

464

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-099640- -00003-0000

Fecha: 2008-12-24 12:42:17 Dep: 2020 NUECREACIONI
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act: 444 RESPUESTAREQUE Folios: 45

Ref: Expediente N° 08-099.640

Solicitud de Patente de Invención titulada: "COMPUESTOS QUE POTENCIAN EL RECEPTOR AMPA Y USOS DE LOS MISMOS EN MEDICINA".

Solicitante: GLAXO GROUP LIMITED

Nuestra Ref: P2008/000158

RESPUESTA AL OFICIO N° 13738 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 353, DE FECHA 31 DE OCTUBRE DE 2008,
(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito dar respuesta al auto emanado de ese Despacho dentro del término legal previsto en el artículo 39 de la Decisión 486 en los siguientes términos:

1. En respuesta a la única observación del Examinador, me permito aportar junto al presente memorial la traducción del Examen Preliminar Internacional, junto con la correspondiente traducción de sus anexos.

Atentamente,

469

**TRATADO DE COOPERACION DE PATENTES
PCT**

REPORTE PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD
(Capítulo II del Tratado de Cooperación de Patentes)

(PCT Artículo 36 y Regla 70)

Referencia de solicitante o agente

RQK/PB61672A

Solicitud Internacional No.

PCT/EP2007/052568

Fecha de presentación internacional (día/mes/año)

19.03.2007

Fecha de prioridad (día/mes/año)

20.03.2006

Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC

INV. C07D231/56

Solicitante

GLAXO GROUP LIMITED et al

1. Este reporte es el reporte de evaluación preliminar internacional, establecido por esta Autoridad de Evaluación Preliminar Internacional bajo el Artículo 35 y transmitido al solicitante según en el Artículo 36.

2. Este REPORTE consta de 7 hojas, incluyendo esta cubre hoja.

3. Este reporte también está acompañado de ANEXOS, los cuales comprenden:

a. ☐ enviado al solicitante y a la Oficina Internacional un total de 26 hojas, a saber:

☐ hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos los cuales hayan sido modificados y sean la base de este reporte y/o hojas que contengan rectificaciones autorizadas por esta Autoridad (ver la Regla 70.16 y la Sección 607 de los Instructivos Administrativos).

☐ hojas que reemplacen hojas previas, pero las cuales esta Autoridad considere tengan una modificación que vaya más allá de la divulgación en la solicitud internacional tal como se presentó, tal cual está indicado en el ítem 4 del recuadro No. 1 y el recuadro suplementario.

b. ☐ (enviado solamente a la oficina internacional) un total de (indique el tipo y número de vehículos electrónicos), que contengan un listado de secuencias y/o tablas relacionadas, en formato electrónico solamente, tal cual está indicado en el Recuadro Suplementario con Relación a Listados de Secuencias (ver la Sección 802 de los Instructivos Administrativos).

4. Este reporte contiene indicaciones con relación a los siguientes ítems:

☐ Recuadro No. 1 Base del reporte

- 466
- JP
- ☐ Recuadro No. II Prioridad
 - ☐ Recuadro No. III No formulación de opinión con respecto a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial
 - ☐ Recuadro No. IV Falta de unidad de invención
 - ☐ Recuadro No. V Declaración razonada según el Artículo 35(2) con respecto a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial; citas y explicaciones soportando dicha declaración
 - ☐ Recuadro No. VI Ciertos documentos citados
 - ☐ Recuadro No. VII Ciertos defectos en la solicitud internacional
 - ☐ Recuadro No. VIII Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional

Fecha de envío de la demanda
2007-08-09

Fecha de terminación del reporte
20.06.2008

Nombre y dirección de la autoridad preliminar internacional evaluadora
Oficina Europea de Patentes
NL-2280 Pays Bas
Tel. +31 70 340-2040 Tx. 31 651
Fax: +31 70 340 - 3316

Funcionario autorizado

De Jong, Bart
Teléfono: +31 70 340 2833

Recuadro No. 1 Base del Reporte

1. Con respecto al idioma, este reporte se base en la solicitud internacional en el idioma en el cual fue presentado, a menos que se indique en este ítem.

☐ Este reporte se basa en las traducciones a partir del idioma original al siguiente idioma _____, el cual es el idioma de la traducción proporcionada para fines de:

- ☐ búsqueda internacional (bajo Reglas 12.3 y 23.1 (b))
- ☐ publicación de la solicitud internacional (bajo la Regla 12.4)
- ☐ evaluación preliminar internacional (bajo las Reglas 55.2 y/o 55.3)

2. Con respecto a los elementos* de la solicitud internacional, este reporte se base en (se refieren a las hojas de reemplazo las cuales han sido proporcionadas a la Oficina receptora en respuesta a una invitación bajo el Artículo 14 como “presentadas originalmente” y no están anexadas a este reporte):

Descripción, páginas

1-142 tal cual se presentaron originalmente

Reivindicaciones, números

1-21 recibido el 14.08.2007 con oficio del 09.08.2007

☐ un listado de secuencias y/o cualquier otra Tabla relacionada – ver el Recuadro Suplementario con Relación a un Listado de Secuencias

3. Las modificaciones han dado resultado en la cancelación de:

- ☐ la descripción, páginas
- ☐ las reivindicaciones, Nos.
- ☐ los dibujos, hojas/figuras
- ☐ el listado de secuencias (especifique)
- ☐ cualquier tabla(s) con relación a un listado de secuencias (especifique):

4. Este reporte ha sido redactado de tal manera como si las modificaciones anexadas al reporte y enumeradas a continuación no hubieran sido hechas, puesto que se considera que van más allá de la divulgación tal cual presentada, tal cual se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2(c)).

- ☐ la descripción, páginas
- ☐ las reivindicaciones, Nos. 7, 19, 20
- ☐ los dibujos, hojas/figuras
- ☐ el listado de secuencias (especifique)
- ☐ cualquier tabla(s) con relación a un listado de secuencias (especifique):

5. Este concepto ha sido realizado tomando en consideración la rectificación de un error obvio autorizado por o notificado por esta Autoridad según lo establece la Regla 91 (Regla 70.2 (e)).



