



No. 09-046886- -00001-0000

Fecha: 2009-06-04 15:18:29 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2009/000078

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: ASTRAZENECA AB

Dirección: S-151 85 Södertalje

Nacionalidad o Domicilio: Suecia

Lugar de Constitución: Suecia

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: J. IAN RAISBECK

Dirección: World Trade Center Torre A

Calle 100 No. 8A-37 Piso 10. Bogotá

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 79.376.996 Bta
TP 135.799

4

Número de expediente:
09-046.886

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA

6

Comprobante de pago No. _____

Fecha _____

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa y Capítulo Reivindicatorio Modificado.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: J. IAN RAISBECK

FIRMA: _____

J. Ian Raisbeck

C.C. 79.376.996 Bta T.P. 135.799

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

Las Reivindicaciones 14-16, 18-27 y 29-33 han sido retiradas del Capítulo Reivindicatorio.

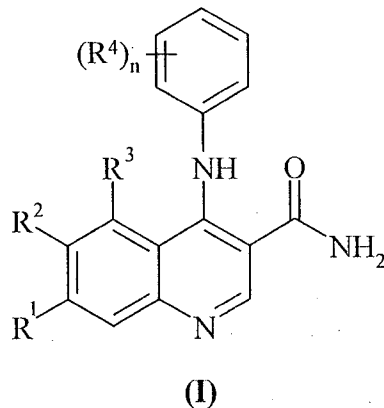
ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

Las Reivindicaciones 14-16, 18-27 y 29-33 han sido retiradas del Capítulo Reivindicatorio.

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(MODIFICACIONES VOLUNTARIAS)

9

1. Un compuesto de fórmula (I):



donde:

uno de R^1 y R^2 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^5 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^6 ; y

el otro R^1 o R^2 se selecciona de hidrógeno, halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, amino, carboxi, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono; donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^7 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^8 ;

R^3 es hidrógeno o halo;

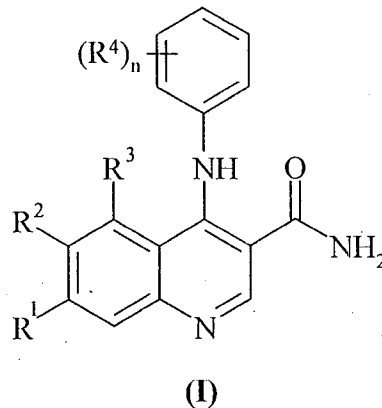
R^4 se selecciona de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ carbamoilo, C_{1-6} alquilS(O) $_a$ donde a es 0 a 2, C_{1-6} alcoxycarbonilo, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino,

209

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(MODIFICACIONES VOLUNTARIAS)

6

1. Un compuesto de fórmula (I):



donde:

uno de R^1 y R^2 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^5 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^6 ; y

el otro R^1 o R^2 se selecciona de hidrógeno, halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, amino, carboxi, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono; donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^7 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^8 ;

R^3 es hidrógeno o halo;

R^4 se selecciona de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ carbamoilo, C_{1-6} alquilS(O) $_a$ donde a es 0 a 2, C_{1-6} alcoxycarbonilo, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino,

carbociclilo o heterociclilo; donde R^4 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^9 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{10} ;

o donde si dos grupos R^4 están en carbonos adyacentes, pueden formar opcionalmente un anillo carbocíclico o un anillo heterocíclico; donde dicho anillo carbocíclico o heterocíclico puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{11} ; y donde si dicho anillo heterocíclico contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{12} ;

n es 0-3; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes;

R^5 , R^7 , R^9 y R^{11} se seleccionan independientemente de halo, nitro, ciano, hidroxi, trifluorometoxi, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil)₂amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)₂carbamoilo, C_{1-6} alquilS(O)_a donde a es 0 a 2, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alcoxycarbonilamino, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)₂sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino, carbociclil- R^{13} - o heterociclil- R^{14} -; donde R^5 , R^7 , R^9 y R^{11} , independientemente uno de otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R^{15} ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{16} ;

