

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

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

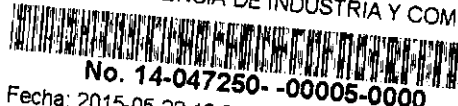
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 523

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-047250- -00005-0000

Fecha: 2015-05-22 16:20:36
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 523 RESPUESTA

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 11

Re: PI.-F.HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIDINA COMO INHIBIDORES DE LA PDE10A".-Clase C07D 471/04.-Expediente número 14-047.250.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho y notificado por fijación en lista el 24 de febrero de 2015.

2. Con el fin de responder las objeciones expuestas por el Señor Examinador en su Concepto Técnico correspondiente al Oficio No. 1729, en relación con las Excepciones a la patentabilidad, los Usos y el Nivel Inventivo de la presente solicitud, me permito dirigir su atención a las siguientes modificaciones y argumentos técnicos por medio de los cuales no sólo se superan completamente dichas objeciones sino que además se establece de manera incontrovertible la patentabilidad de la solicitud en estudio.

3. **MODIFICACIONES AL CAPÍTULO REIVINDICATORIO.**

Inicialmente, me permito manifestar que es deseo del solicitante presentar un **capítulo reivindicatorio modificado**, que remplace al actualmente presentado, esto con el fin de superar las objeciones presentadas como parte del concepto técnico realizado por ese Despacho. Tales modificaciones se exponen a continuación:

Nueva Reivindicación 1. Está basada en las reivindicaciones 1 a 3 y 5 actualmente presentadas. En este sentido, se ha restringido considerablemente el alcance de la nueva reivindicación 1 dado que se han realizado las siguientes modificaciones:

- (i) se han limitado las definiciones de los sustituyentes R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , y R^7 . Particularmente R^1 se ha limitado a fenilo, piridinilo, tiazolilo o NR^4R^5 ; y R^3 se ha limitado a pirazolilo, en el que dicho pirazolilo puede estar sustituido por 1 a 3 sustituyentes elegidos con independencia entre el grupo formado por alquilo C_1-C_7 , $-C(O)-NR^6R^7$ y $-C(O)-O-R^8$; y

(ii) se ha restringido la definición de R² y R⁸ a hidrógeno.

Nuevas Reivindicaciones 2 y 3. Corresponden respectivamente a las reivindicaciones 4 y 6 actualmente presentadas, las cuales han sido modificadas de acuerdo con las modificaciones realizadas en la nueva reivindicación 1.

Nuevas Reivindicaciones 4 a 6. Corresponden respectivamente a las reivindicaciones 7 a 9 actualmente presentadas, cuya dependencia ha sido adaptada a la nueva numeración.

Las reivindicaciones 2, 3 y 5 se han eliminado del capítulo reivindicatorio.

De esta forma, el **capítulo reivindicatorio modificado** está constituido por **6 reivindicaciones** que se refieren de manera más clara y concisa a las características técnicas esenciales de los compuestos que son objeto de la presente solicitud, de acuerdo con las enseñanzas de la descripción.

4. EXCEPCIÓN A LA PATENTABILIDAD.

Ahora bien, el Señor Examinador indica que las reivindicaciones 10 a 13 no serían patentables, dado que estarían haciendo referencia a un método de tratamiento.

Al respecto, amablemente me permito señalar que a través de mi memorial del 8 de abril de 2014, el Solicitante manifestó su interés únicamente en las reivindicaciones 1 a 9 actualmente presentadas, por lo que desde ese momento las reivindicaciones 10 a 13 no hacían parte del capítulo reivindicatorio.

En este sentido, me permito señalar que el capítulo reivindicatorio modificado se ajusta completamente a los requerimientos del Artículo 20 de la Decisión Andina 486 de 2000.

5. REIVINDICACIONES RELATIVAS A USOS Y SEGUNDOS USOS.

Por otro lado, el señor Examinador ha objetado las reivindicaciones 10 y 11 señalando que no se considerarían patentables por estar referidas a usos.

