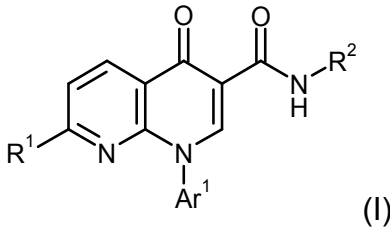


REIVINDICACIONES

1. Compuesto de la fórmula (I),



5 donde

 R¹ es NR⁴R⁵,

 donde

 R⁴ es hidrógeno, metilo, alquilo-(C₂-C₄) o cicloalquilo-(C₃-C₆),

10

 donde alquilo-(C₂-C₄) puede estar sustituido por hidroxilo o hasta
 trisustituido por flúor

 y

 R⁵ es alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆), heterociclilo saturado de 3
 a 6 miembros o alquilsulfonilo-(C₁-C₄),

15

 donde alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆) y heterociclilo saturado
 de 3 a 6 miembros pueden estar hasta trisustituidos, de forma
 idéntica o diferente por metilo, difluorometilo, trifluorometilo,
 hidroxilo, hidroxicarbonilo, oxo, metoxi, difluorometoxi,
 trifluorometoxi y ciano y adicionalmente hasta tetrasustituidos por
 flúor,

20

 o

 R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman
 un heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10
 miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede
 contener uno o dos heteroátomos idénticos o diferentes
 adicionales del grupo de N, O, S, SO y/o SO₂ como miembros de
 anillo,

25

 donde el heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros y bicíclico de
 6 a 10 miembros puede estar sustituido cada uno por 1 a 5
 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo de
 alquilo-(C₁-C₄), difluorometilo, trifluorometilo, hidroxilo,
 hidroxicarbonilo, oxo, alcoxi-(C₁-C₃), difluorometoxi,
 trifluorometoxi, ciano, alcoxi-(C₁-C₃)carbonilo, aminocarbonilo,
 mono-(C₁-C₃)-alkilaminocarboniloxi, -NHC(=O)R²²ᴬ y -

30

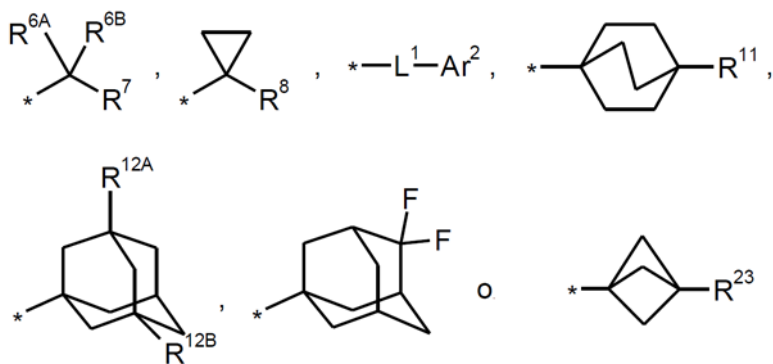
$\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{R}^{22\text{B}}$, y adicionalmente hasta tetrasustituido por flúor, donde

$\text{R}^{22\text{A}}$ y $\text{R}^{22\text{B}}$ representan independientemente alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_3$) o ciclopropilo,

y

donde alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_4$) puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente, por hidroxilo y alcoxi-($\text{C}_1\text{-C}_3$) y hasta tetrasustituido por flúor,

R^2 es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

$\text{R}^{6\text{A}}$ es hidrógeno o metilo,

$\text{R}^{6\text{B}}$ es metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,

R^7 es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo, 2-metilprop-1-ilo, trifluorometilo, difluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo o ciclopropilo,

R^8 es 2,2,2-trifluoroetilo,

L^1 es un enlace o un grupo de la fórmula $-\text{CR}^{9\text{A}}\text{R}^{9\text{B}}-$,

donde

$\text{R}^{9\text{A}}$ representa hidrógeno o metilo,

$\text{R}^{9\text{B}}$ representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,

Ar^2 es fenilo,

que puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente, por flúor, cloro, metilo y/o trifluorometilo,

R^{11} es hidrógeno, flúor o metilo,

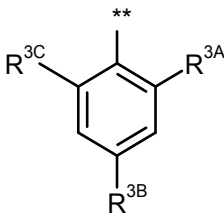
$\text{R}^{12\text{A}}$ es hidrógeno, flúor, metilo, etilo o trifluorometilo,

$\text{R}^{12\text{B}}$ es hidrógeno o flúor,

R^{23} es hidrógeno, flúor o trifluorometilo,

y

5 Ar^1 es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

10 R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y los N-óxidos, sales, solvatos, sales de los N-óxidos y solvatos de los N-
óxidos o sales de los mismos.

