R_5 es seleccionado de:

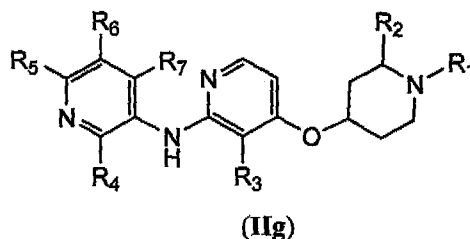
$OCH_2CH_2CH_2OH$, $S(O)_2CH_3$, $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, $NHCH_2CH_2OH$, ciano,
 CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2CH(CH_3)OH$, $CH_2CH_2OP(O)(OH)_2$, $S(O)_2NHC(O)CH_2CH_3$,
 $CH_2CH_2CH_2OH$, $S(O)_2CH_2CH_3$, $NHCH_2CH(OH)CH_2OH$ y $S(O)_2NH_2$;

R_6 es H o F; y

R_7 es H o CH_3 .

377
378

34. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (IIg), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:



donde:

R₁ es carbo-C₁₋₆-alcoxi opcionalmente sustituido con C₃₋₅ cicloalquilo;

R₂ es H o CH₃;

R₃ es C₁₋₄ alcoxi;

R₄ es seleccionado de: H, OCH₃, CH₃, CH₂CH₃, F y Cl;

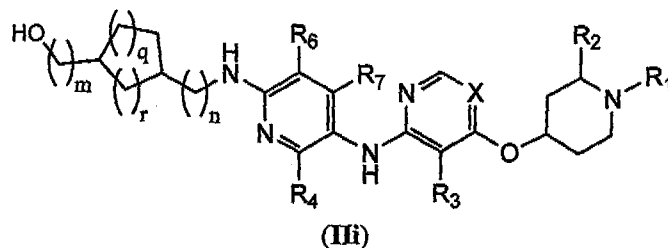
R₅ es seleccionado de:

OCH₂CH₂CH₃, OCH₂CH₂CH₂OH, S(O)₂CH₃, CH₂CH₂S(O)₂CH₃,
NHCH₂CH₂OH, ciano, CH₂CH₂OCH₃, CH₂CH₂OH, CH₂CH₂CH(CH₃)OH,
CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, S(O)₂NHC(O)CH₂CH₃, CH₂CH₂O-ciclopropilo,
NHCH₂CH₂OCH₃, OCH₂CH₂S(O)₂CH₃, NHCH₂CH(CH₃)OH, CH₂CH₂CH₂OH,
CH₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, NHCH₂CH(CH₃)S(O)₂CH₃,
N(CH₃)CH₂CH(CH₃)S(O)₂CH₃, 3-metanosulfonyl-pirrolidin-1-ilo, 3-metanosulfonyl-
piperidin-1-ilo, CH₂C(O)N(CH₃)₂, 3-metanosulfonyl-azetidin-1-ilo,
CH₂C(O)NHCH₂CH₂OH, SCH₂CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂, S(O)₂CH₂CH₃,
NHCH₂CH(OH)CH₂OH, S(O)₂CH₂CH₂OH, OCH₂CH₂OP(O)(OH)₂,
OCH₂CH₂CH₂OP(O)(OH)₂ y S(O)₂NH₂;

R₆ es H o F; y

R₇ es H o CH₃.

35. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de compuestos que tienen la Fórmula (III), y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:



donde:

357
378
379

"m" y "n" son cada uno independientemente 0 o 1;

"q" es 0 o 1;

"r" es 1 o 2;

X es N u O;

5 R₁ es carbo-C₁₋₆-alcoxi opcionalmente sustituido con C₃₋₅ cicloalquilo;

R₂ es H o CH₃;

R₃ es C₁₋₄ alcoxi;

R₄ es seleccionado de: H, OCH₃, CH₃, CH₂CH₃, F y Cl;

R₆ es H o F; y

10 R₇ es H o CH₃.

36. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de los siguientes compuestos y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:

15 isopropil éster del ácido 4-[6-(4-Metanosulfonil-2-metoxi-fenilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{5-Metoxi-6-[6-(2-metoxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

1-ciclopropil-etil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

20 isopropil éster del ácido 4-[6-(2-Fluoro-4-metanosulfonil-fenilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[6-(4-Ciano-2-fluoro-fenilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

25 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Hidroxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{5-Metoxi-6-[6-(2-metoxi-etilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

30 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-etoxi)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Hidroxi-propilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