Recuadro No. IV Falta de unidad de invención

1. En respuesta a la invitación a restringir o cancelar tarifas adicionales, el solicitante ha:

- ☐ restringió las reivindicaciones
- ☐ canceló las tarifas adicionales
- ☐ pago tarifas adicionales bajo protesta
- ☐ ni restringió ni pagó tarifas adicionales

2. Esta Autoridad encontró que el requisito de unidad de invención no se cumple y decidió, según la Regla 68.1, no invitar al solicitante ni a restringir ni a pagar tarifas adicionales.

3. Esta Autoridad considera que el requisito de unidad de invención según las Reglas 13.1, 13.2, y 13.3

- ☐ ha sido cumplido
- ☐ no ha sido cumplido por las siguientes razones:

Ver hoja anexa

4. De manera que este reporte ha sido establecido con respecto a las siguientes partes de la solicitud internacional:

- ☐ todas las partes
- ☐ las partes relacionadas con las reivindicaciones Nos.

Recuadro No. V Declaración razonada según el Artículo 35(2) con respecto a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial; citas y explicaciones soportando dicha declaración

1. Declaración

Novedad (N)	Si:	Reivindicaciones	2, 4, 5, 6, 8-17, 19
	No:	Reivindicaciones	
Nivel Inventivo (IS)	Si:	Reivindicaciones	2, 4, 5, 6, 8-17
	No:	Reivindicaciones	1, 3, 7, 18, 19
Aplicación Industrial (IA)	Si:	Reivindicaciones	1-19
	No:	Reivindicaciones	

2. Citas y explicaciones (Regla 70.7):

ver hoja anexa

Recuadro No. VIII Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional

Las siguientes observaciones sobre la claridad de las reivindicaciones, descripción, y dibujos o sobre la pregunta si las reivindicaciones están totalmente soportadas por la descripción, son hechas:

ver hoja anexa

REPORTE PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD
(HOJA ANEXA)

Solicitud Internacional No.
PCT/EP2007/052568

Re Ítem I

Las modificaciones presentadas ante la Oficina Internacional bajo el Artículo 19(1) introducen materia la cual se extiende más allá del contenido de la solicitud presentada originalmente, contrario al Artículo 19(2) del PCT:

La salvedad en la reivindicación 7 renuncia al compuesto 14 de D3. Puesto que D3 no puede considerarse como una divulgación accidental (ejemplo, infarto miocárdico es mencionado en D3), no se permite esta salvedad.

La reivindicación 18 ha sido dividida en 3 reivindicaciones independientes 18, 19 y 20. Ambas reivindicaciones 19 y 20 mencionan compuestos en donde $n=0$, las cuales no fueron divulgadas en la solicitud original.

En vista de la anterior objeción, este reporte ha sido realizado para las reivindicaciones modificadas 1-4 y para las reivindicaciones 5-19 originalmente presentadas.

Re Ítem IV

La reivindicación 19 se relaciona con un proceso para la preparación de compuestos los cuales no son novedosos. Debido a esto, la materia de la reivindicación 19 no conforma un concepto inventivo único con la materia de las otras reivindicaciones (Regla 13.1 del PCT).

Se observa que el proceso según la reivindicación 19 no está limitado por el tipo de enfermedades mencionadas en la reivindicación 7.

Re Ítem V

Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1: DATABASE REGISTRY Chemical Abstracts Service; noviembre 2003, XP002430702 retirado de STN

D2: LYGA, JOHN W ET AL: "Síntesis, mecanismo de acción, y QSAR de 3-sustituido-2-arilo-4,5,6,7-tetrahidroindazolas herbicidas". PESTICIDE SCIENCE, 42(1), 29-36 CODEN: PSSCBG; ISSN: 0031-613X, 1994, XP002430700

D3: JP 2001 220390 A (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO, LTD., JAPON) 14 de agosto de 2001 citado en la solicitud

D4: WO 2006/015828 A (GLAXO GROUP LTD (GB); BRADLEY DANIEL MARCUS (GB); THEWLIS KEVIN MICHAEL) 16 de febrero de 2006 citado en la solicitud

471

1) La presente solicitud no cumple con los criterios del Artículo 33(1) del PCT, puesto que la materia de las reivindicaciones 1, 3, 7, 18 no es novedosa a la luz del Artículo 33(2) del PCT:

El documento D1 divulga varios compuestos los cuales desvirtúan la novedad para las reivindicaciones 1, 3 y 18. Así las cosas, también se observa que el segundo compuesto mencionado en D2 todavía desvirtúa la novedad para las reivindicaciones 1-3 puesto que este compuesto corresponde a los compuestos reivindicados en caso que Y sea NR8CO y R8 sea propilo.

El documento D2 divulga el compuesto 6b, el cual desvirtúa la novedad de la reivindicación 18.

El documento D3 divulga el compuesto según el ejemplo 13. Este compuesto ha sido rechazado en las reivindicaciones 1, 3, 5 pero desvirtúa la novedad para la reivindicación 7. (por ende se observa que la reivindicación 7 no está redactada en la forma de una reivindicación de "segundo uso médico").

2) D4 divulga compuestos que potencializan el receptor de glutamato y se considera el antecedente más cercano. La materia de las reivindicaciones 1-18 (en cuanto a que es novedoso) no es obvia a partir de D4 debido a que a los compuestos de la presente solicitud son estructuralmente muy diferentes de aquellos en D4.

La reivindicación 19 se relaciona con la preparación de compuestos conocidos usando métodos los cuales son generalmente conocidos y por lo tanto no es inventiva.

3) Las reivindicaciones 14-16 se relacionan con materia considerada por esta Autoridad cubierta por las provisiones establecidas por la Regla 67.1(iv) del PCT. La patentabilidad también puede ser dependiente de la formulación de las reivindicaciones. Por ejemplo, la Oficina de Patentes Europea no reconoce reivindicaciones dirigidas al uso de un compuesto en un tratamiento médico como reivindicaciones patentables, pero podrá permitir reivindicaciones dirigidas a un producto, en particular a sustancias o composiciones para uso en un primer o posterior tratamiento médico.