R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente de un enlace directo, -O-, -N(R^{17})-, -C(O)-, -N(R^{18})C(O)-, -C(O)N(R^{19})-, -S(O)_s-, -SO₂N(R^{20})- o -N(R^{21})SO₂-; donde R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} y R^{21} se seleccionan independientemente de hidrógeno o C_{1-6} alquilo y s es 0-2;

R^6 , R^8 , R^{10} , R^{12} y R^{16} se seleccionan independientemente de C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alquilsulfonilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo, carbamoilo, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, bencilo, benciloxycarbonilo, benzoilo y fenilsulfonilo; donde R^6 , R^8 , R^{10} , R^{12} y R^{16} , independientemente uno de otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R^{22} ; y

R^{15} y R^{22} se seleccionan independientemente de halo, nitro, ciano, hidroxi, trifluorometoxi, trifluorometilo, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, acetilo, acetoxi, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, N -metil- N -etilamino, acetilamino, N -metilcarbamoilo, N -etilcarbamoilo, N,N -dimetilcarbamoilo, N,N -dietilcarbamoilo, N -metil- N -etilcarbamoilo, fenilo,

carbociclilo o heterociclilo; donde R^4 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^9 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{10} ;

o donde si dos grupos R^4 están en carbonos adyacentes, pueden formar opcionalmente un anillo carbocíclico o un anillo heterocíclico; donde dicho anillo carbocíclico o heterocíclico puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{11} ; y donde si dicho anillo heterocíclico contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{12} ;

n es 0-3; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes;

R^5 , R^7 , R^9 y R^{11} se seleccionan independientemente de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquenilo, C_{2-6} alquinilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcanoiloxi, N -(C_{1-6} alquil)amino, N,N -(C_{1-6} alquil)₂amino, N -(C_{1-6} alquil)- N -(C_{1-6} alcoxi)amino, C_{1-6} alcanoilamino, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)₂carbamoilo, C_{1-6} alquilS(O)_a donde a es 0 a 2, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alcoxycarbonilamino, N -(C_{1-6} alquil)sulfamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)₂sulfamoilo, C_{1-6} alquilsulfonilamino, carbocicilil- R^{13} - o heterocicilil- R^{14} -; donde R^5 , R^7 , R^9 y R^{11} , independientemente uno de otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R^{15} ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^{16} ;

R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente de un enlace directo, -O-, -N(R^{17})-, -C(O)-, -N(R^{18})C(O)-, -C(O)N(R^{19})-, -S(O)_s-, -SO₂N(R^{20})- o -N(R^{21})SO₂-; donde R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} y R^{21} se seleccionan independientemente de hidrógeno o C_{1-6} alquilo y s es 0-2;

R^6 , R^8 , R^{10} , R^{12} y R^{16} se seleccionan independientemente de C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alquilsulfonilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo, carbamoilo, N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil)carbamoilo, bencilo, benciloxycarbonilo, benzoilo y fenilsulfonilo; donde R^6 , R^8 , R^{10} , R^{12} y R^{16} , independientemente uno de otro, pueden estar opcionalmente sustituidos en el carbono con uno o más R^{22} ; y

R^{15} y R^{22} se seleccionan independientemente de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, trifluorometilo, amino, carboxi, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, acetilo, acetoxi, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, N -metil- N -etilamino, acetilamino, N -metilcarbamoilo, N -etilcarbamoilo, N,N -dimetilcarbamoilo, N,N -dietilcarbamoilo, N -metil- N -etilcarbamoilo, fenilo,

metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *N*-metilsulfamoilo, *N*-etilsulfamoilo, *N,N*-dimetilsulfamoilo, *N,N*-dietilsulfamoilo o *N*-metil-*N*-etilsulfamoilo;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables;
con la condición de que si R^1 es fenilo o pirid-4-ilo, R^2 no sea hidrógeno.

2. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en la Reivindicación 1 donde uno de R^1 y R^2 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^5 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^6 ; y

el otro R^1 o R^2 se selecciona de C_{1-6} alcoxi;

R^5 se selecciona de hidroxilo, amino, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcoxi, *N,N*-(C_{1-6} alquil)₂amino, C_{1-6} alcoxycarbonilamino, carbociclil- R^{13} - o heterociclil- R^{14} -;

R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente de un enlace directo, -O-, -N(R^{17})-; donde R^{17} es hidrógeno;

R^6 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo; donde R^6 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{22} ; y

R^{22} se selecciona de hidroxilo o metoxi.

3. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en la Reivindicación 1 o la Reivindicación 2 donde R^3 es hidrógeno.

4. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-3 donde R^4 se selecciona de halo y C_{1-6} alquilo.

5. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-4 donde n es 1 ó 2; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes.

metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *N*-metilsulfamoilo, *N*-etilsulfamoilo, *N,N*-dimetilsulfamoilo, *N,N*-dietilsulfamoilo o *N*-metil-*N*-etilsulfamoilo;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables;

con la condición de que si R^1 es fenilo o pirid-4-ilo, R^2 no sea hidrógeno.

2. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en la Reivindicación 1 donde uno de R^1 y R^2 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{2-6} alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, donde este R^1 o R^2 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^5 ; y donde si dicho heterociclilo contiene una porción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de R^6 ; y

el otro R^1 o R^2 se selecciona de C_{1-6} alcoxi;

R^5 se selecciona de hidroxilo, amino, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcoxi, *N,N*-(C_{1-6} alquil)₂amino, C_{1-6} alcoxycarbonilamino, carbociclil- R^{13} - o heterociclil- R^{14} -;

R^{13} y R^{14} se seleccionan independientemente de un enlace directo, -O-, -N(R^{17})-; donde R^{17} es hidrógeno;

R^6 se selecciona de C_{1-6} alquilo, C_{1-6} alcanoilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo; donde R^6 puede estar opcionalmente sustituido en el carbono con uno o más R^{22} ; y

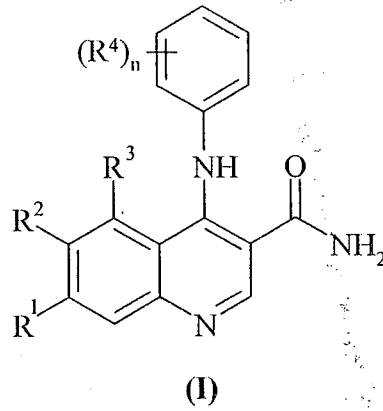
R^{22} se selecciona de hidroxilo o metoxilo.

3. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en la Reivindicación 1 o la Reivindicación 2 donde R^3 es hidrógeno.

4. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-3 donde R^4 se selecciona de halo y C_{1-6} alquilo.

5. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-4 donde n es 1 ó 2; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes.

6. Un compuesto de fórmula (I):



donde:

uno de R^1 y R^2 se selecciona de 1-(2-hidroxietyl)-4-piperidilo, 1-(3-metoxipropanoil)-4-piperidilo, 1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-ilo, 1-[(2R)-2-hidroxiopropanoil]-4-piperidilo, 1-acetil-3,6-dihidro-2H-piridin-4-ilo, 1-acetil-4-piperidilo, 1H-pirazol-4-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1-isobutilpirazol-4-ilo, 1-isopropil-4-piperidilo, 1-metil-4-piperidilo, 1-terc-butoxicarbonil-3,6-dihidro-2H-piridin-4-ilo, 3-(1-piperidil)propilo, 3-(ciclopropilamino)propilo, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, 3-aminopropilo, 3-dimetilaminopropilo, 3-hidroxi-prop-1-inilo, 3-hidroxi-propilo, 3-piridilo, 4-piperidilo, 4-piridilo, 6-metoxi-3-piridilo, 6-oxo-1H-piridin-3-ilo, ciclopropilo, pirimidin-5-ilo, 3-(*t*-butoxicarbonilamino)propilo o 3-(tetrahidro-2H-piran-2-iloxi)propilo;

el otro R^1 o R^2 se selecciona de metoxi o etoxi.