15

2. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1

donde

R^1 es NR^4R^5 ,

donde

20 R^4 es hidrógeno o metilo,

y

R^5 es alquilo-(C_1-C_4) o metilsulfonilo,

donde alquilo-(C_1-C_4) puede estar hasta disustituido por hidroxilo
y adicionalmente hasta trisustituido por flúor,

25

o

R^4 y R^5 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman
un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10
miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede
contener uno o dos heteroátomos adicionales del grupo de N, O,
S, SO y SO_2 como miembro de anillo,

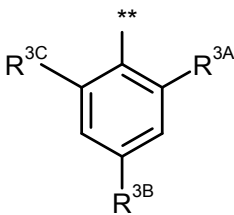
30

donde el heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros y bicíclico de
6 a 10 miembros puede cada uno estar sustituido por 1 a 5
sustituyentes independientemente seleccionados del grupo de

alquilo-(C₁-C₃), difluorometilo, trifluorometilo, hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxilo, oxo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, metoximetilo, ciano, metoxicarbonilo, aminocarbonilo y monometilaminocarbonilo, y adicionalmente hasta tetrasustituido por flúor,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

3. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2

donde

R¹ es NR⁴R⁵,

donde

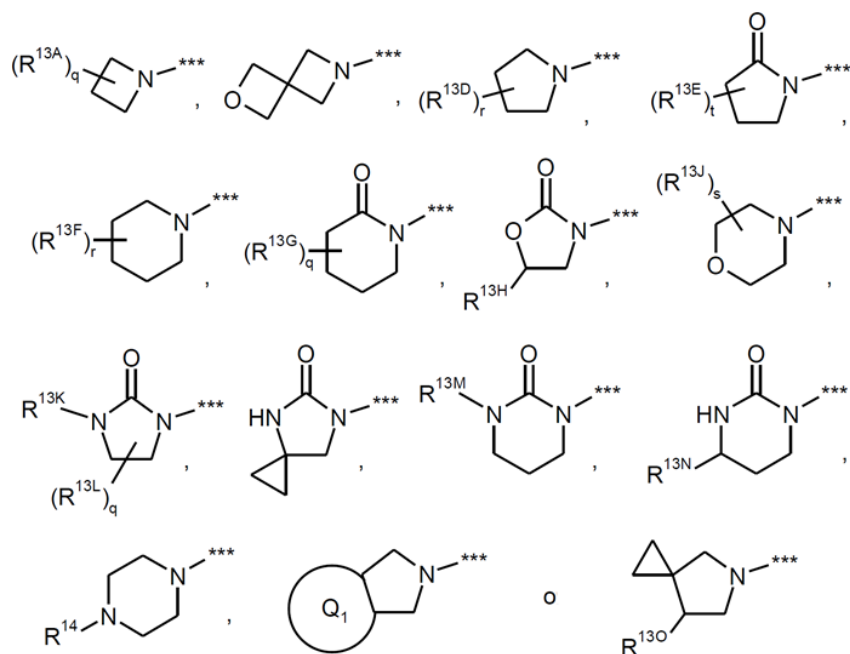
R⁴ es hidrógeno o metilo,

y

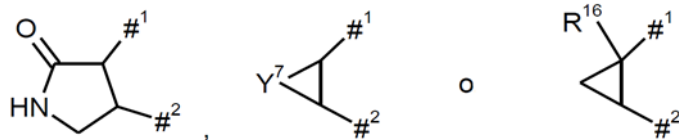
R⁵ es metilo, isopropilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-hidroxietilo o 2-hidroxipropilo,

o

es un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 8 miembros que se une a través de un átomo de nitrógeno y es de la fórmula



donde
*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,
el anillo Q_1 es un grupo de la fórmula



5

donde
 $\#^1$ y $\#^2$ marcan el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo
de pirrolidina,