Re Ítem VIII

Las reivindicaciones 1-3 todas son reivindicaciones independientes relacionadas con compuestos del mismo tipo. Las reivindicaciones coinciden entre si en gran extensión. Esto vuelve innecesariamente difícil la determinación de si un compuesto ha sido reivindicado o no. Por lo tanto, la solicitud no cumple con los requisitos del Artículo 6 del PCT.

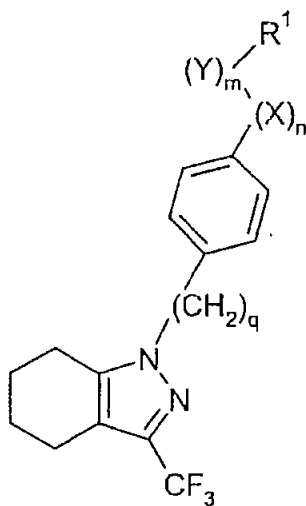
El número del documento D3 mencionado en la página 2, línea 30 de la descripción es incorrecto.

472

NOVEDAD DE LA INVENCIONREIVINDICACIONES (ENMIENDAS)

5 1.- Un compuesto de fórmula (A), o una sal o solvato del mismo:

10



(A)

15 en el que: q es 0 ó 1; n es 0, 1 ó 2; X es CR^6R^7 , donde cada uno de R^6 y R^7 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo y flúor, pero R^6 y R^7 no son los dos simultáneamente metilo; o, cuando n es 1, R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 miembros; Y se selecciona entre el

20 grupo que consiste en CO, NR^8CO , SO, SO_2 y NR^8SO_2 ; R^8 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquenilo de C_{2-4} y alquilo de C_{1-4} ; m es 0 ó 1; y a) cuando n es 0 y m = 1, entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) un grupo heterocíclico, aromático, de 5

10 473

miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con metilo, (iii) NHR^2 y (iv) NR^2R^3 , donde: R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxil, metoxil, NHMe , fenilo o un grupo

5 heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; donde cuando Y es CO , R^2 no es $(\text{CH}_2)_2\text{pirrolidinilo}$; $\text{R}^{2'}$ se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y

10 etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxil, metoxil, NHMe , fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en

15 halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o $\text{R}^{2'}$ y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxil, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan

20 independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en

474

halo, hidroxilo, $NR^{13}R^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{2-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; b) cuando n y m son los dos simultáneamente 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: alcoxi de C_{1-6} ; un grupo

5 heterocíclico de 5 ó 6 miembros, monocíclico, saturado o parcialmente insaturado, unido a través de un átomo de carbono y opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; pirrolidinilo N-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres

10 grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; y oxazolilo o imidazolilo, estando los dos opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} ; c) cuando n es 1 ó 2, y m es 1, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , bencilo, ciclopropilo, tienilo y NR^9R^{10} donde: R^9 se selecciona

15 entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4} , y R^{10} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} de cadena ramificada, cicloalquilo de C_{3-6} y $-(CH_2)_pZ$ donde p es 1, 2 ó 3; Z es un grupo fenilo o heterocíclico de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados

20 independientemente entre el grupo que consiste en halo y alquilo de C_{1-4} ; o R^9 y R^{10} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 miembros, o un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando cualquiera de los anillos

opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, fenilo y (en el caso de un anillo no aromático) ceto; y d) cuando n es 1 ó 2, y m es 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en ciano, hidroxilo, NH_2 , un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y cicloalquilo de C_{3-6} , y $NR^{11}R^{12}$ donde: R^{11} es hidrógeno y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} ; o R^{11} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y alquenilo de C_{2-4} , y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ fenilo y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} o R^{11} y R^{12} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en: (i) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, haloalquilo de C_{1-4} , hidroxilo, cicloalquilo de C_{3-6} y alcoxi de C_{1-4} ; y (ii) imidazolilo sustituido con fenilo; (iii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 miembros, que está sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; y (iv) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en

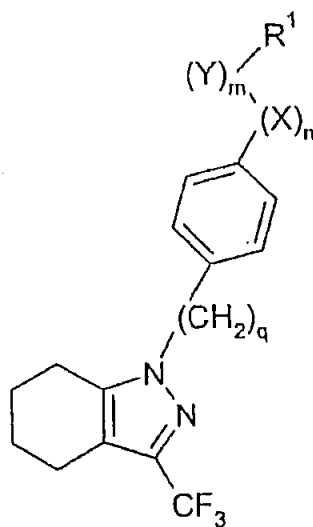
496
B

ceto, hidroxí y alcoxi de C_{1-4} ; con la condición de que el compuesto no sea 4-metil-N-[4-[4,5,6,7-tetrahidro-3-(trifluorometil)-1H-indazol-1-il]fenil]-1,2,3-tiadiazol-5-carboxamida y sales de la misma, o un compuesto en el que simultáneamente $n = 0$, $m = 1$, $q = 0$, $Y = CO$ y R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: NMe_2 , pirrolidinilo, $NMeCH_2Ph$, morfolinilo, piperidilo, $NHEt$, NEt_2 , $NHMe$, $NHCH_2$ -tetrahidrofuran-2-ilo, $NH(CH_2)_2Ph$, $NH(CH_2)Ph$, $NHtBu$ y $NH(CH_2)_3OMe$.

2.- Un compuesto de fórmula (Ie) o una sal o solvato del mismo:

10

15



(Ie)

en el que: q es 0 ó 1; n es 0, 1 ó 2; X es CR^6R^7 , donde cada uno de R^6 y R^7 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo y flúor, pero R^6 y R^7 no son los dos simultáneamente metilo; o, cuando n es 1, R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 miembros; Y se selecciona entre el grupo que consiste en CO , NR^8CO , SO , SO_2 y NR^8SO_2 ; R^8 se selecciona entre el

20

14 497

grupo que consiste en hidrógeno, alqueno de C_{2-4} y alquilo de C_{1-4} ; m es 0 ó 1; y a) cuando n es 0 y $m = 1$, entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) imidazolilo opcionalmente sustituido con metilo, (iii) NHR^2 y (iv) $NR^{2'}R^3$, donde: R^2 se selecciona entre el grupo que