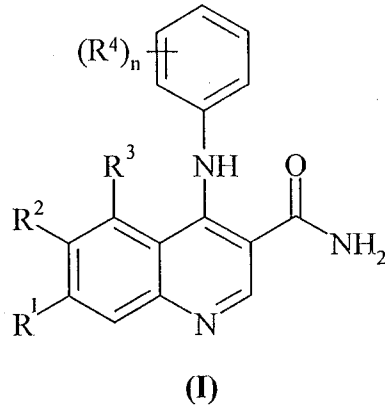
R^3 es hidrógeno;

R^4 se selecciona de fluoro, cloro, metilo y etilo;

n es 1 ó 2; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

6. Un compuesto de fórmula (I):



donde:

uno de R^1 y R^2 se selecciona de 1-(2-hidroxietil)-4-piperidilo, 1-(3-metoxipropanoil)-4-piperidilo, 1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-ilo, 1-[(2R)-2-hidroxiopropanoil]-4-piperidilo, 1-acetil-3,6-dihidro-2H-piridin-4-ilo, 1-acetil-4-piperidilo, 1H-pirazol-4-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1-isobutylpirazol-4-ilo, 1-isopropil-4-piperidilo, 1-metil-4-piperidilo, 1-terc-butoxicarbonil-3,6-dihidro-2H-piridin-4-ilo, 3-(1-piperidil)propilo, 3-(ciclopropilamino)propilo, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, 3-aminopropilo, 3-dimetilaminopropilo, 3-hidroxi-prop-1-inilo, 3-hidroxi-propilo, 3-piridilo, 4-piperidilo, 4-piridilo, 6-metoxi-3-piridilo, 6-oxo-1H-piridin-3-ilo, ciclopropilo, pirimidin-5-ilo, 3-(*t*-butoxicarbonilamino)propilo o 3-(tetrahydro-2H-piran-2-iloxi)propilo;

el otro R^1 o R^2 se selecciona de metoxi o etoxi.

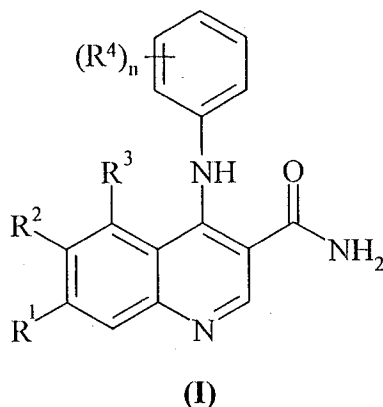
R^3 es hidrógeno;

R^4 se selecciona de fluoro, cloro, metilo y etilo;

n es 1 ó 2; donde los valores de R^4 son iguales o diferentes;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

7. Un compuesto de fórmula (I):

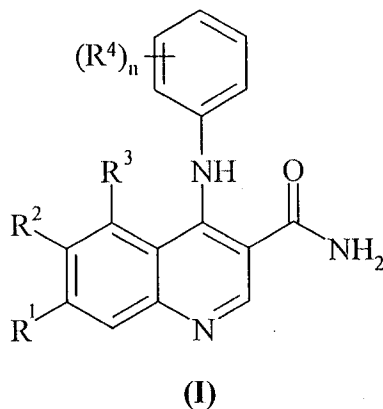


seleccionado de:

7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolina-3-carboxamida; y
4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolina-3-carboxamida;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

8. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables como los que se reivindican en la Reivindicación 1, donde el proceso comprende:

7. Un compuesto de fórmula (I):

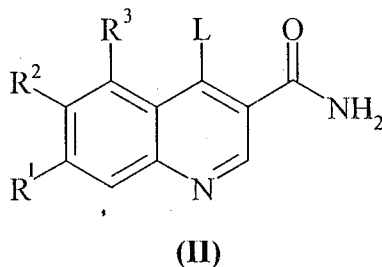


seleccionado de:

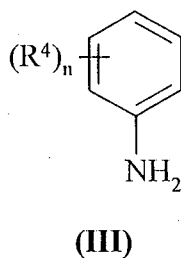
7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-etoxi-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
7-etoxi-4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-7-metoxi-6-(1-metilpiperidin-4-il)quinolina-3-carboxamida;
4-[(2-fluoro-4-metilfenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolona-3-carboxamida;
4-[(2,4-difluorofenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolona-3-carboxamida; y
4-[(3-cloro-2-fluorofenil)amino]-6-(1-isopropilpiperidin-4-il)-7-metoxiquinolona-3-carboxamida;
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

8. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables como los que se reivindican en la Reivindicación 1, donde el proceso comprende:

Proceso a) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II):

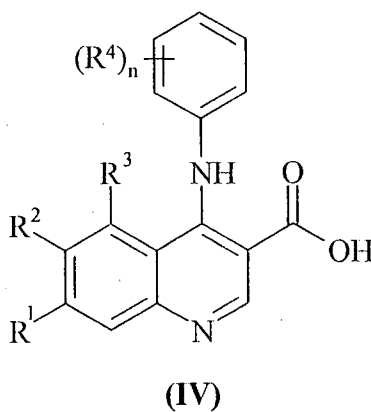


donde L es un átomo o grupo que se puede desplazar; con un compuesto de fórmula (III):



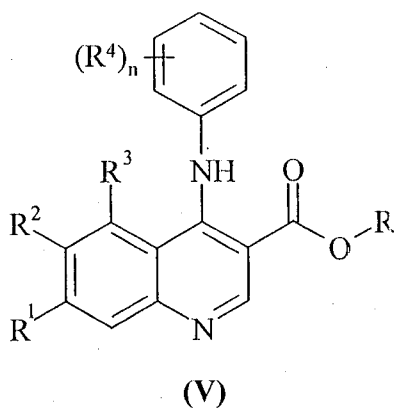
o

Proceso b) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (IV):



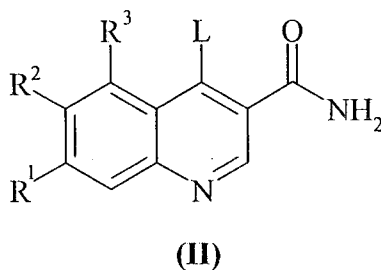
o uno de sus derivados activados; con amoníaco; o

Proceso c) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V):

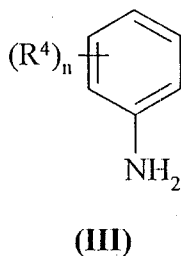


donde R es C₁₋₆alquilo, en particular metilo y etilo; con formamida y una base;

Proceso a) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II):

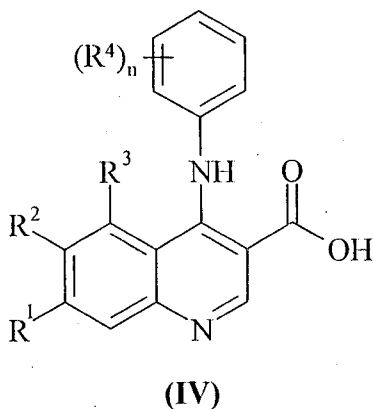


donde L es un átomo o grupo que se puede desplazar; con un compuesto de fórmula (III):