A este respecto, una vez más me permito destacar que a través de mi memorial del 8 de abril de 2014, el Solicitante manifestó su interés únicamente en las reivindicaciones 1 a 9 actualmente presentadas, por lo que desde ese momento las reivindicaciones 10 y 11 no hacían parte del capítulo reivindicatorio.

Por lo tanto, el capítulo reivindicatorio modificado no se refiere de ninguna manera a usos y se enmarca así dentro de lo establecido en los Artículos 14 y 21 de la Decisión Andina 486 de 2000.

6. **NIVEL INVENTIVO.**

a) Ahora bien, el Señor Examinador considera que los compuestos reclamados en las reivindicaciones 1 a 8 carecerían de altura inventiva con respecto a las enseñanzas de los documentos **WO2009047514 (D1)** y **"Synthesis and Anti-tumor Activities of Novel [1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidines" (D2)**.

A este respecto el Señor Examinador asegura que los compuestos reclamados en la reivindicación 1 se considerarían obvios, debido a que la persona normalmente conocedora de la materia, incluiría el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina en los compuestos que se conocen en el documento D1, tal como enseña el documento D2.

Sobre este particular me permito señalar que las enseñanzas de los mencionados documentos D1 y D2 solos o en combinación, de ninguna manera pueden conducir a la estructura particular de los compuestos de la invención, tal y como se reclaman en el capítulo reivindicatorio modificado que se presenta junto con este memorial.

Por lo tanto, con el ánimo de demostrar ante ese Despacho que el capítulo reivindicatorio modificado es inventivo frente a las enseñanzas de los documentos D1 y D2 atentamente me permito presentar las siguientes consideraciones técnicas.

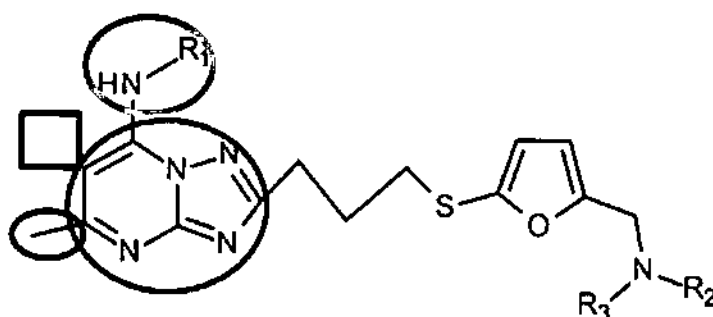
En primer lugar, me permito resaltar que los compuestos que se reclaman en la presente solicitud son inhibidores de la PDE10A, los cuales son de gran utilidad en el tratamiento de la esquizofrenia. En este sentido, cabe destacar que la estructura central de los compuestos de la invención es [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina unida por medio de un enlace amida a un radical pirazolilo.

Por su parte, el documento D2 divulga la síntesis de [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidinas, las cuales poseen actividad anti-tumoral.

De otro lado, el documento D1 divulga [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridinas que tienen actividad anti-tumoral, particularmente el blanco al cual se dirigen tales compuestos es el receptor AXL tirosina quinasa.

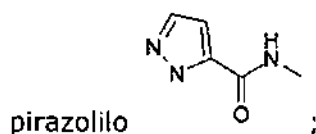
Como parte de su concepto técnico, el señor Examinador afirma que el documento D2 es el estado de la técnica más cercano a los compuestos aquí reclamados, sin embargo, es de destacar que los compuestos que se reclaman en la presente solicitud difieren considerablemente de aquellos que divulga el documento D2.

En ese sentido, para que la persona versada en la materia pudiera llegar a los compuestos de la presente invención, tendría que llevar a cabo las siguientes modificaciones químicas sobre los compuestos divulgados en el documento D2:

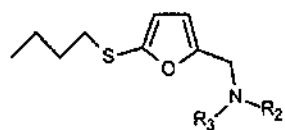


Compuestos divulgados en D2

- (i) la porción de la estructura que corresponde a la [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (círculo azul) tiene que ser reemplazada por una [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina;
- (ii) en la posición 6 de la [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (cuadrado rojo), el átomo de hidrógeno tiene que ser reemplazado por un enlace amida unido a un radical



- (iii) en la posición 2 de la [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, el grupo:



tiene que ser reemplazado por fenilo, piridinilo, tiazolilo o NR^4R^5 ;

- (iv) el grupo metilo de la posición 7 (círculo verde) en los compuestos del documento D2 tiene que ser reemplazado por un hidrógeno; y
- (v) el grupo $-\text{NHR}_1$ de la posición 5 (círculo amarillo) tiene que ser reemplazado por un hidrógeno.