5 consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo $-(CH_2)_pZ$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxilo, metoxi, $NHMe$, fenilo o un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste

10 en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; donde cuando Y es CO , R^2 no es $(CH_2)_2$ pirrolidinilo; $R^{2'}$ se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(CH_2)_pZ'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxilo, metoxi, $NHMe$, fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando

15 el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; R^2 y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido

20 con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxilo, $NR^{13}R^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6

15

miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxilo, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; b) cuando n y m son los dos simultáneamente 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: alcoxi de C_{1-6} ; un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, monocíclico, saturado o parcialmente insaturado, unido a través de un átomo de carbono y opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; pirrolidinilo N-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; y oxazolilo o imidazolilo, estando los dos opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} ; c) cuando n es 1 ó 2, y m es 1, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , bencilo, ciclopropilo, tienilo, y NR^9R^{10} donde: R^9 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4} , y R^{10} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} de cadena ramificada, cicloalquilo de C_{3-6} y $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ donde p es 1, 2 ó 3; Z es un grupo fenilo o heterocíclico de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo y alquilo de C_{1-4} ; o R^9 y R^{10} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo

heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 miembros, o un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando cualquiera de los anillos opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, fenilo y (en el caso de un anillo no aromático) ceto; y d) cuando n es 1 ó 2, y m es 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en ciano, hidroxilo, NH_2 , un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y cicloalquilo de C_{3-6} , y $NR^{11}R^{12}$ donde: R^{11} es hidrógeno y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} y $C(O)$ alqueno de C_{2-4} ; o R^{11} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y alqueno de C_{2-4} , y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ fenilo y $C(O)$ alqueno de C_{2-4} o R^{11} y R^{12} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en: (i) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, haloalquilo de C_{1-4} , hidroxilo, cicloalquilo de C_{3-6} y alcoxi de C_{1-4} ; y (ii) imidazolilo sustituido con fenilo; (iii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 miembros, que está sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; y (iv) un grupo heterocíclico, no

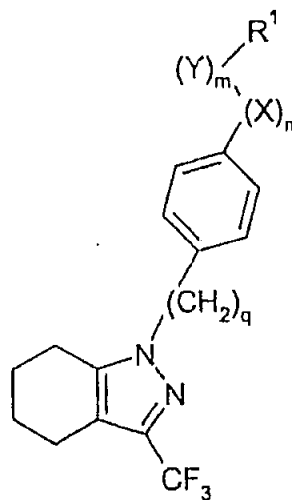
Handwritten signature

aromático, de 6 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; con la condición de que el compuesto no sea un compuesto en el que simultáneamente $n = 0$, $m = 1$, $q = 0$, $Y = CO$ y R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: NMe_2 , pirrolidinilo, $NMeCH_2Ph$, morfolinilo, piperidilo, $NHEt$, NEt_2 , $NHMe$, $NHCH_2$ -tetrahydrofuran-2-ilo, $NH(CH_2)_2Ph$, $NH(CH_2)Ph$, $NHtBu$ y $NH(CH_2)_3OMe$.

3.- Un compuesto de fórmula (If) o una sal o solvato del mismo:

10

15



(If)

en el que: q es 0 ó 1; n es 0, 1 ó 2; X es CR^6R^7 , donde cada uno de R^6 y R^7 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo y flúor, pero R^6 y R^7 no son los dos simultáneamente metilo; o, cuando n es 1, R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 miembros; Y se selecciona entre el grupo que consiste en CO , NR^8CO , SO , SO_2 y NR^8SO_2 ; R^8 se selecciona entre el

20

grupo que consiste en hidrógeno, alqueno de C_{2-4} y alquilo de C_{1-4} ; m es 0 ó 1; y (a)(i) cuando n es 0 y $m = 1$ e Y es CO, entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con metilo, (iii) NHR^2 y (iv) NR^2R^3 , donde: R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo $-(CH_2)_pZ$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxilo, metoxi, NHMe, fenilo o un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; $R^{2'}$ se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(CH_2)_pZ'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxilo, metoxi, NHMe, fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o $R^{2'}$ y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxilo, $NR^{13}R^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no

482
H

aromático, de 6 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxilo, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{2-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; (a)(ii) cuando n es 0 y $m = 1$ e Y es NR^8CO , SO , SO_2 o NR^8SO_2 , entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) NHR^2 y (iii) $\text{NR}^{2'}\text{R}^3$, donde: R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxilo, metoxi, NHMe , fenilo o un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; $\text{R}^{2'}$ se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxilo, metoxi, NHMe , fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o $\text{R}^{2'}$ y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo,

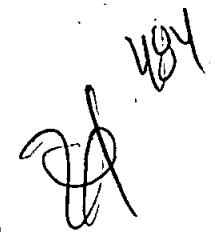
hidroxi, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados

5 independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxi, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; (b) cuando n y m son los dos simultáneamente 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: alcoxi de C_{1-6} ; un grupo heterocíclico de 5 ó 6

10 miembros, monocíclico, saturado o parcialmente insaturado, unido a través de un átomo de carbono y opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; pirrolidinilo N-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados

15 independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; y oxazolilo o imidazolilo, estando los dos opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} ; c) cuando n es 1 ó 2, y m es 1, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , bencilo, ciclopropilo, tienilo, y NR^9R^{10} donde: R^9 se selecciona entre el grupo que

20 consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4} , y R^{10} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, cicloalquilo de C_{3-6} y $(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ donde p es 1, 2 ó 3; Z es un grupo fenilo o heterocíclico de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido



con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo y alquilo de C_{1-4} ; o R^9 y R^{10} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 miembros, o un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando cualquiera de los anillos opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, fenilo y (en el caso de un anillo no aromático) ceto; y d) cuando n es 1 ó 2, y m es 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en ciano, hidroxilo, NH_2 , un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y cicloalquilo de C_{3-6} , y $NR^{11}R^{12}$ en el que: R^{11} es hidrógeno y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} ; o R^{11} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y alquenilo de C_{2-4} , y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ fenilo y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} o R^{11} y R^{12} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en: (i) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, haloalquilo de C_{1-4} , hidroxilo, cicloalquilo de C_{3-6} y alcoxi de C_{1-4} ; y (ii) imidazolilo sustituido con fenilo; (iii) un grupo heterocíclico, no

FL 489

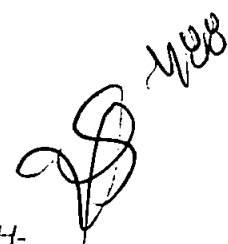
aromático, de 5 miembros, que está sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C₁₋₄; y (iv) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C₁₋₄; con la condición de que el compuesto no sea un compuesto en el que simultáneamente $n = 0$, $m = 1$, $q = 0$, $Y = CO$ y R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: NMe₂, pirrolidina, NMeCH₂Ph, morfolinilo, piperidilo, NH₂Et, NEt₂, NHMe, NHCH₂-tetrahydrofuran-2-ilo, NH(CH₂)₂Ph, NH(CH₂)Ph, NHtBu y NH(CH₂)₃OMe.