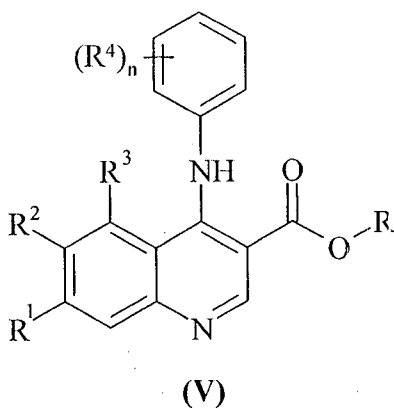
o

Proceso b) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (IV):



o uno de sus derivados activados; con amoníaco; o

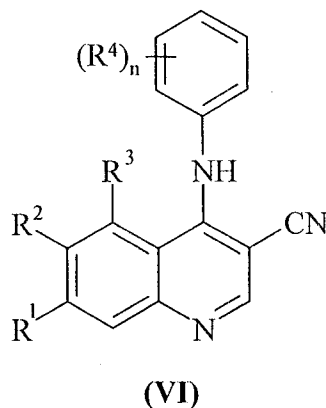
Proceso c) hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V):



donde R es C₁₋₆alquilo, en particular metilo y etilo; con formamida y una base;

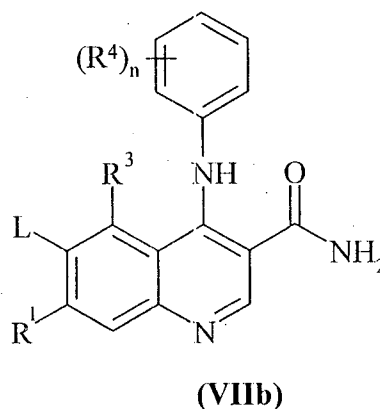
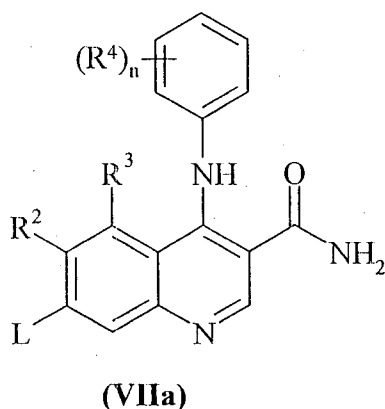
o

Proceso d) hidrólisis de un compuesto de fórmula (VI):

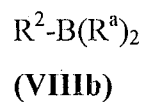
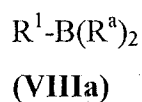


o

Proceso e) para compuestos de fórmula (I) cuando uno de R¹ y R² se selecciona de C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, opcionalmente sustituido como se indica precedentemente; por reacción de un compuesto de fórmula (VIIa) o (VIIb):



donde L es un grupo que se puede desplazar; con un compuesto de fórmula (VIIIa) o (VIIIb)



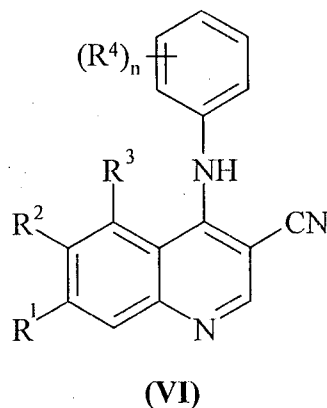
donde -B(R^a)₂ es un derivado del ácido borónico o trialquilborano;

y después si fuera necesario:

- i) convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I);
- ii) eliminar todos los grupos protectores;
- iii) formar una sal farmacéuticamente aceptable.