35 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(3-Hidroxi-propil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico

38A
379
380

isopropil éster del ácido 4-{5-metoxi-6-[2-metil-6-(3-fosfonooxi-propil)-piridin-3-ilamino]-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-etilamino)-2-metoxi-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

5 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-propilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[6-(6-Dimetilcarbamoilmetil-2-metil-piridin-3-ilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

10 isopropil éster del ácido 4-(6-{2-Fluoro-4-[(2-hidroxi-etilcarbamoil)-metil]-fenilamino}-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi)-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Metanosulfonil-etilamino)-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[2-Fluoro-4-(2-hidroxi-etilsulfanil)-fenilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

15 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2,3-Dihidroxi-propilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2,3-Dihidroxi-propilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

20 isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-Hidroxi-etoxi)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{5-Metoxi-6-[2-metil-6-(2-fosfonooxi-etoxi)-piridin-3-ilamino]-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(3-Hidroxi-propoxi)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-ácido carboxílico; y

25 isopropil éster del ácido 4-{5-Metoxi-6-[2-metil-6-(3-fosfonooxi-propoxi)-piridin-3-ilamino]-pirimidin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

37. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de los siguientes compuestos y sales, solvatos e hidratos farmacéuticamente aceptables del mismo:

30 isopropil éster del ácido 4-[2-(2-Fluoro-4-propoxi-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Fluoro-4-(2-hidroxi-etil)-fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

35 isopropil éster del ácido 4-[5-Fluoro-2-(2-fluoro-4-metanosulfonil-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

271
380
381

isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Etil-4-(2-metanosulfonil-etil)-fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-2-metil-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{5-Fluoro-2-[6-(2-hidroxi-etoxi)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

5 isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Fluoro-4-(2-metanosulfonil-etil)-fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Hidroxi-etilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

10 isopropil éster del ácido 4-[2-(4-Ciano-2-fluoro-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[2-(2-Cloro-4-ciano-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Metanosulfonil-etil)-2-metoxi-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

15 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Hidroxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

20 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(3-Hidroxi-butil)-2-metoxi-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Fluoro-4-(2-hidroxi-etoxi)-fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{3-Etoxi-2-[2-fluoro-4-(2-fosfonooxi-etil)-fenilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

25 isopropil éster del ácido 4-[3-Metoxi-2-(2-metoxi-4-propionilsulfamoil-fenilamino)-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[2-(2,5-Difluoro-4-propoxi-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

30 (2-Fluoro-4-metanosulfonil-fenil)-{4-[1-(5-isopropil-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-piperidin-4-iloxi]-3-metoxi-piridin-2-il}-amina;

(2-Fluoro-4-metanosulfonil-fenil)-{3-metoxi-4-[1-(5-metoxi-pirimidin-2-il)-piperidin-4-iloxi]-piridin-2-il}-amina;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Ciclopropoxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

380
381
382

isopropil éster del ácido 4-[2-(2-Cloro-4-metanosulfonil-fenilamino)-5-fluoro-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[3-Etoxi-2-(4-metanosulfonil-2-metoxi-fenilamino)-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

5 isopropil éster del ácido 4-[2-(5-Fluoro-2-metil-4-propoxi-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

10 isopropil éster del ácido 4-[2-(2-Fluoro-4-metanosulfonil-fenilamino)-3-hidroxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[2-(2-Cloro-4-propoxi-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{3-Metoxi-2-[2-metil-6-(2-fosfonooxi-etil)-piridin-3-ilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

15 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Metanosulfonil-etilamino)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-(2-{6-[(2-Metanosulfonil-etil)-metil-amino]-2-metil-piridin-3-ilamino}-3-metoxi-piridin-4-iloxi)-piperidina-1-carboxílico;

20 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(3-Metanosulfonil-pirrolidin-1-il)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[2-(3-Metanosulfonil-6'-metil-3,4,5,6-tetrahidro-2H-[1,2']bipiridinil-5'-ilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(3-Metanosulfonil-azetidin-1-il)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

25 isopropil éster del ácido 4-[3-etinilo-2-(2-fluoro-4-metanosulfonil-fenilamino)-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[2-[2-Fluoro-4-(2-fosfonooxi-etanosulfonil)-fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

30 sec-butil éster del ácido 4-[2-(4-Etanosulfonil-2-fluoro-fenilamino)-3-metoxi-piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2,3-Dihidroxi-propilamino)-4-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Hidroxi-etilsulfanil)-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