4.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 ó 3, caracterizado además porque se selecciona entre el grupo que consiste en: *N*-etil-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-butil-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-(2-feniletíl)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N,N*-dimetil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etanona; 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-1-propanona; 1-[4-(metilsulfonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol; 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-2-propanona; *N,N*-dimetil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 1-{4-[2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indazol; *N*-etil-*N*-

- metil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida;
N-metil-*N*-(fenilmetil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; *N*-butil-*N*-metil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; *N*-metil-*N*-(2-feniletil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 1-{[4-(1-pirrolidinilcarbonil)fenil]metil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[1-metil-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N,N*-dimetil-3-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}propanamida; 1-{4-[3-oxo-3-(1-pirrolidinil)propil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[1-(1-pirrolidinilcarbonil)ciclopropil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[2-oxo-2-(1-piperidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[2-(3,3-difluoro-1-pirrolidinil)-2-oxoetil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-metil-*N*-propil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; *N*-ciclopentil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; *N*-metil-*N*-(2-tienilmetil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; {4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetanitrilo; {4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metanol; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-pirrolidinona; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; *N*-etil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida;



- 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-piperidinona; 1-metil-5-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-2-pirrolidinona; *N*-[3-(1*H*-imidazol-1-il)propil]-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-[2-(2-tienil)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-[2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-(1,3-tiazol-2-ilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida); *N*-metil-*N*-[2-(1-metil-1*H*-pirrol-2-il)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-(2-tienilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-(3-piridinilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-(2-furanilmetil)-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-[(4-fluorofenil)metil]-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)metanosulfonamida; 1-{4-[1-fluoro-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[1,1-difluoro-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)metanosulfonamida; 1-(4-{3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]metil}fenil)-2-pirrolidinona; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-1-pirrolidinacarboxamida; 5-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-2-pirrolidinona; *N*-(1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-



- 1-il]fenil}etil)acetamida; *N*-metil-*N*-(1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etil)acetamida; 1-[4-(1-acetil-2-pirrolidinil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-(2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etil)-2-pirrolidinona; 1-{4-[(1,1-dioxido-2-isotiazolidinil)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 2-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)butanamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-tiofenocarboxamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; *N*-metil-2-fenil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; *N*-(2-hidroxietil)-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-[2-(metiloxi)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; *N*-metil-*N*-[2-(metilamino)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-pirrolidinol; *N*-metil-1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-pirrolidinamina; 1-[4-(1-azetidilcarbonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-azetidinol; (3,3-difluorociclobutil){4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metanona; 1-[4-(1*H*-imidazol-1-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-({4-[3-

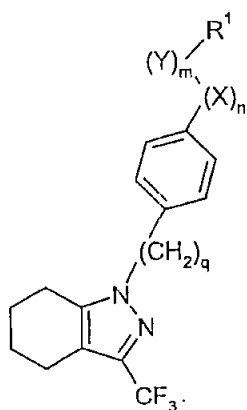
- (trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; *N*-(1-metiletenil)-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; 1-{4-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-{4-[(3-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-metil-*N*-(1-metiletil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 1-{4-[2-oxo-2-(2-fenil-1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)benzamida; 1-[4-(1,3-oxazol-5-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(propiloxi)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(1-metil-1*H*-imidazol-4-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propanosulfonamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)ciclopropanosulfonamida; *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)ciclopentanosulfonamida; 1-[4-(1-pirrolidinilsulfonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-(2-metilpropil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 1-[4-(4-morfolinilsulfonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-[2-(metiloxi)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; *N*-[2-(1-pirrolidinil)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; *N*-(tetrahidro-2-

- furanilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 1-[4-(1*H*-imidazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(1*H*-1,2,4-triazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(1*H*-pirazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-(2*H*-1,2,3-triazol-2-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-[(4-metil-1*H*-pirazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-[(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 3-(trifluorometil)-1-(4-{[3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil}fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 3-(trifluorometil)-1-(4-{[5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil}fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-(4-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil}fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-(4-{[3-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil}fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-[(2-metil-1*H*-imidazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-(4-{[2-(1-metiletil)-1*H*-imidazol-1-il]metil}fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-[(4-fenil-1*H*-imidazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 1-[4-[(4-bromo-1*H*-pirazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; *N*-metil-1*H*-imidazol-2-il){4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metanona; *N*-metil-*N*-(4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil)-1-pirrolidinacarboxamida; y sales y solvatos de los mismos.

