

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____



Ref: Expediente N° 09-062.879

Solicitud de Patente de Invención "ACILAMINOPIRAZOLES COMO
INHIBIDORES DE FGFR"

Solicitante: ASTRAZENECA AB

Nuestra Re: P2009/000103

RESPUESTA AL OFICIO N° 8676 NOTIFICADO

POR FIJACION EN LISTA No. 230, DE FECHA 31 DE JULIO DE 2009,

(EXAMEN DE FORMA)

J. IAN RAISBECK, 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 12 del Código Contencioso Administrativo en los siguientes términos:

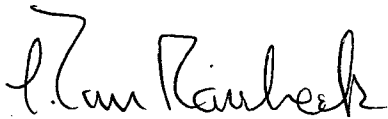
1. En respuesta a la única observación del Examinador me permito adjuntar un nuevo Capítulo Reivindicatorio Modificado, en donde han sido eliminadas las reivindicaciones 17-20, 23, 25-27 y las reivindicaciones 21, 22 y 24 se renumeraron a 17, 18 y 19 respectivamente, para tal efecto adjunto la tasa correspondiente a dicha modificación.

2

2. Adicionalmente me permito adjuntar un recibo por el valor de \$100.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente a 4 reivindicaciones adicionales, con el fin de que se tengan en cuenta dentro del presente trámite, según la Resolución No. 55819 del 26 de Diciembre de 2008.

3. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,



J. IAN RAISBECK
C.C. N°. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799

Anexo: Capitulo Reivindicatorio Modificado
Tasa de Modificación (\$111.000)
Tasa por 5 Reivindicaciones Adicionales (\$100.000)

837

09/103

3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-062879- -00005-0000

Fecha: 2009-09-14 17:10:20 Dep. 2020 NUECREACIONE
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 34

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 67,032
 FECHA : SEPTIEMBRE 9 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
DLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	33886425	08/09/2009	5,498,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	111,000.00
TOTAL :			\$ 111,000.00

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

838

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-062879- -00005-0000

Fecha: 2009-09-14 17:10:20 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 34

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 67,030

FECHA : SEPTIEMBRE 9 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
DLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	33886425	08/09/2009	5,498,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
			TOTAL :
			\$ 100,000.00

SON: CIEN MIL PESOS

RESPONSABLE :

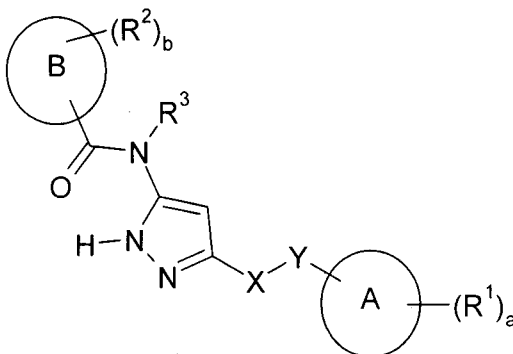
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo
en la que

el anillo A representa un grupo aromático de 5 ó 6 miembros que comprende
opcionalmente al menos un heteroátomo anular seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre;

el anillo B representa un grupo aromático de 5 ó 6 miembros que comprende
opcionalmente al menos un heteroátomo anular seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre;

cada R¹ representa independientemente

un halógeno,

un grupo hidroxilo,

un grupo ciano,

un grupo alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más
sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio,
-NR⁴R⁵ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno
o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃,
alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y
trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo cicloalquilo C₃₋₅ opcionalmente sustituido con uno o más
sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-,
alquiltio C₁-C₃, -NR⁶R⁷ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente
sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo

C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo alqueno C₂-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁸R⁹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio, -NR¹⁰R¹¹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo heterociclilo de 4 a 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio, -NR¹²R¹³ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo alcoxi C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, -NR¹⁴R¹⁵, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo -NR¹⁶R¹⁷,

un grupo -OCOR¹⁸,

un grupo -CO₂R¹⁹,

un grupo -CONR²⁰R²¹,

un grupo -NR²²COR²³,

un grupo -NR²⁴CO₂R²⁵,

un grupo -OSO₂R²⁶,

o dos grupos R^1 adyacentes, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo carbociclilo o heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3- , alquil C_1-C_3 -tio, $-NR^{27}R^{28}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo;

cada R^2 representa independientemente

un grupo hidroxilo,
un halógeno,
un grupo ciano,
un grupo $-CO_2R^{29}$,
un grupo $-CONR^{30}R^{31}$,
un grupo $-NR^{32}COR^{33}$,
un grupo $-NR^{34}CO_2R^{35}$,
un grupo $-NR^{36}R^{37}$,
un grupo $-SO_2R^{38}$,
un grupo $-SO_2NR^{39}R^{40}$,
un grupo $-NR^{41}SO_2R^{42}$,

un grupo alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, $-NR^{43}R^{44}$, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, cicloalquilo C_3-C_6 , amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, ciano, hidroxilo, trifluorometilo y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, cicloalquilo C_3-C_6 , amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, ciano, hidroxilo, trifluorometilo), halógeno, hidroxilo, y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente condensado a un grupo carbociclilo o heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_1-C_6 -

862

tio, $-\text{NR}^{45}\text{R}^{46}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{47}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), ciano, halógeno e hidroxilo,

5 un grupo cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, $-\text{NR}^{48}\text{R}^{49}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo, y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, $-\text{NR}^{50}\text{R}^{51}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

10 un grupo alqueno $\text{C}_2\text{-C}_6$ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo, y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, $-\text{NR}^{54}\text{R}^{55}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

20 un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente condensado a un grupo carbociclilo o heterociclilo de 4 a 7 miembros y opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alqueno $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquino $\text{C}_2\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -carbonilo, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, $-\text{NR}^{56}\text{R}^{57}$, SO_2R^{58} (cada uno de los cuales

puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo),
5
opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, -NR⁵⁹R⁶⁰, -SO₂R⁶¹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

un grupo alcoxi C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, -NR⁶²R⁶³ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₆-tio, -NR⁶⁴R⁶⁵ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

o dos grupos R² adyacentes, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo carbociclilo o heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁶⁶R⁶⁷ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo;

R³ representa hidrógeno,

un grupo alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁶⁸R⁶⁹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno

o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo;

a es 0, 1, 2, 3 ó 4;

b es 0, 1, 2, 3 ó 4;