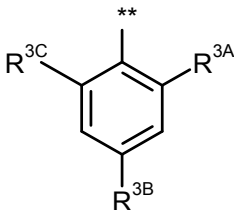
y
10 Y^7 es $-CF_2-$ o $-CHR^{15}-$,
donde
 R^{15} representa metoximetilo,

y
15 R^{16} es hidroxilo,
 R^{13A} es flúor, hidroxilo, hidroximetilo, metilo, trifluorometilo o metoxi,
 R^{13D} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo, metoxi o
difluorometoxi,
 R^{13E} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o metoxi,
 R^{13F} es flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o ciano,
20 R^{13G} es flúor o hidroxilo,
 R^{13H} es hidrógeno, metilo, hidroximetilo, aminocarbonilo o
metoxicarbonilo,

5 R^{13J} es oxo, hidroximetilo o difluorometilo,
 R^{13K} es hidrógeno, metilo o 2-hidroxietilo,
 R^{13L} es hidrógeno o metilo,
 R^{13M} es etilo, 2-hidroxietilo o ciano,
 R^{13N} es hidrógeno o etilo,
 R^{13O} es hidrógeno o hidroxilo,
 R^{14} es metilo, metoxycarbonilo o aminocarbonilo,
 q es el número 0, 1 o 2,
 r es el número 0, 1, 2 o 3,
10 s es el número 0 o 1,
 t es el número 0, 1, 2, 3 o 4,
 donde en el caso que los sustituyentes R^{13A} , R^{13D} , R^{13E} , R^{13F} , R^{13G} , R^{13J}
 y R^{13L} ocurran más de una vez, las definiciones de los mismos pueden
 cada una ser las mismas o diferentes,

15 y

Ar^1 es un grupo de la fórmula

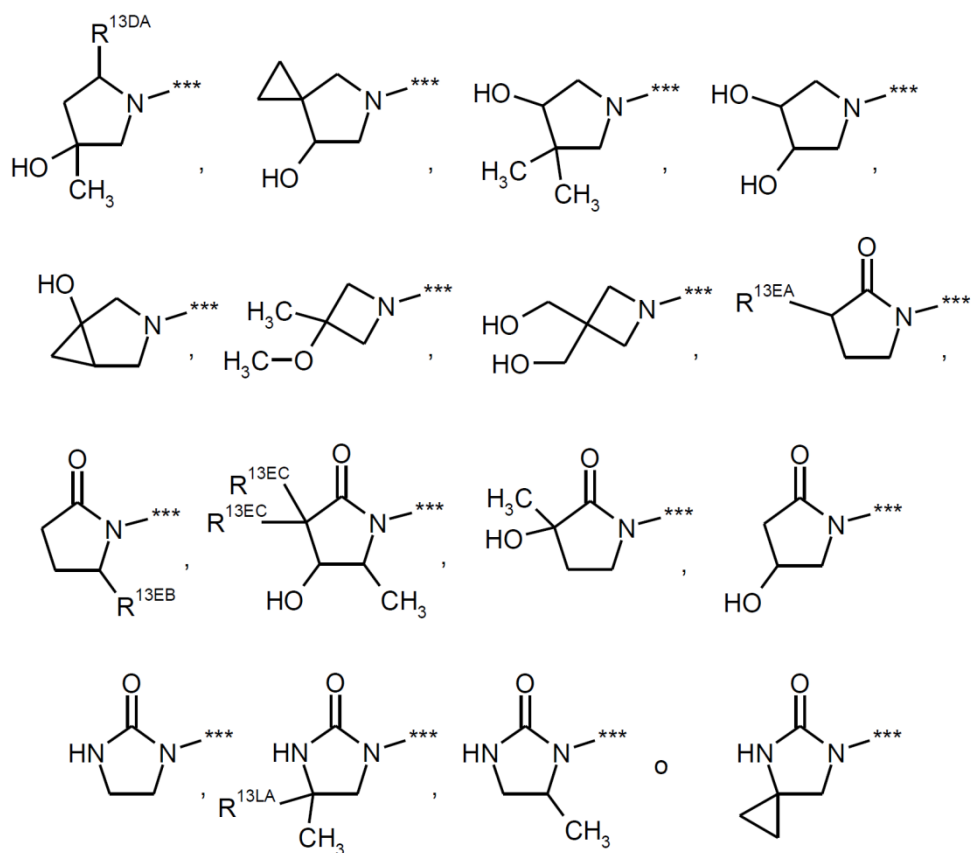


20 donde
 $**$ marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,
 R^{3A} es flúor o cloro,
 R^{3B} es hidrógeno o flúor,
 y