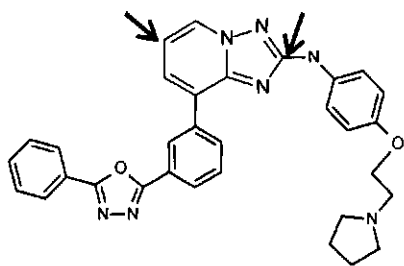
A la luz de lo anterior, es evidente que el número de modificaciones necesarias para llegar a los compuestos de la presente invención a partir de los compuestos revelados en D2, muestra que estos compuestos son estructuralmente muy diferentes, es decir, ni la estructura central ni los sustituyentes son similares.

Además, debe tenerse presente que los compuestos de D2 tienen actividad antitumoral, mientras que los compuestos de la presente invención son inhibidores de la PDE10A es decir, los compuestos tienen actividades completamente diferentes.

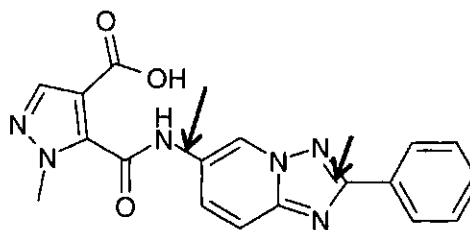
Partiendo de D2, el problema a ser resuelto por la presente invención es proporcionar novedosos inhibidores de la PDE10 para el tratamiento de la esquizofrenia. No obstante, no existe ninguna sugerencia en el documento D2 para que la persona versada en la materia lleve a cabo las 5 modificaciones enumeradas previamente sobre los compuestos divulgados en D2, con el fin de llegar a los compuestos de la presente invención que tienen actividad inhibitoria de la PDE10A.

Desde un principio, el número de modificaciones necesarias para llegar a los compuestos de la presente invención muestra que D2 no es un punto de partida válido para que una persona versada en la materia resuelva el problema planteado.

Incluso la combinación del documento D2 con el documento D1 tampoco permite que la persona versada en la materia obtenga los compuestos de la presente invención, dado que D1 no complementa las diferencias existentes entre los compuestos de D2 y los de la invención y tampoco sugieren las 5 modificaciones necesarias mencionadas previamente. Realmente, los compuestos de D1 son estructuralmente muy diferentes de los compuestos de la presente invención y además tienen una actividad diferente, esto es, mientras que en D1 son compuestos con actividad antitumoral, en la presente invención son inhibidores de PDE10A:



Compuesto 75 de D1



Compuesto del Ejemplo 1 de la presente invención

De hecho, al realizar la comparación estructural, es claro que los sustituyentes de D1 no coinciden con los sustituyentes de los compuestos de la presente invención, y como bien se mencionó anteriormente, en el documento D1 no existe ninguna sugerencia acerca de las modificaciones que tienen que ser realizadas en los compuestos de D1 para llegar a

los compuestos de la presente invención, los cuales poseen actividad inhibitoria de la PDE10A.

Por ejemplo, en la posición 6 (ver flecha roja en las estructuras anteriores) de la porción correspondiente a la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina en los compuestos de la presente invención, hay un sustituyente -NHC(O)-pirazolilo, mientras que en los compuestos divulgados en D1 hay un hidrógeno en la misma posición 6 de la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina. Igualmente, no hay ninguna divulgación en D1 que le sugiera a la persona versada en la materia reemplazar el hidrógeno de la posición 6 de la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina por un grupo -NHC(O)-pirazolilo para obtener compuestos inhibidores de la PDE10A.