R⁴ y **R⁵** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R⁴** y **R⁵**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R⁶ y **R⁷** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R⁶** y **R⁷**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R⁸ y **R⁹** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R⁸** y **R⁹**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R¹⁰ y **R¹¹** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R¹⁰** y **R¹¹**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R¹² y **R¹³** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R¹²** y **R¹³**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R¹⁴ y **R¹⁵** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R¹⁴** y **R¹⁵**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R¹⁶ y **R¹⁷** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R¹⁶** y **R¹⁷**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R¹⁸ representa alquilo C₁-C₄, o cicloalquilo C₃-C₆ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{19} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{20} y R^{21} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{20} y R^{21} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{22} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{23} representa alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{24} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{25} representa alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{26} representa alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{27} y R^{28} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{27} y R^{28} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{29} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{30} y R^{31} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{30} y R^{31} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{32} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{33} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 o un grupo aromático de 5 ó 6 miembros que comprende opcionalmente al menos un heteroátomo anular seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{34} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{35} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R^{36} y R^{37} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 o un grupo aromático de 5 ó 6 miembros que comprende opcionalmente al menos un heteroátomo anular seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre, o R^{36} y R^{37} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros (cada uno de los cuales puede

estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo, trifluorometilo y un grupo carbociclilo o heterociclilo de 4 a 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo, trifluorometilo);

R³⁸ representa alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R³⁹ y **R⁴⁰** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R³⁹** y **R⁴⁰**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R⁴¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R⁴² representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo);

R⁴³ y **R⁴⁴** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R⁴³** y **R⁴⁴**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R⁴⁵ y **R⁴⁶** representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, o **R⁴⁵** y **R⁴⁶**, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R⁴⁷ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R^{48} y R^{49} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{48} y R^{49} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{50} y R^{51} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{50} y R^{51} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{52} y R^{53} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{52} y R^{53} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{54} y R^{55} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{54} y R^{55} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{56} y R^{57} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{56} y R^{57} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{58} representa alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^{59} y R^{60} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{59} y R^{60} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{61} representa alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^{62} y R^{63} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{62} y R^{63} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{64} y R^{65} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{64} y R^{65} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{66} y R^{67} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{66} y R^{67} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros;

R^{68} y R^{69} representan cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 , o R^{68} y R^{69} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclilo saturado de 4 a 6 miembros; y en la que

849

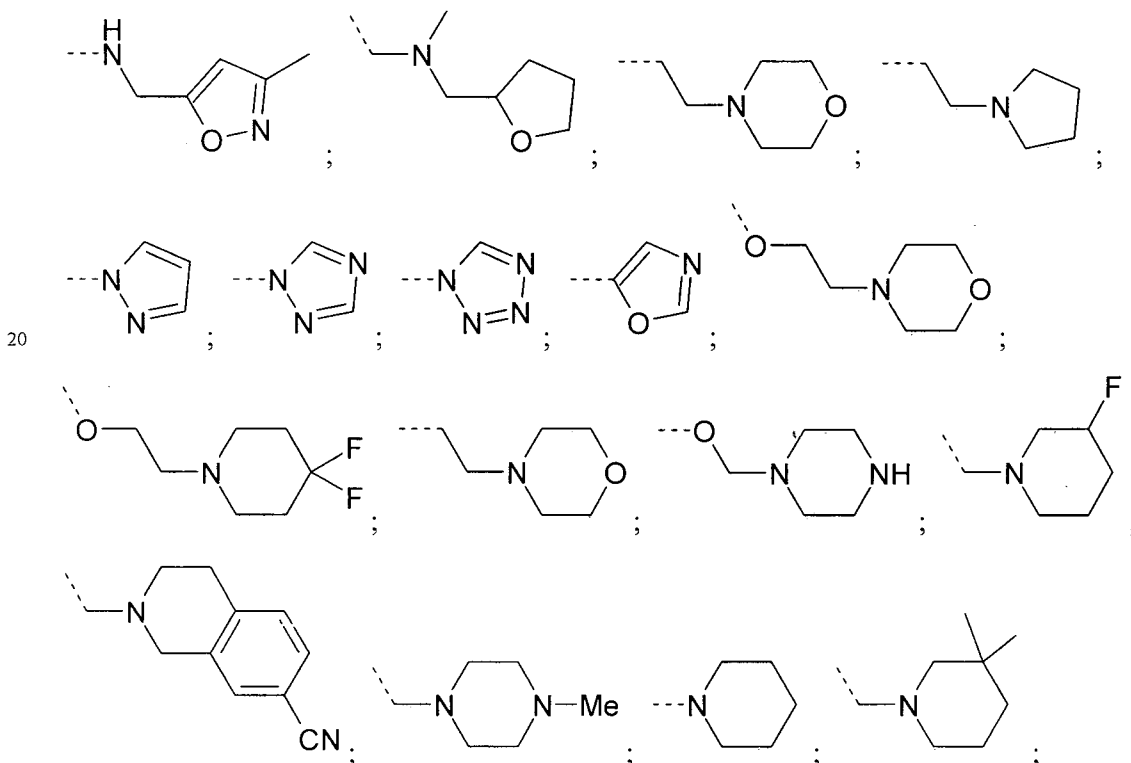
cuando Y representa CH₂, X representa CH₂, O, NR⁷⁰ o S(O)_x, en el que R⁷⁰ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, y x es 0, 1 ó 2; o cuando X representa CH₂, Y representa CH₂, O, NR⁷¹ o S(O)_y, en el que R⁷¹ respresenta hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆, e y es 0, 1 ó 2.