25 R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro
 y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

4. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las
 Reivindicaciones 1 a 3

30 donde
 R^1 es un grupo de la fórmula



donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

5 R^{13DA} es hidrógeno o metilo,

R^{13EA} es hidroxilo o hidroximetilo,

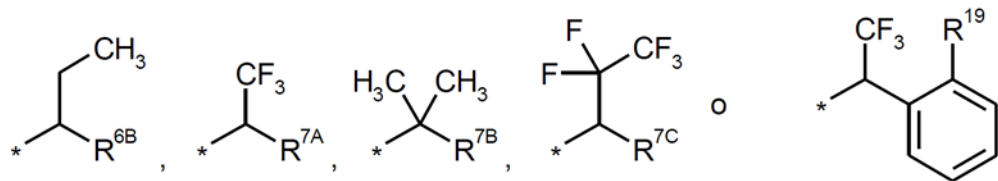
R^{13EB} es metilo o hidroximetilo,

R^{13EC} es hidrógeno o metilo,

R^{13LA} es hidrógeno o metilo,

10

R² es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

15 R^{6B} es trifluorometoximetilo,

R^{7A} es metilo, etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

R^{7B} es trifluorometilo, difluorometilo o 2,2,2-trifluoroetilo,

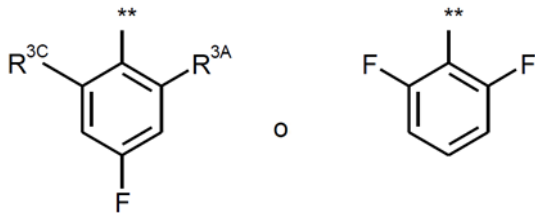
R^{7C} es metilo o etilo,

R¹⁹ es cloro,

20

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



5

donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor o cloro, y

R^{3C} es hidrógeno o flúor,

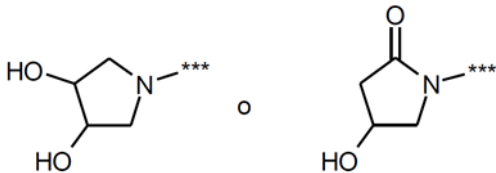
y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

10

5. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4

donde

R¹ es un grupo de la fórmula

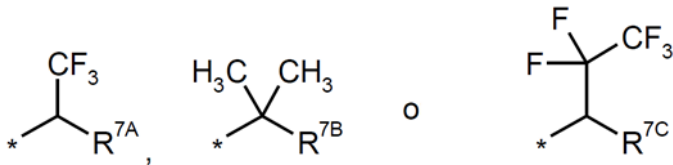


15

donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

R² es un grupo de la fórmula



20

donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

R^{7A} es etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

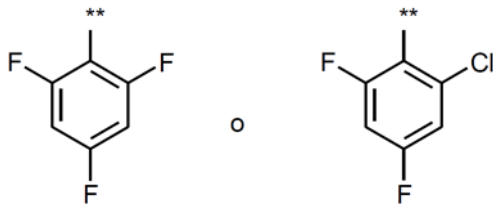
R^{7B} es trifluorometilo,

25

R^{7C} es metilo o etilo,

y

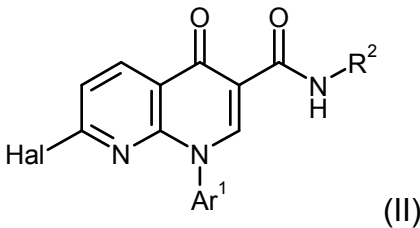
Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,
y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

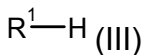
6. Proceso para preparar los compuestos de la fórmula (I) tal como se define
en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, caracterizado por que
[A] un compuesto de la fórmula (II)



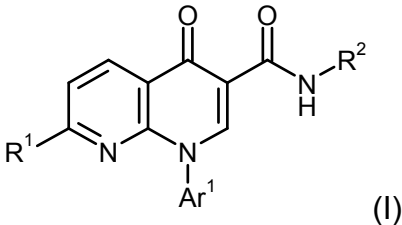
donde R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente

y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro,
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (III)