382
383

isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Fluoro-4-(2-hidroxi-etanosulfonil)-
fenilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Hidroxi-etoxi)-2-metil-piridin-3-
ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

5 isopropil éster del ácido 4-{3-Metoxi-2-[2-metil-6-(2-fosfonooxi-etoxi)-
piridin-3-ilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(3-Hidroxi-propoxi)-2-metil-piridin-3-
ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

10 isopropil éster del ácido 4-{3-Metoxi-2-[2-metil-6-(3-fosfonooxi-propoxi)-
piridin-3-ilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-[3-Metoxi-2-(2-metoxi-4-sulfamoil-fenilamino)-
piridin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{2-[2-Fluoro-4-(3-fosfonooxi-propil)-fenilamino]-
3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

15 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-Hidroxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-
metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

isopropil éster del ácido 4-{3-Metoxi-2-[2-metil-6-(2-fosfonooxi-etil)-piridin-
3-ilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

20 isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(3-Hidroxi-propil)-2-metil-piridin-3-
ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico; e

isopropil éster del ácido 4-{3-Metoxi-2-[2-metil-6-(3-fosfonooxi-propil)-
piridin-3-ilamino]-piridin-4-iloxi}-piperidina-1-carboxílico;

25 38. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente
compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

1-ciclopropil-etil éster del ácido (S)-4-{6-[6-(2-metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-
ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piperidin-1-carboxílico.

30 39. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente
compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

(2-fluoro-4-metanosulfonil-fenil)-{4-[1-(5-isopropil-[1,2,4]oxadiazol-5-il)-piperidin-
4-iloxi]-3-metoxi-piridin-2-il}-amina.

35 40. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente
compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

358
383
384

isopropil éster del ácido 4-[6-(2-fluoro-4-metanosulfonil-fenilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-1-carboxílico.

41. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-[6-(4-ciano-2-fluoro-fenilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico.

42. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-hidroxi-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piridina-1-carboxílico.

43. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piridina-1-carboxílico.

44. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-{2-[6-(2-metanosulfonil-etil)-2-metil-piridin-3-ilamino]-3-metoxi-piridin-4-iloxi}-piridina-1-carboxílico.

45. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-[6-(6-dimetilcarbamoilmetil-2-metil-piridin-3-ilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piridina-1-carboxílico.

46. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

isopropil éster del ácido 4-{6-[6-(2-hidroxi-etoxi)-2-metil-piridin-3-ilamino]-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi}-piridina-1-carboxílico.

47. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del siguiente compuesto y sales, solvatos e hidratos del mismo:

384
384
385

isopropil éster del ácido 4-[6-(6-metanosulfonil-2-metil-piridin-3-ilamino)-5-metoxi-pirimidin-4-iloxi]-piperidina-1-carboxílico.

- 5 48. Una composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 y un portador farmacéuticamente aceptable.
- 10 49. Un método de producir una composición farmacéutica que comprende mezclar al menos un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 y un portador farmacéuticamente aceptable.
50. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.
- 15 51. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento de un desorden relacionado con el metabolismo del cuerpo humano o animal mediante terapia.
- 20 52. Uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para la producción de un medicamento para el uso en el tratamiento de un desorden relacionado con el metabolismo.
- 25 53. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47, para uso en un método de tratamiento de diabetes tipo I, diabetes tipo II, tolerancia inadecuada a la glucosa, resistencia a la insulina, hiperglicemia, hiperlipidemia, hipertrigliceridemia, hipercolesterolemia, dislipidemia y síndrome X.
- 30 54. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47, en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de diabetes tipo I, diabetes tipo II, tolerancia inadecuada a la glucosa, resistencia a la insulina, hiperglicemia, hiperlipidemia, hipertrigliceridemia, hipercolesterolemia, dislipidemia y síndrome X.
55. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento de diabetes tipo II del cuerpo humano o animal mediante terapia.

360
385
386

56. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de diabetes tipo II.
57. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento para disminuir el consumo de alimentos en un individuo.
58. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 en la fabricación de un medicamento para disminuir el consumo de alimentos en un individuo.
59. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento para inducir la saciedad en un individuo.
60. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento para inducir la saciedad en un individuo.
61. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 para uso en un método de tratamiento para controlar la ganancia de peso en un individuo.
62. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 47 en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento para controlar o disminuir la ganancia de peso en un individuo.