5

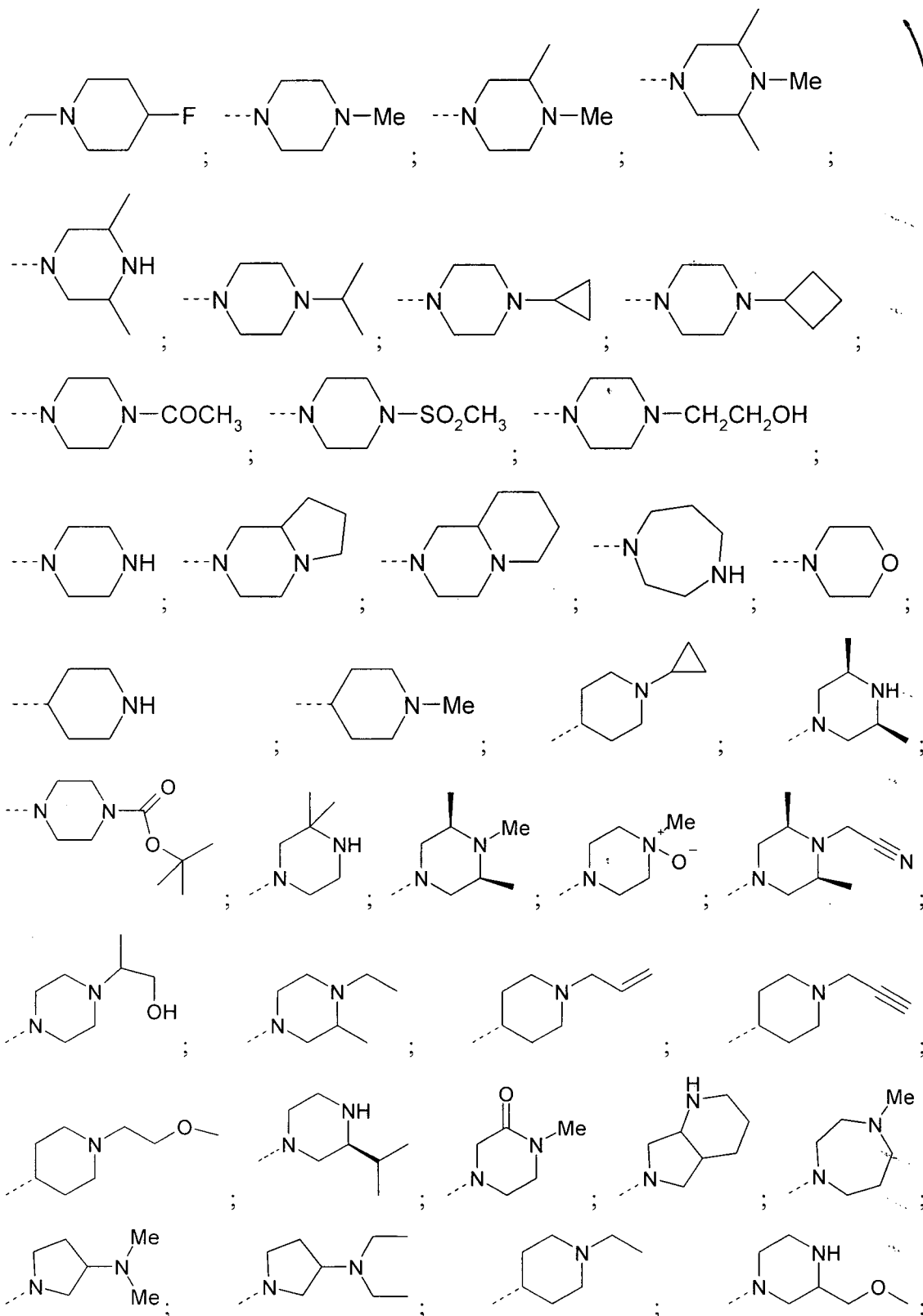
2. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en el que R³ es hidrógeno.

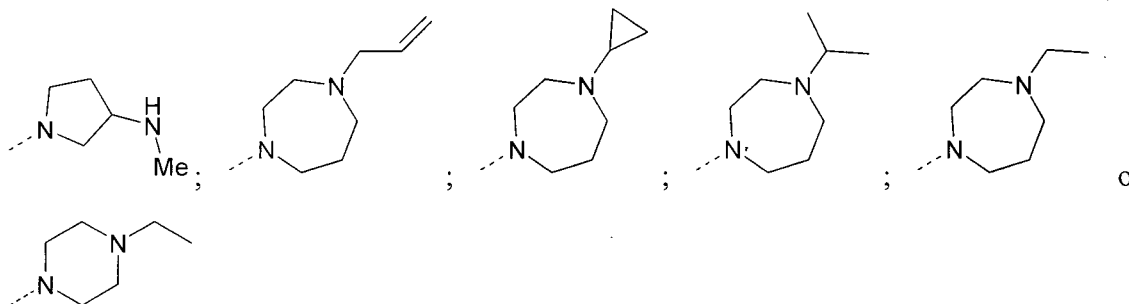
3. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1 ó 2, en el que X representa CH₂ o O; e Y representa CH₂.

4. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que cada R² representa independientemente un grupo -Cl; -F; -I; -OH; -CN; -CH₃; -CH₂OH; -CH₂N(CH₃)₂; -CH₂CH(CH₃)NH₂; -OCH₃; -OCH₂CH₂OH; -OCH₂CH₂OCH₂CH₃; -SO₂CH₃; -N(CH₃)₂; -NHPh; -NHCH₂C≡CH; -NHCH₂CH₃; -NHCH₂CH₂N(CH₃)₂; -NHCO₂CH₂CH=CH₂; -NHCOCH₃; -NHCOH; -NHCOPh; -CONH₂; -NHSO₂Me; -SO₂N(CH₃)₂; -CO₂H; -CO₂CH₃; -CO₂CH₂CH₃;



850





5. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
5 según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que cada R^1 representa
independientemente un grupo alcoxi C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o más
sustituyentes seleccionados de alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3- , $-NR^{14}R^{15}$, (cada uno de los
cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de
halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino,
10 hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o un grupo $-CONR^{20}R^{21}$.

6. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que el anillo A representa un anillo furilo,
fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo o tiazolilo.

7. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que el anillo B representa un anillo furilo,
fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo o tiazolilo.

20 8. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
según la reivindicación 1, en el que:

el anillo A representa un anillo furilo, fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo,
pirimidinilo, tienilo o tiazolilo;

25 el anillo B representa un anillo furilo, fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo,
pirimidinilo, tienilo o tiazolilo;

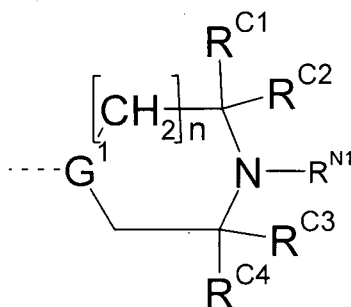
cada R^1 representa independientemente

un grupo alcoxi C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes
seleccionados de alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3- , $-NR^{14}R^{15}$, (cada uno de los cuales puede
estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno,

alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

un grupo -CONR²⁰R²¹;

R² representa



en la que

G¹ es C o N,

n es 1 ó 2,

R^{C1}, R^{C2}, R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de alquilo C₁-C₃,

alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₅, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno, halógeno e hidroxilo, o

R^{C1} y R^{C2} y/o R^{C3} y R^{C4}, junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo, o

R^{C1} y R^{C3}, junto con los átomos a los que están unidos y el átomo de nitrógeno al que está unido el grupo R^{N1}, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo, y

R^{N1} se selecciona de alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de ciano, halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno y un grupo heterocíclico de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₅, alquiltio

C₁-C₃, -NR⁵⁹R⁶⁰, -SO₂R⁶¹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

5 R^{N1} y R^{C4}, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₅, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁵⁶R⁵⁷, SO₂R⁵⁸ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo
10 C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo;

R³ representa hidrógeno;

X representa CH₂ o O;

Y representa CH₂;

15 a es 0, 1 ó 2; y

b es 1.

9. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
20 según la reivindicación 1, en el que:

el anillo A representa un anillo furilo, fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo o tienilo;

el anillo B representa un anillo furilo, fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo o tienilo;

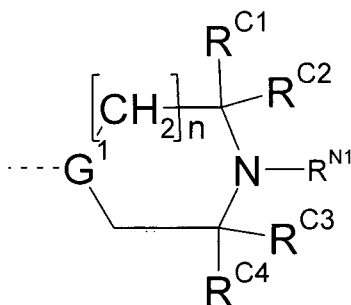
25 cada R¹ representa independientemente

un grupo alcoxi C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-, -NR¹⁴R¹⁵, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₃-amino, hidroxilo y
30 trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

un grupo -CONR²⁰R²¹;

R² representa

[Handwritten signature]



en la que

G^1 es C o N,

n es 1 ó 2,

5 R^{C1} , R^{C2} , R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno, halógeno e hidroxilo, o

10 R^{C1} y R^{C2} y/o R^{C3} y R^{C4} , junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo, o

15 R^{C1} y R^{C3} , junto con los átomos a los que están unidos y el átomo de nitrógeno al que está unido el grupo R^{N1} , forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo, y

20 R^{N1} se selecciona de alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno y un grupo heterocíclico de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , alquil C_1-C_3 -tio, $-NR^{59}R^{60}$,
25 $-SO_2R^{61}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

R^{N1} y R^{C4} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , alquil C_1-C_3 -tio, $-NR^{56}R^{57}$, SO_2R^{58} (cada uno de los cuales puede estar
5 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo;

R^3 representa hidrógeno;
X representa CH_2 o O;
10 Y representa CH_2 ;
a es 0, 1 ó 2; y
b es 1.

10. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
15 según la reivindicación 1, en el que:

el anillo A representa un anillo furilo, fenilo o piridilo;

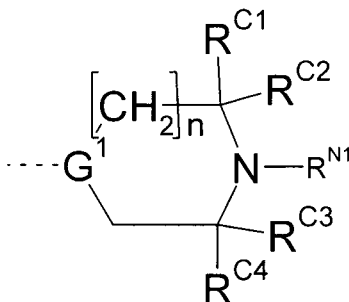
el anillo B representa un anillo fenilo, pirazinilo, piridilo, pirimidinilo o tienilo;

cada R^1 representa independientemente

un grupo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados
20 de alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3- , $-NR^{14}R^{15}$, (cada uno de los cuales puede estar
opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_3 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

un grupo $-CONR^{20}R^{21}$;

25 R^2 representa



en la que

G^1 es C o N,

n es 1 ó 2,

R^{C1} , R^{C2} , R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno, halógeno e hidroxilo, o

R^{C1} y R^{C2} y/o R^{C3} y R^{C4} , junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo, o

R^{C1} y R^{C3} , junto con los átomos a los que están unidos y el átomo de nitrógeno al que está unido el grupo R^{N1} , forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo, y

R^{N1} se selecciona de alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , alquil C_1-C_3 -tio, $-NR^{59}R^{60}$, $-SO_2R^{61}$ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

R^{N1} y R^{C4} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , alquil C_1-C_3 -tio, $-NR^{56}R^{57}$, SO_2R^{58} (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo;

R^3 representa hidrógeno;

X representa CH_2 o O;

Y representa CH_2 ;

a es 0, 1 ó 2; y

b es 1.

5

11. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en el que:

el anillo A representa un anillo fenilo;

el anillo B representa un anillo fenilo, pirazinilo, piridilo, pirimidinilo o tienilo;

10 cada R^1 representa independientemente

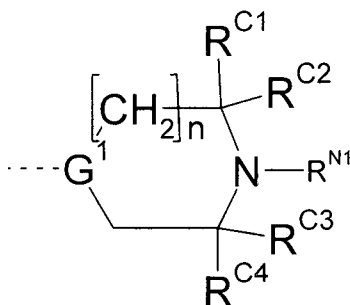
un grupo alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-}$, $-\text{NR}^{14}\text{R}^{15}$, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -amino, hidroxilo y

15

trifluorometilo), halógeno e hidroxilo, o

un grupo $-\text{CONR}^{20}\text{R}^{21}$;

R^2 representa



en la que

20

G^1 es C o N,

n es 1 ó 2,

25

$\text{R}^{\text{C}1}$, $\text{R}^{\text{C}2}$, $\text{R}^{\text{C}3}$ y $\text{R}^{\text{C}4}$ se seleccionan cada uno independientemente de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_3$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_3$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_5$, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_2$ -tio, amino ($-\text{NH}_2$), mono- y di-alquil $\text{C}_1\text{-C}_2$ -amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno, halógeno e hidroxilo, o

$\text{R}^{\text{C}1}$ y $\text{R}^{\text{C}2}$ y/o $\text{R}^{\text{C}3}$ y $\text{R}^{\text{C}4}$, junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más

sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo, o

R^{C1} y R^{C3}, junto con los átomos a los que están unidos y el átomo de nitrógeno al que está unido el grupo R^{N1}, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 a 7 miembros
5 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo, y

R^{N1} se selecciona de alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más
10 sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), hidrógeno y un grupo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₅, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁵⁹R⁶⁰, -SO₂R⁶¹ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más
15 sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno e hidroxilo,

o R^{N1} y R^{C4}, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo de 4 a 7 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes
20 seleccionados de alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₅, alquil C₁-C₃-tio, -NR⁵⁶R⁵⁷, SO₂R⁵⁸ (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₂-tio, amino (-NH₂), mono- y di-alquil C₁-C₂-amino, hidroxilo y trifluorometilo), halógeno, hidroxilo;

25 R³ representa hidrógeno;

X representa CH₂ o O;

Y representa CH₂;

a es 0, 1 ó 2; y

b es 1.