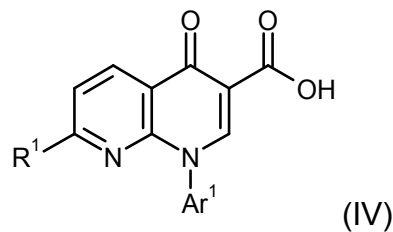
donde R¹ tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la fórmula (I)



donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente,

o

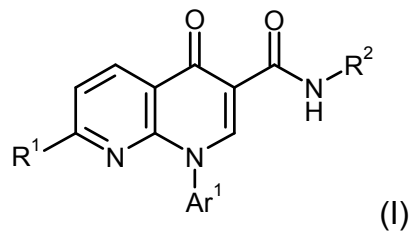
[B] un compuesto de la fórmula (IV)



donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (V)



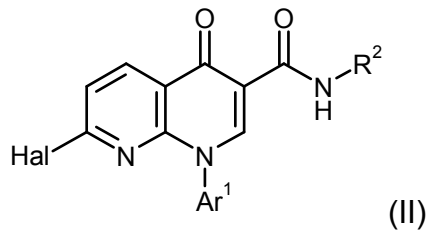
donde R² tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la invención de la fórmula (I)



donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente.

10

7. Compuesto de la fórmula (II),



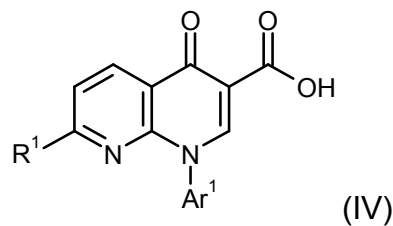
donde R² y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan
anteriormente para los compuestos de la fórmula (I)

15

y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro.

8. Compuesto de la fórmula (IV)



20

donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan
anteriormente para los compuestos de la fórmula (I).

9. Medicamento que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en combinación con un excipiente inerte, no tóxico, farmacéuticamente adecuado.

P-14601

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: Expediente No. **NC2017/0012622**

Solicitud de patente a nombre de **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT**

Yo, CAROLINA DAZA MONTALVO identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la Carrera 11 No. 86-53, obrando como apoderada de la sociedad BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT, domiciliada en Alemania, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. **4243** notificado electrónicamente el 10 de junio de 2019, relacionado con los requerimientos de fondo de la solicitud, atentamente me permito presentar la siguiente información:

1. Modificación al título de la solicitud

Siguiendo la amable sugerencia del examinador, se ha modificado el título como sigue:

“DERIVADOS DE 3-(AMINOCARBONIL)-7-AMINO-1,8-NAFTIRIDIN-4-ONA COMO MODULADORES ALOSTÉRICOS POSITIVOS DEL RECEPTOR MUSCARÍNICO M2”

Por lo tanto, se refleja con mayor claridad la materia reivindicada.

2. Modificación a las Reivindicaciones

Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo capítulo reivindicatorio, el cual consta de nueve (9) reivindicaciones y reemplaza completamente el capítulo presentado anteriormente. En el nuevo capítulo reivindicatorio se realizaron las siguientes modificaciones:

- 2.1.** Se incorporó la definición de R^2 de la anterior reivindicación 3 en la nueva reivindicación 1, permitiendo definir con mayor claridad y concisión este sustituyente.
- 2.2.** En vista de la anterior modificación, la definición de R^2 ha sido removida de las anteriores reivindicaciones 2 y 3.
- 2.3.** No se incluye la anterior reivindicación 9. La anterior reivindicación 10 es ahora la nueva reivindicación 9.

En cuanto a estas modificaciones, me permito decir que las mismas no amplían de ninguna manera la materia objeto de la presente solicitud y se realizaron con el ánimo de superar las objeciones de claridad planteadas por el examinador en su concepto técnico.

3. Pago de tasas

En relación con el número de reivindicaciones, atentamente nos permitimos decir que no se adjunta tasa por reivindicaciones adicionales, toda vez que el nuevo capítulo reivindicatorio tiene un menor número de cláusulas que el anteriormente presentado y es en esencia el mismo objeto, pero más limitado y definido con mayor claridad.

De otro lado, no se adjunta recibo por la solicitud de un nuevo examen de patentabilidad, toda vez que la novedad y el nivel inventivo de la solicitud han sido reconocidas y las modificaciones introducidas en esta oportunidad sólo implican una restricción de la materia ya estudiada.