491

5.- Un compuesto de fórmula (I), o una sal o solvato del mismo, para su uso como un medicamento:

5

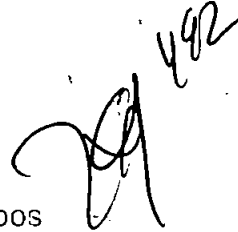


(I)

10 en el que: q es 0 ó 1; n es 0,1 ó 2; X es CR^6R^7 , donde cada uno de R^6 y R^7 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo y flúor, pero R^6 y R^7 no son los dos simultáneamente metilo; o, cuando n es 1, R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 miembros; Y se selecciona entre el grupo

15 que consiste en CO, NR^8CO , SO, SO_2 y NR^8SO_2 ; R^8 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo de C_{1-4} y alquenilo de C_{1-4} ; m es 0 ó 1; y a) cuando n es 0 y m = 1, entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con metilo, (iii) NHR^2 y (iv)

20 NR^2R^3 , donde: R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo - $(CH_2)_pZ$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxí, metoxi, NHMe, fenilo o un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o



heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; donde cuando Y es CO, R^2 no es $(CH_2)_2$ pirrolidinilo; R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y

5 etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(CH_2)_pZ'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxí, metoxi, NHMe, fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en

10 halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o R^2 y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxí, $NR^{13}R^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan

15 independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_1 -4), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxí, $NR^{13}R^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente

20 entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{2-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; b) cuando n y m son los dos simultáneamente 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: alcoxi de C_{1-6} ; un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, monocíclico, saturado o parcialmente

493
70

insaturado, unido a través de un átomo de carbono y opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; pirrolidinilo N-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres

5 grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; y oxazolilo o imidazolilo, estando los dos opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} ; c)

cuando n es 1 ó 2, y m es 1, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , bencilo, ciclopropilo, tienilo y NR^9R^{10} donde: R^9 se selecciona

10 entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4} , y R^{10} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena recta, cicloalquilo de C_{3-6} y $-(CH_2)_pZ$ donde p es 1, 2 ó 3; Z es un grupo fenilo o heterocíclico de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo

15 que consiste en halo y alquilo de C_{1-4} ; o R^9 y R^{10} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 miembros, o un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando cualquiera de los anillos opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que

20 consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, fenilo y (en el caso de un anillo no aromático) ceto; y d) cuando n es 1 ó 2, y m es 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en ciano, hidroxilo, NH_2 , un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos

3A 494

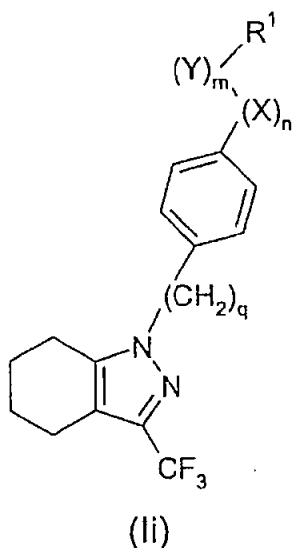
seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y cicloalquilo de C_{3-6} , y $NR^{11}R^{12}$ donde: R^{11} es hidrógeno y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} ; o R^{11} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y alquenilo de C_{2-4} , y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ fenilo y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} o R^{11} y R^{12} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en: (i) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, haloalquilo de C_{1-4} , hidroxilo, cicloalquilo de C_{3-6} y alcoxi de C_{1-4} ; y (ii) imidazolilo sustituido con fenilo; (iii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 miembros, que está sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; y (iv) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; excluyendo 4-metil-N-[4-[4,5,6,7-tetrahidro-3-(trifluorometil)-1H-indazol-1-il]fenil]-1,2,3-tiadiazol-5-carboxamida y sales de la misma.

495

6.- Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, y al menos un vehículo, diluyente o excipiente.

7.- Un compuesto de fórmula (li) o una sal o solvato del mismo, para su uso en el tratamiento de una enfermedad o afección que está mediada por el receptor de glutamato:

10



15

en el que: q es 0 ó 1; n es 0, 1 ó 2; X es CR^6R^7 , donde cada uno de R^6 y R^7 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo y flúor, pero R^6 y R^7 no son los dos simultáneamente metilo; o, cuando n es 1, R^6 y R^7 junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 miembros; Y se selecciona entre el grupo que consiste en CO, NR^8CO , SO, SO_2 y NR^8SO_2 ; R^8 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alqueno de C_{2-4} y alquilo de C_{1-4} ; m es 0 ó 1; y a) cuando n es 0 y m = 1, entonces R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en (i) alquilo de C_{1-4} , (ii) un grupo heterocíclico, aromático, de 5

20

3B 496

miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con metilo, (iii) NHR^2 y (iv) $\text{NR}^{2'}\text{R}^3$, donde: R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena ramificada, alquilo de C_{4-6} de cadena ramificada y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z es hidroxí, metoxi, NHMe , fenilo o un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; donde cuando Y es CO , R^2 no es $(\text{CH}_2)_2\text{pirrolidinilo}$; $\text{R}^{2'}$ se selecciona entre el grupo que consiste en metilo y etilo; R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y un grupo $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}'$ en el que p es 1, 2 ó 3; Z' es hidroxí, metoxi, NHMe , fenilo o un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, alquilo de C_{1-4} y haloalquilo de C_{1-4} ; o $\text{R}^{2'}$ y R^3 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman: (i) un grupo heterocíclico, no aromático, de 4 ó 5 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en halo, hidroxí, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), haloalquilo de C_{1-4} y ceto; o (ii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando dicho anillo opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en

498
2/1

halo, hidroxilo, $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (donde R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4}), alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} y ceto; b) cuando n y m son los dos simultáneamente 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en: alcoxi de C_{1-6} ; un grupo

5 heterocíclico de 5 ó 6 miembros, monocíclico, saturado o parcialmente insaturado, unido a través de un átomo de carbono y opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; pirrolidinilo N-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres

10 grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , $\text{C}(\text{O})$ alquilo de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halo y ceto; y oxazolilo o imidazolilo, estando los dos opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} ; c) cuando n es 1 ó 2, y m es 1, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , bencilo, ciclopropilo, tienilo, y NR^9R^{10} donde: R^9 se selecciona

15 entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo de C_{1-4} , y R^{10} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} de cadena recta, cicloalquilo de C_{3-6} y $-(\text{CH}_2)_p\text{Z}$ donde p es 1, 2 ó 3; Z es un grupo fenilo o heterocíclico de 5 ó 6 miembros, estando el grupo fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo

20 que consiste en halo y alquilo de C_{1-4} ; o R^9 y R^{10} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo heterocíclico, aromático o no aromático, de 5 miembros, o un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, estando cualquiera de los anillos opcionalmente sustituido con uno,