30

12. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en el que:

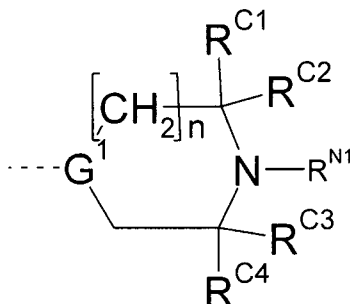
el anillo A representa un anillo fenilo;

el anillo B representa un anillo furilo, fenilo, pirazinilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo o tienilo;

cada R^1 representa independientemente

un grupo alcoxi C_1-C_3 ;

5 R^2 representa



en la que

G^1 es C o N,

n es 1 ó 2,

10 R^{C1} , R^{C2} , R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, metilo, etilo, hidroximetilo, hidroxietilo, metoximetilo, metoxietilo, 2,2,2-trifluoroetilo, o

R^{C3} y R^{C4} , junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico de 3 a 5 miembros,

y

15 R^{N1} se selecciona de alquilo C_1-C_2 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , cicloalquilo C_3-C_5 , (cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , alquil C_1-C_2 -tio, amino ($-NH_2$), mono- y di-alquil C_1-C_2 -amino, hidroxilo y trifluorometilo) e hidrógeno, o

20 R^{N1} y R^{C4} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo de 4 a 7 miembros;

R^3 representa hidrógeno;

X representa CH_2 o O;

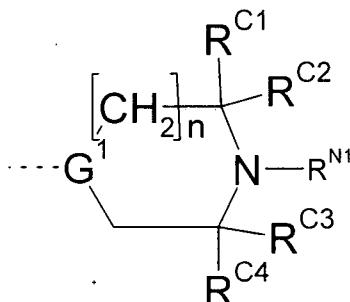
Y representa CH_2 ;

a es 0, 1 ó 2; y

25 b es 1.

13. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según la reivindicación 1, en el que:

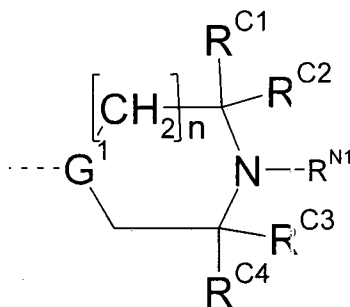
$A(R^1)_a$ representa 3,5-dimetoxifenilo;
el anillo B representa un anillo fenilo, pirazinilo, pirimidinilo o tienilo;
 R^2 representa



- 5 en la que
 G^1 es C o N,
n es 1 ó 2,
 R^{C1} , R^{C2} , R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, metilo,
etilo, hidroximetilo, hidroxietilo, metoximetilo, metoxietilo, 2,2,2-trifluoroetilo, o
10 R^{C3} y R^{C4} , junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo ciclopipilo,
y
 R^{N1} se selecciona de hidrógeno, metilo, etilo, metoxietilo, etoxietilo, hidroxietilo,
propenilo, propinilo, propilo, i-propilo, $-CH(CH_3)CH_2OH$, ciclopipilo, ciclobutilo,
ciclopentilo, o
15 R^{N1} y R^{C4} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo
de 5 ó 6 miembros;
 R^3 representa hidrógeno;
X representa CH_2 o O;
Y representa CH_2 ; y
20 b es 1.

14. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
según la reivindicación 1, en el que:

$A(R^1)_a$ representa 3,5-dimetoxifenilo;
25 el anillo B representa un anillo fenilo, pirazinilo, pirimidinilo o tienilo;
 R^2 representa



en la que

G^1 es C o N,

n es 1,

5 R^{C1} , R^{C2} , R^{C3} y R^{C4} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno, metilo, etilo, hidroximetilo, hidroxietilo, metoximetilo, metoxietilo, 2,2,2-trifluoroetilo, o

R^{C3} y R^{C4} , junto con el átomo al que están unidos, forman un anillo ciclopropilo,

y

10 R^{N1} se selecciona de hidrógeno, metilo, etilo, metoxietilo, etoxietilo, hidroxietilo, propenilo, propinilo, i-propilo, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OH}$, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, o

R^{N1} y R^{C4} , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo heterociclilo de 5 ó 6 miembros;

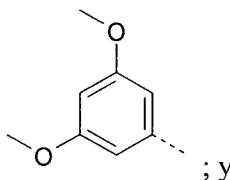
R^3 representa hidrógeno;

X representa CH_2 o O;

15 Y representa CH_2 ; y

b es 1.

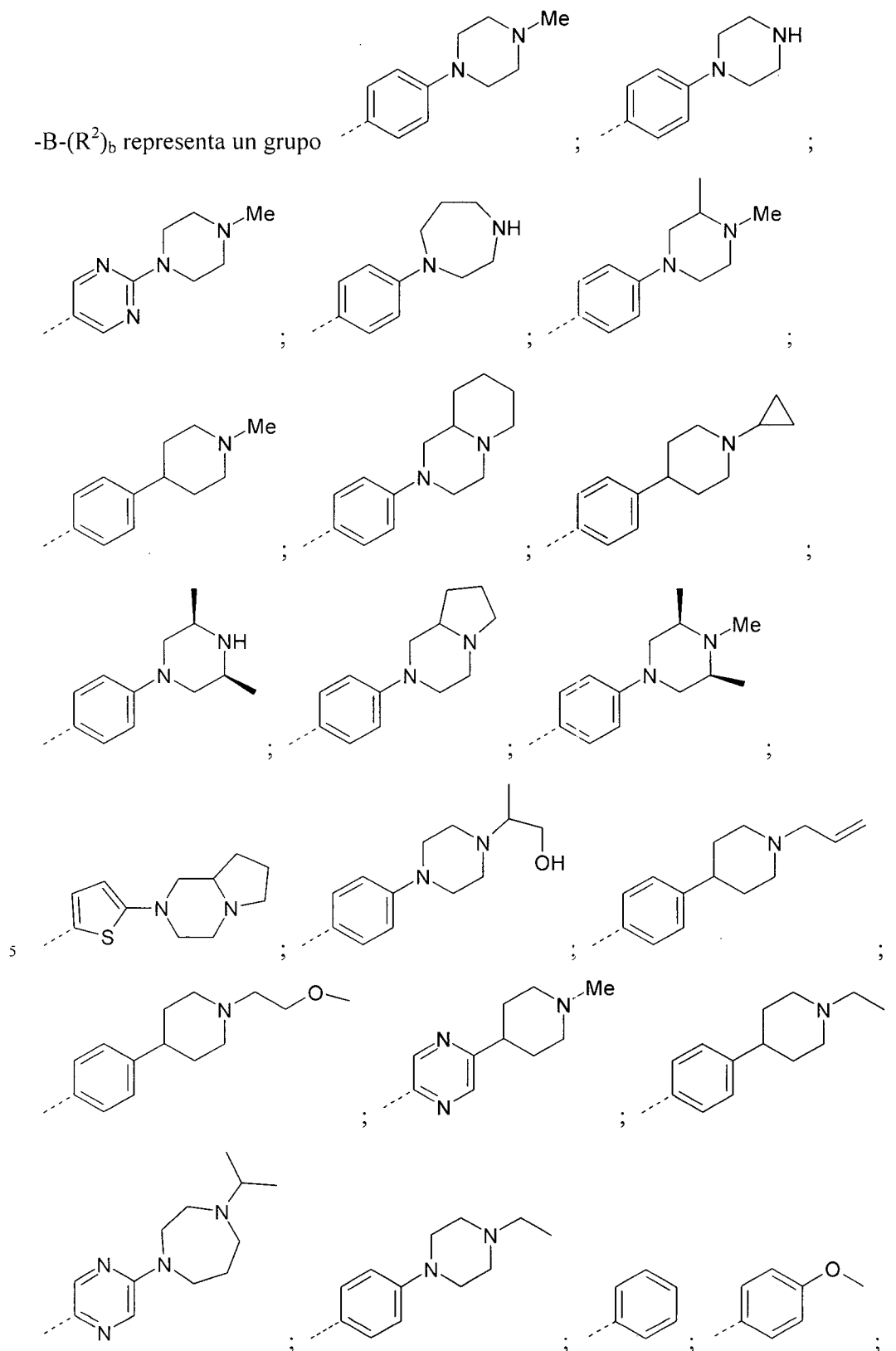
15. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que:



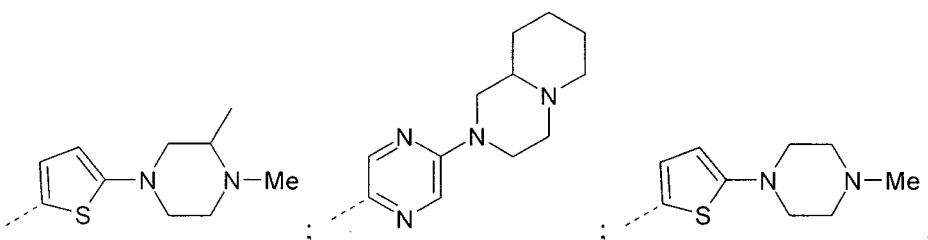
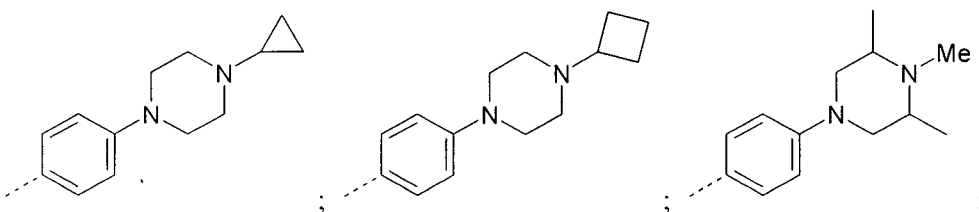
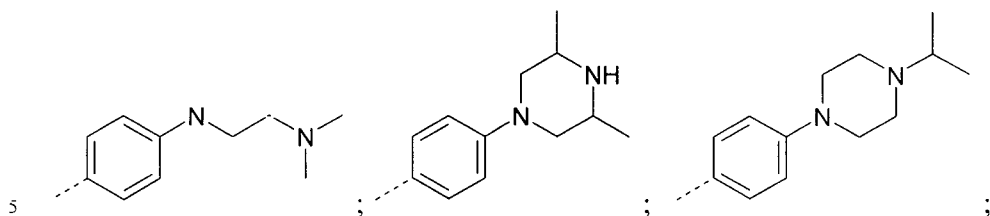
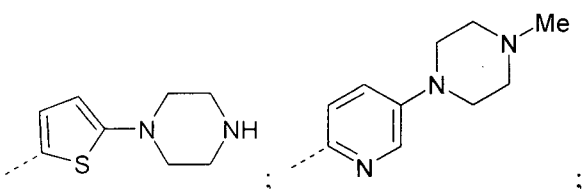
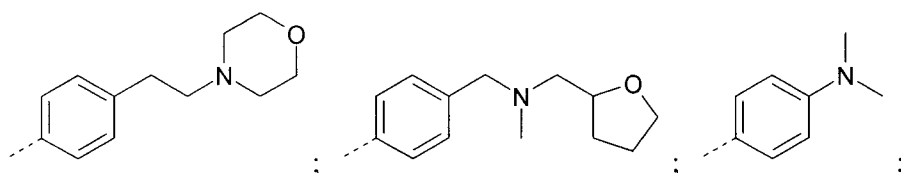
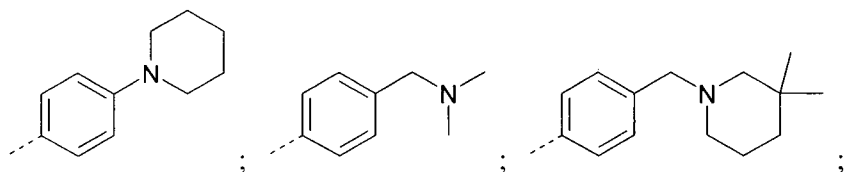
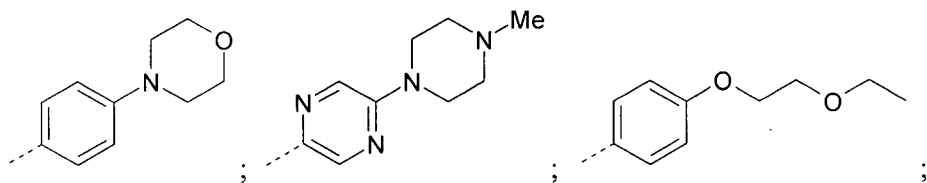
20 $-\text{A}-(\text{R}^1)_a$ representa un grupo