4. Claridad y Concisión de las Reivindicaciones

El solicitante manifiesta que mediante la presentación del nuevo capítulo reivindicatorio quedan subsanadas la totalidad de las objeciones, de modo tal que las nuevas reivindicaciones proporcionan claridad y concisión a la invención descrita, siguiendo las recomendaciones realizadas por el examinador en su concepto técnico.

En particular, teniendo en cuenta las modificaciones introducidas a las reivindicaciones, es posible determinar que la definición de R^2 ha sido notablemente restringida, encontrando el debido soporte en la descripción. Por lo tanto, se supera la objeción por falta de soporte formulada por el examinador.

De otro lado, considerando que la anterior reivindicación 9 no ha sido incluida en esta oportunidad, se supera la objeción formulada para ésta.

En consecuencia, nos permitimos indicar que el presente capítulo reivindicatorio, que incluye 9 reivindicaciones, se ajusta a las disposiciones del artículo 30 de la Decisión 486/00.

5. Patentabilidad

Se agradece al examinador reconocer la patentabilidad de la solicitud en vista del análisis del estado de la técnica

6. Conclusión

Con las modificaciones introducidas y los argumentos presentados puede concluirse que:

- i) La presente solicitud es clara, concisa y está debidamente soportada en la descripción, cumpliendo así con los requerimientos del Artículo 30 de la Decisión 486; y
- ii) Las reivindicaciones actuales son patentables sobre el estado de la técnica, cumpliendo así con los requerimientos de los artículos 16 y 18 de la Decisión 486.

Habiendo atendido cabalmente las objeciones presentadas por ese despacho, atentamente solicitamos se conceda el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio o si el examinador considera que subsisten razones para objetar la presente invención, rogamos expedir otro examen de fondo con los debidos motivos y razones que sustenten su objeción con el fin de que nuestro mandante tenga la posibilidad de exponer sus argumentos con base en la interpretación de los artículos 45 de la Decisión 486 -el cual otorga la facultad al examinador para emitir los exámenes de fondo- y 42 del Código de Procedimiento Administrativo y de lo Contencioso Administrativo que señala que: "*Habiéndose dado oportunidad a los interesados para expresar sus opiniones, y con base en las pruebas e informes disponibles, se tomará la decisión, que será motivada. La decisión resolverá todas las peticiones que hayan sido oportunamente planteadas dentro de la actuación por el peticionario y por los terceros reconocidos*", (el subrayado es nuestro).

Finalmente, solicitamos a ese Despacho pronunciarse en relación con todos los argumentos presentados en este memorial dando estricta aplicación al principio del debido proceso consagrado en el artículo 29 de la Constitución Nacional.

7. Anexos

- Nuevo capítulo reivindicatorio que incluye 9 reivindicaciones.

Señor Director,



CAROLINA DAZA MONTALVO

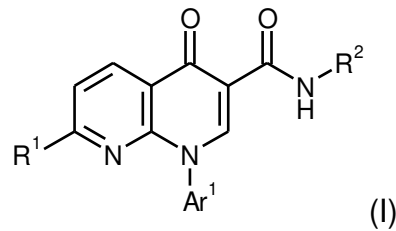
C.C. 66.783.790 de Palmira Valle

TP-141563 CSJ

notificaciones@clarkemodet.com.co

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de la fórmula (I),



5 donde

 R¹ es NR⁴R⁵,

 donde

 R⁴ es hidrógeno, metilo, alquilo-(C₂-C₄) o cicloalquilo-(C₃-C₆),
 donde alquilo-(C₂-C₄) puede estar sustituido por hidroxilo o hasta
10 trisustituido por flúor

 y

 R⁵ es alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆), heterociclilo saturado de 3
 a 6 miembros o alquilsulfonilo-(C₁-C₄),
 donde alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆) y heterociclilo saturado
15 de 3 a 6 miembros pueden estar hasta trisustituidos, de forma
 idéntica o diferente por metilo, difluorometilo, trifluorometilo, hidro-
 xilo, hidroxicarbonilo, oxo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi y
 ciano y adicionalmente hasta tetrasustituidos por flúor,