498
S

dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, fenilo y (en el caso de un anillo no aromático) ceto; y d) cuando n es 1 ó 2, y m es 0, R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en ciano, hidroxilo, NH_2 , un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, C-enlazado, opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-6} y cicloalquilo de C_{3-6} , y $NR^{11}R^{12}$ donde: R^{11} es hidrógeno y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} ; o R^{11} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} y alquenilo de C_{2-4} , y R^{12} se selecciona entre el grupo que consiste en SO_2 alquilo de C_{1-4} , SO_2 cicloalquilo de C_{3-6} , $C(O)$ alquilo de C_{1-4} , $C(O)$ fenilo y $C(O)$ alquenilo de C_{2-4} o R^{11} y R^{12} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en: (i) un grupo heterocíclico, aromático, de 5 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo de C_{1-4} , halo, haloalquilo de C_{1-4} , hidroxilo, cicloalquilo de C_{3-6} y alcoxi de C_{1-4} ; y (ii) imidazolilo sustituido con fenilo; (iii) un grupo heterocíclico, no aromático, de 5 miembros, que está sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto, hidroxilo y alcoxi de C_{1-4} ; y (iv) un grupo heterocíclico, no aromático, de 6 miembros, que está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres grupos seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en ceto,

hidroxi y alcoxí de C₁₋₄, excluyendo 4-metil-N-[4-[4,5,6,7-tetrahidro-3-(trifluorometil)-1H-indazol-1-il]fenilo]-1,2,3-tiadiazol-5-carboxamida y sales de éstos.

- 8.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 5 o la
- 5 reivindicación 7, caracterizado además porque se selecciona entre el grupo que consiste en: 1) *N,N*-dimetil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]benzamida; 2) 1-[4-(1-pirrolidinilcarbonyl)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol; 3) *N*-metil-*N*-(fenilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]benzamida; 4) *N*-etil-*N*-metil-4-[3-
- 10 (trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]benzamida; 5) *N*-butil-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]benzamida; 6) *N*-metil-*N*-(2-feniletil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]benzamida; 7) *N,N*-dimetil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-
- il]bencenosulfonamida; 8) 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-
- 15 1-il]fenil}etanona; 9) 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]fenil}-1-propanona; 10) 1-[4-(metilsulfonyl)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol; 11) 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]fenil}-2-propanona; 12) *N,N*-dimetil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]fenil}acetamida; 13) 1-{4-[2-oxo-2-(1-
- 20 pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol; 14) *N*-etil-*N*-metil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]fenil}acetamida; 15) *N*-metil-*N*-(fenilmetil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol-1-il]fenil}acetamida; 16) *N*-butil-*N*-metil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-

- 1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 17) *N*-metil-*N*-(2-feniletil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 18) 1-{[4-(1-pirrolidinilcarbonil)fenil]metil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol;
- 19) 1-{4-[1-metil-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 20) *N,N*-dimetil-3-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}propanamida; 21) 1-{4-[3-oxo-3-(1-pirrolidinil)propil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 22) 1-{4-[1-(1-pirrolidinilcarbonil)ciclopropil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 23) 1-{4-[2-oxo-2-(1-piperidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 24) 1-{4-[2-(3,3-difluoro-1-pirrolidinil)-2-oxoetil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 25) *N*-metil-*N*-propil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 26) *N*-ciclopentil-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 27) *N*-metil-*N*-(2-tienilmetil)-2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetamida; 28) {4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}acetanitrilo; 29) {4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metanol; 30) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; 31) 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-pirrolidinona; 32) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; 33) *N*-etil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; 34) 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-piperidinona; 35) 1-metil-5-{4-[3-

- (trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-2-pirrolidinona; 36) *N*-[3-(1*H*-imidazol-1-il)propil]-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 37) *N*-metil-*N*-[2-(2-tienil)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 38) *N*-metil-*N*-[2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 39) *N*-metil-*N*-(1,3-tiazol-2-ilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 40) *N*-metil-*N*-[2-(1-metil-1*H*-pirrol-2-il)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 41) *N*-metil-*N*-(2-tienilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 42) *N*-metil-*N*-(3-piridinilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 43) *N*-(2-furanilmetil)-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 44) *N*-[(4-fluorofenil)metil]-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 45) 1-[4-(4-morfolinilcarbonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 46) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)metanosulfonamida; 47) 1-{4-[1-fluoro-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 48) 1-{4-[1,1-difluoro-2-oxo-2-(1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 49) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)metanosulfonamida; 50) 1-(4-{[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]metil}fenil)-2-pirrolidinona; 51) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-1-pirrolidinacarboxamida; 52) 5-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-2-pirrolidinona; 53)

7/22/02
 10502
 [Signature]

- N*-(1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etil)acetamida;
 54) *N*-metil-*N*-(1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etil)acetamida; 55) 1-[4-(1-acetil-2-pirrolidinil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 56) 1-(2-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}etil)-2-pirrolidinona; 57) 1-{4-[(1,1-dioxido-2-isotiazolidinil)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 58) 2-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; 59) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)butanamida; 60) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-tiofenocarboxamida; 61) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)propanamida; 62) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; 63) *N*-metil-2-fenil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)acetamida; 64) *N*-(2-hidroxietil)-*N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 65) *N*-metil-*N*-[2-(metiloxi)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 66) *N*-metil-*N*-[2-(metilamino)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 67) 1-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-pirrolidinol; 68) *N*-metil-1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-pirrolidinamina; 69) 1-[4-(1-azetidini)carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 70) 1-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}carbonil)-3-azetidinol; 71) (3,3-difluorociclobutil){4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-

- indazol-1-il]fenil}metanona; 72) 1-[4-(1*H*-imidazol-1-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 73) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; 74) *N*-(1-metiletenil)-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; 75) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propenamida; 76) 1-{4-[(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 77) 1-{4-[(3-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol-5-il)metil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 78) *N*-etil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 79) *N*-metil-*N*-(1-metiletil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 80) 1-[4-(1-piperidinilcarbonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 81) *N,N*-dietil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 82) *N*-metil-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]benzamida; 83) 1-{4-[2-oxo-2-(2-fenil-1-pirrolidinil)etil]fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 84) *N*-metil-*N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)benzamida; 85) 1-[4-(1,3-oxazol-5-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 86) 1-[4-(propiloxi)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 87) 1-[4-(1-metil-1*H*-imidazol-4-il)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 88) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)-2-propanosulfonamida; 89) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)ciclopropanosulfonamida; 90) *N*-({4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metil)ciclopentanosulfonamida; 91) 1-[4-(1-

Handwritten signature and number 504.

- pirrolidinilsulfonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 92) *N*-(2-metilpropil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 93) 1-[4-(4-morfolinilsulfonil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 94) *N*-[2-(metiloxi)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 95) *N*-[2-(1-pirrolidinil)etil]-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 96) *N*-(tetrahidro-2-furanilmetil)-4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]bencenosulfonamida; 97) 1-[4-(1*H*-imidazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 98) 1-[4-(1*H*-1,2,4-triazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 99) 1-[4-(1*H*-pirazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 100) 1-[4-(1*H*-1,2,3-triazol-1-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 101) 1-[4-(2*H*-1,2,3-triazol-2-ilmetil)fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 102) 1-[4-[(4-metil-1*H*-pirazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 103) 1-[4-[(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 104) 3-(trifluorometil)-1-(4-[[3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil]fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 105) 3-(trifluorometil)-1-(4-[[5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil]fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 106) 1-(4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil]fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 107) 1-(4-[[3-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]metil]fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 108) 1-[4-[(2-metil-1*H*-imidazol-1-il)metil]fenil]-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 109) 1-(4-[[2-(1-

metiletil)-1*H*-imidazol-1-il]metil}fenil)-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 110) 1-{4-[(4-fenil-1*H*-imidazol-1-il)metil}fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 111) 1-{4-[(4-bromo-1*H*-pirazol-1-il)metil}fenil}-3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol; 112) *N*-metil-1*H*-imidazol-2-il){4-
5 [3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}metanona; 113) *N*-metil-*N*-{4-[3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol-1-il]fenil}-1-pirrolidinacarboxamida; y sales y solvatos de los mismos.

9.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 7 o la reivindicación 8, caracterizado además porque la enfermedad es
10 esquizofrenia.

10.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 7 o la reivindicación 8, caracterizado además porque la enfermedad es deterioro cognitivo.

11.- El uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las
15 reivindicaciones 5, 7 y 8 en la fabricación de un medicamento para tratar una enfermedad o una afección mediada por una reducción o desequilibrio en la función del receptor de glutamato.

12.- El uso como se reclama en la reivindicación 11, en el que la enfermedad es esquizofrenia.

20 13.- El uso como se reclama en la reivindicación 11, en el que la enfermedad es deterioro cognitivo.

14.- Un método de tratamiento de una enfermedad o afección mediada por una reducción o desequilibrio en la función del receptor de

506

glutamato en un mamífero, que comprende administrar una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 5, 7 y 8.

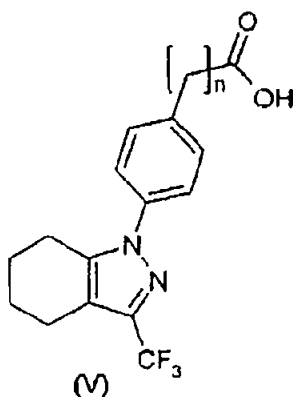
15.- El método como se reclama en la reivindicación 14, en el que la enfermedad es esquizofrenia.

5 16.- El método como se reclama en la reivindicación 14, en el que la enfermedad es deterioro cognitivo.

17.- Un producto de combinación que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 5-8 con un antipsicótico.

18.- Un compuesto de fórmula (V) y sales y solvatos del mismo:

10

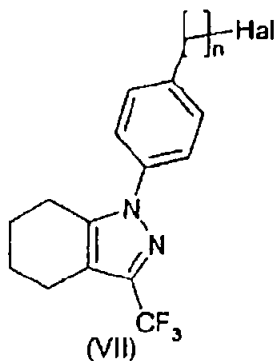


15

donde n es 0,1 ó 2.

19.- Un compuesto de fórmula (VII) y sales y solvatos del mismo:

20

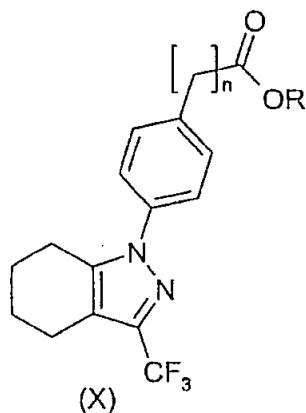


507

Donde n es 1 o 2 y Hal es halógeno; o $n=0$ y Hal es flúor, bromo o yodo.

20.- Un compuesto de fórmula (X) y sales y solvatos del mismo:

5

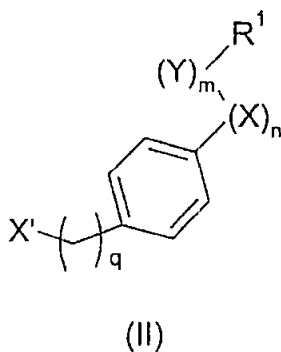


10

Donde $n=0$ y R es alquilo C_{2-4} , o $n=1$ o 2 y R es alquilo C_{1-4} .

21.- Un procedimiento para la fabricación de un compuesto de fórmula (II) como se ha definido en la reivindicación 7, comprendiendo dicho procedimiento acoplar un compuesto de fórmula (II):

15



20

en la que X' es un grupo saliente y X , Y , c , m , n y R^1 son como se han definido para la fórmula (I) en la reivindicación 8, con 3-(trifluorometil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol; y después de esto opcionalmente: - retirar



2020
Bogotá D.C.,

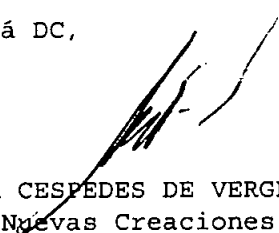
Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
GLAXO GROUP LIMITED

REFERENCIA	Radicación No.	08 99640
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/052568
	Fecha inicio fase nacional	20/10/2008
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	9410
	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,

03 DIC. 2009


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

adpa10

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 08-099640

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**
FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **613** DE
FECHA **19 DE FEBRERO DE 2010** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA
LEY EXPIRA EL **25 DE MAYO DEL 2010**

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 ☒