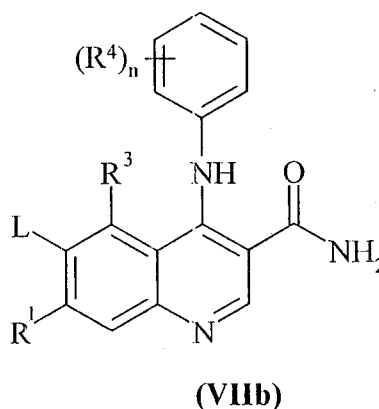
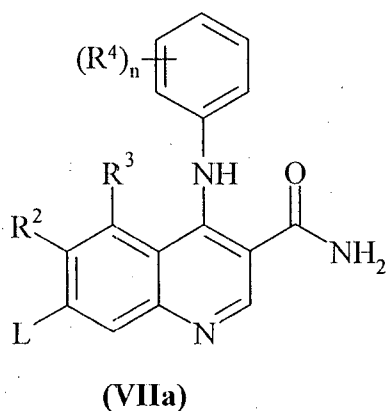
o

Proceso d) hidrólisis de un compuesto de fórmula (VI):

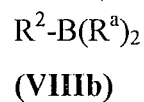
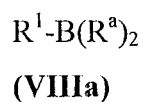


o

Proceso e) para compuestos de fórmula (I) cuando uno de R¹ y R² se selecciona de C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, carbociclilo o heterociclilo unido a carbono, opcionalmente sustituido como se indica precedentemente; por reacción de un compuesto de fórmula (VIIa) o (VIIb):



donde L es un grupo que se puede desplazar; con un compuesto de fórmula (VIIIa) o (VIIIb)



donde -B(R^a)₂ es un derivado del ácido borónico o trialquilborano;

y después si fuera necesario:

- i) convertir un compuesto de fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I);
- ii) eliminar todos los grupos protectores;
- iii) formar una sal farmacéuticamente aceptable.

9. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en asociación con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

10. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, para usar como un medicamento.

11. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para producir un efecto inhibitorio de la quinasa CSF-1R en un animal de sangre caliente como un ser humano.

12. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para producir un efecto anticancerígeno en un animal de sangre caliente como un ser humano.

13. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de melanoma, tumores tiroideos papilares, colangiocarcinomas, cáncer de colon, cáncer de ovario, cáncer de pulmón, leucemias, tumores malignos linfoides, carcinomas y sarcomas en hígado, riñón, vejiga, próstata, mama y páncreas, tumores sólidos primarios y recurrentes de piel, colon, tiroides, pulmones y ovarios.

14. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en asociación con un diluyente o portador farmacéuticamente aceptable para usar en la producción de un efecto anticancerígeno en un animal de sangre caliente como un ser humano.

20

9. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en asociación con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

10. Un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, para usar como un medicamento.

11. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para producir un efecto inhibitorio de la quinasa CSF-1R en un animal de sangre caliente como un ser humano.

12. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para producir un efecto anticancerígeno en un animal de sangre caliente como un ser humano.

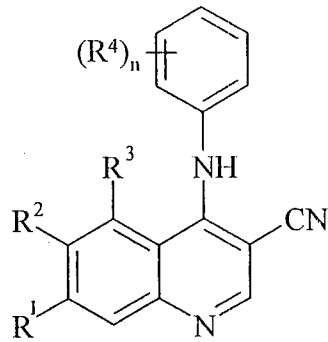
13. El uso de un compuesto de fórmula (I), o de una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de melanoma, tumores tiroideos papilares, colangiocarcinomas, cáncer de colon, cáncer de ovario, cáncer de pulmón, leucemias, tumores malignos linfoides, carcinomas y sarcomas en hígado, riñón, vejiga, próstata, mama y páncreas, tumores sólidos primarios y recurrentes de piel, colon, tiroides, pulmones y ovarios.

14. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de fórmula (I), o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, como los que se reivindican en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7, en asociación con un diluyente o portador farmacéuticamente aceptable para usar en la producción de un efecto anticancerígeno en un animal de sangre caliente como un ser humano.

224

21

15. Un compuesto de fórmula (VI):



(VI)

donde R₁-R₄ y n son los definidos en cualquiera de las Reivindicaciones 1-7.

225