 o

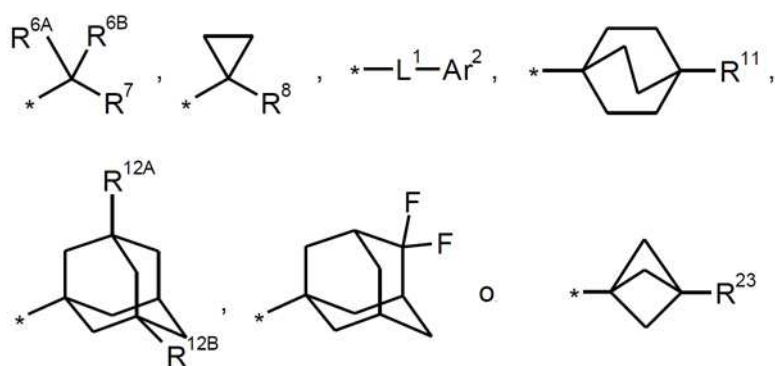
20 R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman
 un heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10
 miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede conte-
 ner uno o dos heteroátomos idénticos o diferentes adicionales del
 grupo de N, O, S, SO y/o SO₂ como miembros de anillo,
25 donde el heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros y bicíclico de
 6 a 10 miembros puede estar sustituido cada uno por 1 a 5 susti-
 tuyentes independientemente seleccionados del grupo de alquilo-
 (C₁-C₄), difluorometilo, trifluorometilo, hidroxilo, hidroxicarbonilo,
 oxo, alcoxi-(C₁-C₃), difluorometoxi, trifluorometoxi, ciano, alcoxi-
30 (C₁-C₃)carbonilo, aminocarbonilo, mono-(C₁-C₃)-alkilaminocarbo-
 niloxi, -NHC(=O)R²²ᴬ y -CH₂NHC(=O)R²²ᴮ, y adicionalmente hasta
 tetrasustituido por flúor, donde

R^{22A} y R^{22B} representan independientemente alquilo-(C₁-C₃) o ciclopropilo,

y

donde alquilo-(C₁-C₄) puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente, por hidroxilo y alcoxi-(C₁-C₃) y hasta tetrasustituido por flúor,

R^2 es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

R^{6A} es hidrógeno o metilo,

R^{6B} es metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,

R⁷ es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo, 2-metilprop-1-ilo, trifluorometilo, difluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo o ciclopropilo,

R⁸ es 2,2,2-trifluoroetilo,

L¹ es un enlace o un grupo de la fórmula -CR^{9A}R^{9B}-,

donde

R^{9A} representa hidrógeno o metilo,

R^{9B} representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,

Ar^2 es fenilo,

que puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente,
por flúor, cloro, metilo y/o trifluorometilo,

R¹¹ es hidrógeno, flúor o metilo,

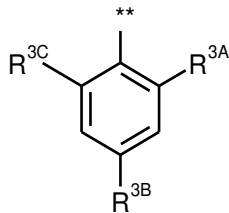
R^{12A} es hidrógeno, flúor, metilo, etilo o trifluorometilo,

R^{12B} es hidrógeno o flúor,

R²³ es hidrógeno, flúor o trifluorometilo,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



5

donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

10

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y los N-óxidos, sales, solvatos, sales de los N-óxidos y solvatos de los N-óxidos o sales de los mismos.

2. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1

15

donde

R¹ es NR⁴R⁵,

donde

R⁴ es hidrógeno o metilo,

y

20

R⁵ es alquilo-(C₁-C₄) o metilsulfonilo,

donde alquilo-(C₁-C₄) puede estar hasta disustituido por hidroxilo y adicionalmente hasta trisustituido por flúor,

o

25

R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10 miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales del grupo de N, O, S, SO y SO₂ como miembro de anillo,

30

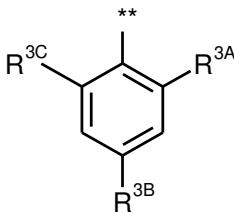
donde el heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros y bicíclico de 6 a 10 miembros puede cada uno estar sustituido por 1 a 5 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo de alquilo-(C₁-C₃), difluorometilo, trifluorometilo, hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxilo, oxo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, metoximetilo,

ciano, metoxicarbonilo, aminocarbonilo y monometilaminocarboni-
loxi, y adicionalmente hasta tetrasustituido por flúor,