Lo mismo sucede con el sustituyente de la posición 2 (ver flecha verde en las estructuras anteriores) de la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina, que corresponde al radical R1 en los compuestos de la presente invención y puede ser fenilo opcionalmente sustituido, piridinilo, tiazolilo o NR^4R^5 , el cual se encuentra unido directamente a la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina. Por su parte, en los compuestos descritos en el documento D1, R1 es -NH-arilo o NH-heteroarilo, es decir, el radical arilo o heteroarilo está unido a través de un puente de NH a la [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina.

En este sentido, a la luz de las enseñanzas del documento D1, una persona experta en la técnica no tiene sugerencia alguna que la motive a eliminar el grupo -NH y a unir los grupos específicos arilo o heteroarilo como el fenilo, piridinilo o tiazolilo, directamente a la fracción de [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina con el fin de preparar compuestos inhibidores de la PDE10A de la presente invención.

En vista de los argumentos discutidos, es completamente evidente que las enseñanzas de los documentos D1 y D2, solos o en combinación, de ninguna manera permiten obtener los compuestos de la invención, tal y como se reclaman en el capítulo reivindicatorio modificado que se presenta junto con este memorial.

Sumado al análisis previo, me permito manifestar que el señor Examinador está basando su aseveración en el conocimiento previo que tiene de los compuestos de la presente invención, por lo que el análisis de nivel inventivo realizado está enmarcado dentro de lo que en el ámbito de las patentes se conoce como "hindsight", o análisis "Ex post facto", toda vez que conociendo de antemano la invención, el Señor Examinador está seleccionado partes específicas de las enseñanzas contenidas dentro de D1 y D2, combinándolas y modificándolas de manera que permitan construir los compuestos reclamados por la presente solicitud, lo cual de ninguna manera podría ser evidente para la persona versada en la materia en el momento en el cual se desarrolló la invención.

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

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

En conexión con lo expuesto anteriormente, me permito referirme al señalamiento que hace el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina con respecto a las definiciones de "obvio" y "evidente" en la evaluación del Nivel Inventivo de una solicitud de patente¹:

"Resulta pertinente, a los efectos del artículo 4 de la Decisión 344, definir qué se entiende por "obvio" y por "evidente" a fin de determinar qué se debe entender por nivel inventivo.

Lo obvio es aquello que salta a la vista de manera clara y directa; lo "que se encuentra o pone delante de los ojos, muy claro o que no tiene dificultad". Mientras que lo evidente consiste en la "certeza clara y manifiesta de la que no se puede dudar; cierto, claro, patente y sin la menor duda". De forma que algo que resulte obvio no es necesariamente evidente; empero lo que es evidente, es también obvio.

En este orden de ideas, se puede concluir que una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no sea consecuencia clara y directa de dicho estado."

De dicho señalamiento es claro que dentro de la Comunidad Andina, para que un documento afecte el nivel inventivo de una solicitud de patente el objeto de dicha solicitud debe ser derivable de manera evidente a partir de las enseñanzas del arte previo, y dicho documento debe brindar una motivación y guía suficientes que conduzcan inevitablemente a obtener la invención.

En vista de lo anterior, dado que a partir de las enseñanzas de los documentos D1 y D2 no "saltan a la vista de manera clara y directa" los compuestos que son objeto de la presente invención, y al no tenerse "certeza clara y manifiesta" a partir de las enseñanzas de dichos documentos de que dichos compuestos serían potentes inhibidores de la PDE10A, es claro que la solicitud en estudio es a todas luces inventiva con respecto al estado del arte más próximo.

b. Por otra parte, el Señor Examinador considera que el proceso reclamado en la reivindicación 9 (nueva reivindicación 6) carecería de altura inventiva con respecto a las enseñanzas de los documentos **WO2009047514 (D1)** y **"Solvent-free preparation of amides from acids and primary amines under microwave irradiation" (D4)**.

¹ Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, PROCESO 192-IP-2005

Frente a lo anterior, me permito manifestar que contrario a lo que señala el señor Examinador, el proceso reclamado en la presente solicitud, en efecto es inventivo, debido a que está dirigido exclusivamente a la obtención los compuestos reclamados en las reivindicaciones 1 a 4, los cuales como previamente se demostró, son nuevos e inventivos.