; y

-B-(R²)_b representa un grupo

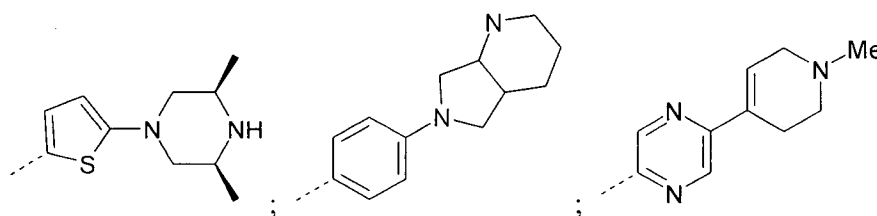
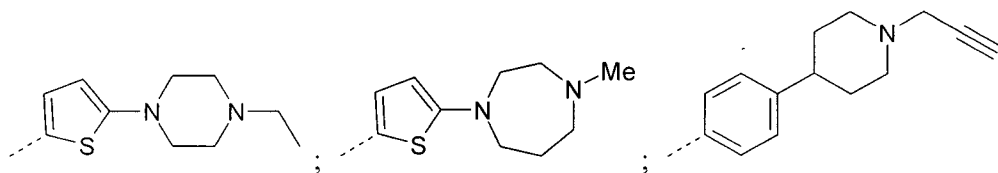
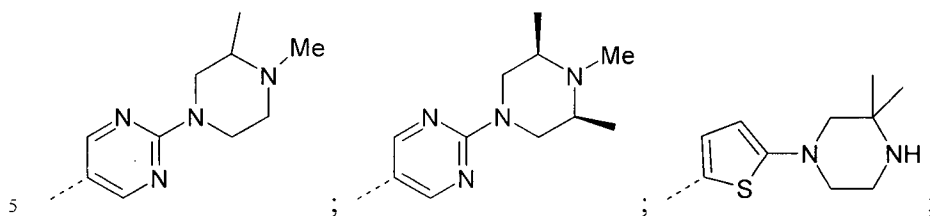
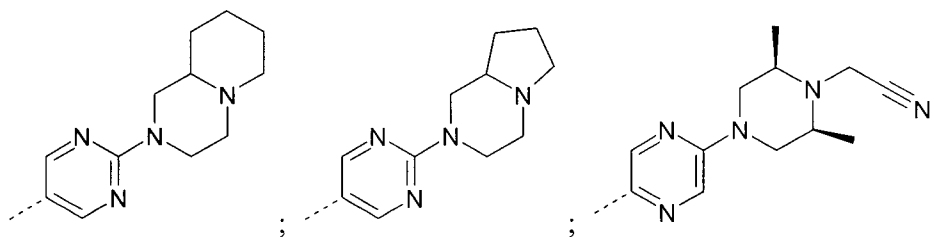
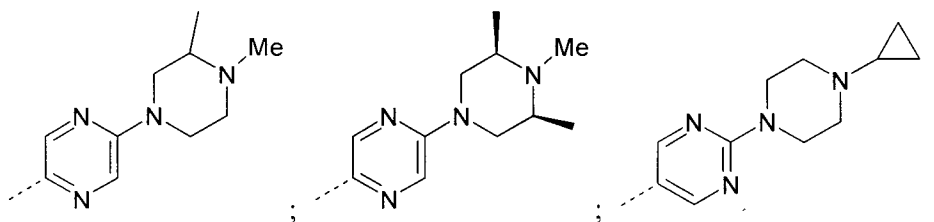
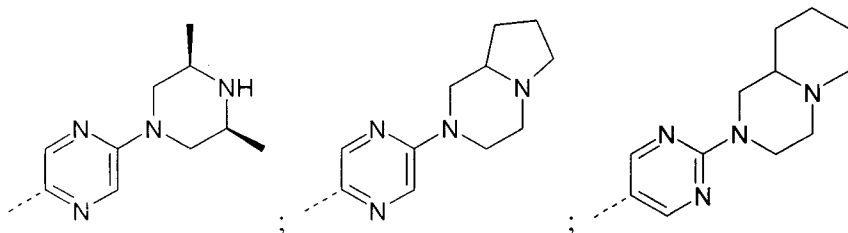
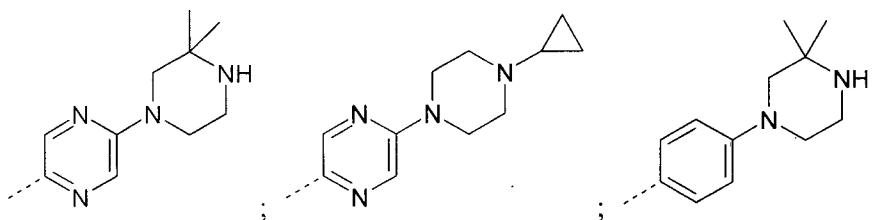


9d



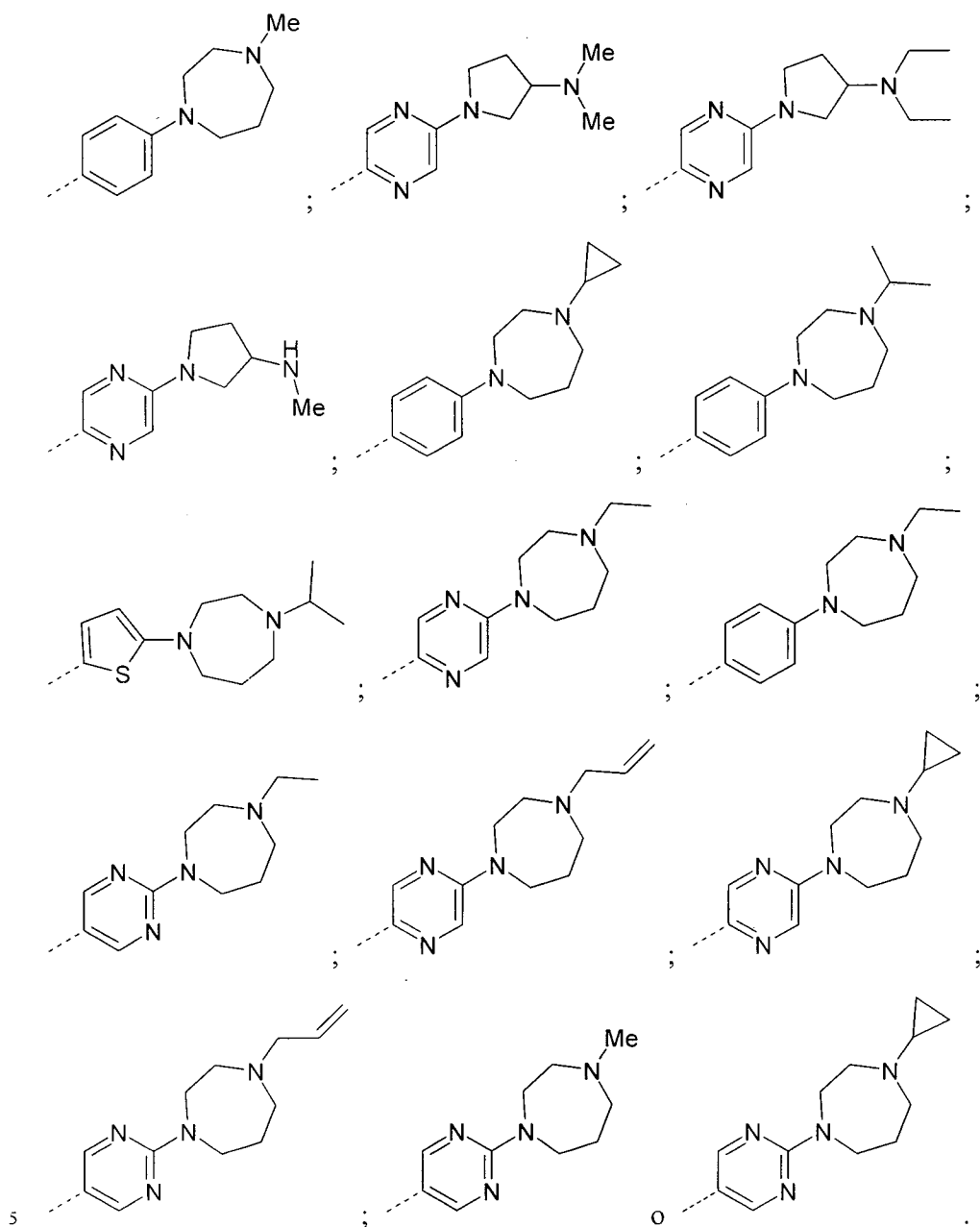
86h

30

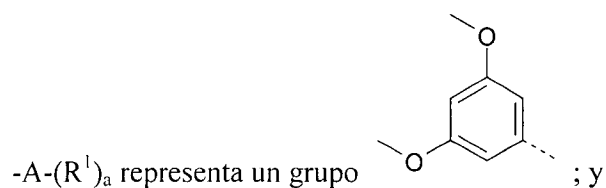


865

31

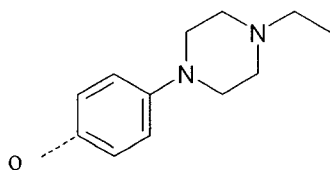
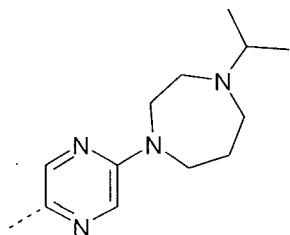
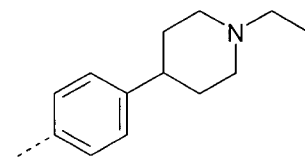
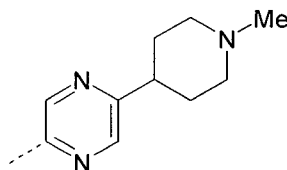
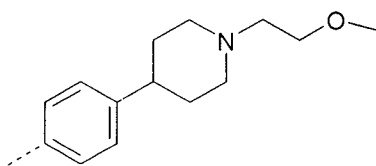
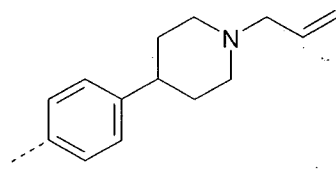
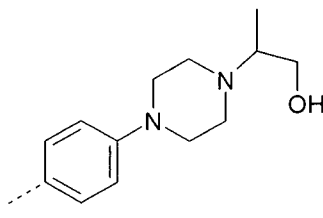
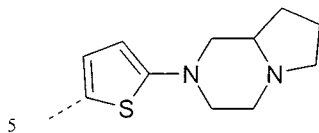
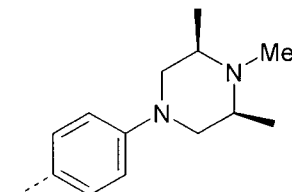
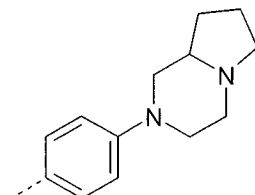
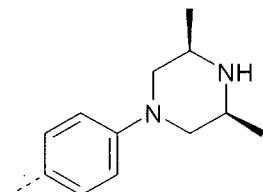
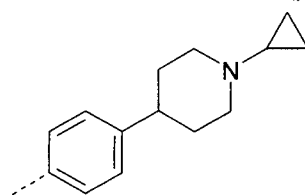
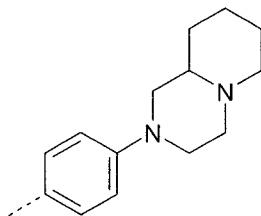
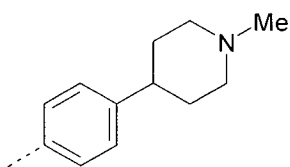
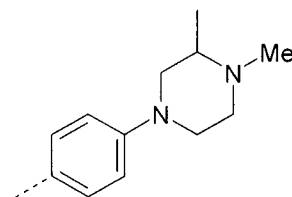
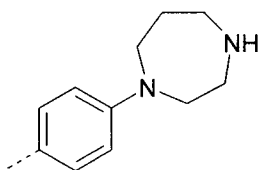
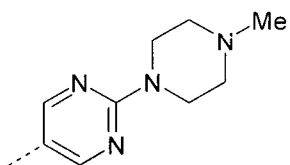
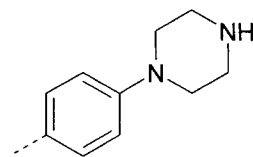
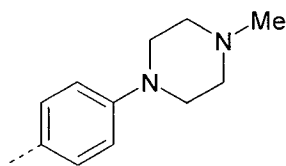


16. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que:



726

-B-(R²)_b representa un grupo



17. Un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, para uso como un medicamento.

18. El uso de un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, en la fabricación de un medicamento para uso en la producción de un efecto inhibidor de FGFR en un animal de sangre caliente.

19. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, en asociación con un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.



2020

Bogotá D.C.,

Doctor(a)

RAISBECK J. IAN

Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA AB

REFERENCIA	Radicación No.	9 62879
	Solicitud internacional	PCT/GB2007/004917
	Fecha inicio fase nacional	21/07/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	10796
	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,

26 JUL. 2010

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

jfernand