En este sentido, me permito señalar que respecto a los procesos de síntesis de compuestos nuevos e inventivos, la Guía para Examen de Solicitudes de Patente de Invención y Modelo de Utilidad, en sus numerales 2.7.3 y 3.3.6, menciona lo siguiente:

"De igual manera, si el objeto de la solicitud es un nuevo compuesto, el solicitante tiene derecho a reivindicar el proceso de síntesis o de obtención del nuevo compuesto"; y

"Si el examinador concluye que la fórmula Markush de la solicitud es nueva e inventiva, también la composición y el procedimiento para prepararlos se considerarán nuevos e inventivos" (Resaltado fuera de texto).

A la luz de lo anterior, y debido a que a lo largo de este memorial se ha demostrado contundentemente que los compuestos reclamados en la presente solicitud son novedosos e inventivos, es evidente que el proceso para la obtención de los compuestos de las reivindicaciones 1-4, que se reclama en la nueva reivindicación 6, en consecuencia también es inventivo.

7. CONCLUSIÓN.

Para finalizar me permito reiterar que el capítulo reivindicatorio modificado presentado junto con este memorial de ninguna manera hace referencia a métodos de tratamiento ni a usos, cumpliendo así con lo exigido por la mencionada Decisión Andina 486 de 2000.

Por otro lado, en virtud de los argumentos discutidos con respecto a los documentos citados, se estableció de manera incontrovertible que los compuestos que son objeto de la solicitud en estudio, de ninguna manera resultarían evidentes para la persona versada en la materia a partir de las enseñanzas de los documentos D1 y D2, y que el proceso de obtención reclamado no resulta evidente de la combinación de los compuestos D1 y D4, demostrando irrefutablemente la patentabilidad de la presente solicitud.

8. Anexo me permito presentar copia de las páginas **65 a 70** que corresponden al **capítulo reivindicatorio modificado**, discutido en el presente memorial, el cual está constituido por **6** reivindicaciones.

5

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

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

9. En vista de lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar nuevamente la solicitud a la luz de los argumentos presentados y conceder el privilegio de patente solicitado.

Señor Superintendente,

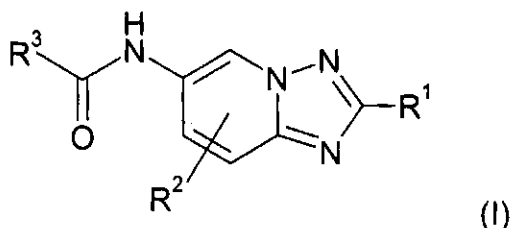


ALICIA LLORED A RICAURTE

T. P. 53.215

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I):



5 en la que:

R¹ es fenilo, piridinilo, tiazolilo o NR⁴R⁵, en el que R⁴ y R⁵ se eligen con independencia entre alquilo C₁-C₃, R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un anillo pirrolidinilo o morfolinilo; en el que dichos anillos pueden estar sustituidos por alcoxi C₁-C₇;

10 R² es hidrógeno;

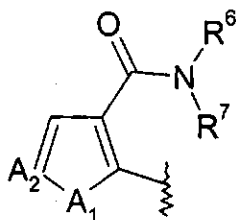
R³ es pirazolilo, en el que dicho pirazolilo puede estar sustituido por 1 - 3 sustituyentes elegidos con independencia entre el grupo formado por alquilo C₁-C₇, -C(O)-NR⁶R⁷ y -C(O)-O-R⁸;

R⁶ y R⁷ se eligen con independencia entre alquilo C₁-C₇, cicloalquilo C₃-C₈, R⁶ y R⁷ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un heterocicloalquilo seleccionado de pirrolidinilo, morfolinilo y azetidinilo, que puede estar sustituido por 1 - 3 sustituyentes elegidos con independencia entre halógeno;

R⁸ es hidrógeno;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

20 2. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R³ es:



en el que:

A₁ es NR⁹,

A₂ es NR⁹,

R⁶ y R⁷ se eligen con independencia entre alquilo C₁-C₇, cicloalquilo C₃-C₈,
R⁶ y R⁷ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un
heterocicloalquilo seleccionado de pirrolidinilo, morfolinilo y azetidinilo, que puede estar
sustituido por 1 - 3 sustituyentes elegidos con independencia entre halógeno;

5 R⁹ y R^{9'} se eligen con independencia entre hidrógeno y alquilo C₁-C₃.

3. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 2, elegido
entre el grupo formado por:

(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-1-carbonil)-
2H-pirazol-3-carboxílico

10 ácido 1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-ilcarbamoyl)-1H-pirazol-4-
carboxílico

(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-
2H-pirazol-3-carboxílico

15 4-(azetidina-1-carbonil)-1-metil-N-(2-(tiazol-4-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-1H-
pirazol-5-carboxamida

1-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]piridin-6-il)-1H-pirazol-5-
carboxamida

(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(3-fluor-azetidina-1-carbonil)-
2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico

20 4-(etil-metil-amida) 3-[(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-metil-
2H-pirazol-3,4-dicarboxílico

4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-
metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico

25 (2-piridin-3-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-
carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico

4-(azetidina-1-carbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-1H-
pirazol-5-carboxamida

N4-ciclopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-1H-
pirazol-4,5-dicarboxamida

- 1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-4-(pirrolidina-1-carbonil)-1H-pirazol-5-carboxamida
(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-1-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 5 (2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(azetidina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
4-(etil-metil-amida) 3-[(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-
- 10 metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(3-fluor-azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 15 (2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
(2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
(2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-1-
- 20 carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
3-[(2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] 4-(etil-metil-amida) del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
(2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(3-fluor-azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
- 25 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
(2-dietilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
(2-dietilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-4-
- 30 carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico

- (2-dietilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(azetidina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 3-[(2-dietilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] 4-(etil-metil-amida) del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 5 4-dietilamida 3-[(2-dietilamino-1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-dietilamino-[1,2,4]tri-azolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- (2-pirrolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 10 (2-pirrolidin-1-il-1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
- (2-pirrolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-1-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 15 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-pirrolidin-1-il-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 4-(etil-metil-amida) 3-[(2-pirrolidin-1-il-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 4-dietilamida 3-[(2-pirrolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-
- 20 2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 4-dietilamida 3-{[2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]tri-azolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- [2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 25 4-(etil-metil-amida) 3-{[2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida} del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-{[2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida} del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- [2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida del ácido 2-metil-4-
- 30 (pirrolidina-1-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico

[2-(3-metoxi-pirrolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il]-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico.

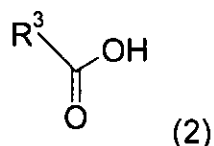
4. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 3, elegido entre el grupo formado por:

- 5 (2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
- 1-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]piridin-6-il)-1H-pirazol-5-carboxamida
- (2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(3-fluor-azetidina-1-carbonil)-
- 10 2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
- (2-piridin-3-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(morfolina-4-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- (2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 2-metil-4-(pirrolidina-1-carbonil)-2H-pirazol-3-carboxílico
- 15 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-morfolin-4-il-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico
- (2-dimetilamino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida del ácido 4-(azetidina-1-carbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-carboxílico
- 4-(ciclopropil-metil-amida) 3-[(2-dimetilamino-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]piridin-6-il)-amida] del
- 20 ácido 2-metil-2H-pirazol-3,4-dicarboxílico.

5. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1-4 y un vehículo terapéuticamente inerte.

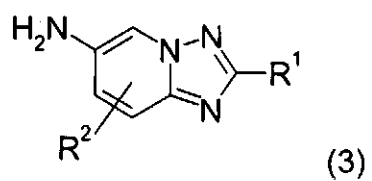
6. Un proceso para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) definida en una cualquiera de las reivindicaciones 1-4, dicho proceso consiste en:

- 25 a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (2):



con

b) un compuesto de la fórmula (3)



5

en las que R^1 , R^2 , R^3 tienen los significados definidos anteriormente y, si se desea, convertir los compuestos en sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.