y

5

Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

10

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

15

3. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2
donde

R¹ es NR⁴R⁵,

donde

20

R⁴ es hidrógeno o metilo,

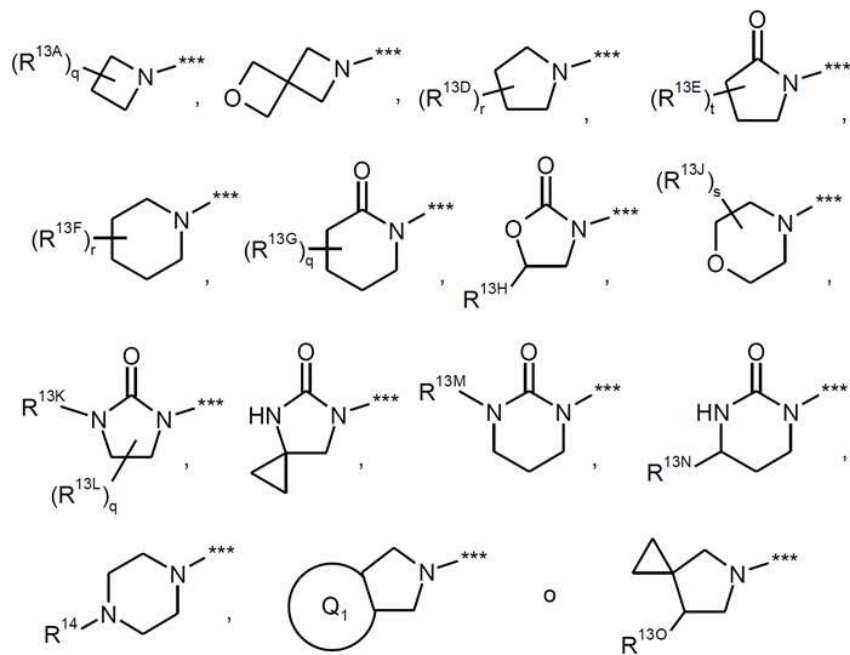
y

R⁵ es metilo, isopropilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-hidro-
xietilo o 2-hidroxipropilo,

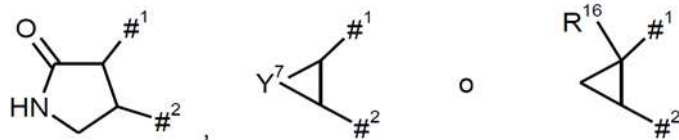
o

25

es un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 8
miembros que se une a través de un átomo de nitrógeno y es de la
fórmula



donde
*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,
el anillo Q_1 es un grupo de la fórmula



5

donde
 $\#^1$ y $\#^2$ marcan el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo
de pirrolidina,

y
 Y^7 es $-\text{CF}_2-$ o $-\text{CHR}^{15}-$,
donde

R^{15} representa metoximetilo,
y
 R^{16} es hidroxilo,

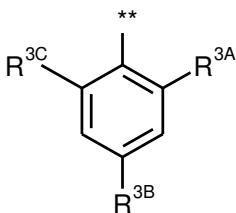
R^{13A} es flúor, hidroxilo, hidroximetilo, metilo, trifluorometilo o metoxi,
 R^{13D} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo, metoxi o difluo-
rometoxi,
 R^{13E} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o metoxi,
 R^{13F} es flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o ciano,
 R^{13G} es flúor o hidroxilo,
 R^{13H} es hidrógeno, metilo, hidroximetilo, aminocarbonilo o metoxicarbo-
nilo,

20

R^{13J} es oxo, hidroximetilo o difluorometilo,
 R^{13K} es hidrógeno, metilo o 2-hidroxietilo,
 R^{13L} es hidrógeno o metilo,
 R^{13M} es etilo, 2-hidroxietilo o ciano,
5 R^{13N} es hidrógeno o etilo,
 R^{13O} es hidrógeno o hidroxilo,
 R^{14} es metilo, metoxycarbonilo o aminocarbonilo,
q es el número 0, 1 o 2,
r es el número 0, 1, 2 o 3,
10 s es el número 0 o 1,
t es el número 0, 1, 2, 3 o 4,
donde en el caso que los sustituyentes R^{13A} , R^{13D} , R^{13E} , R^{13F} , R^{13G} , R^{13J}
y R^{13L} ocurran más de una vez, las definiciones de los mismos pueden
cada una ser las mismas o diferentes,

15 y

Ar^1 es un grupo de la fórmula

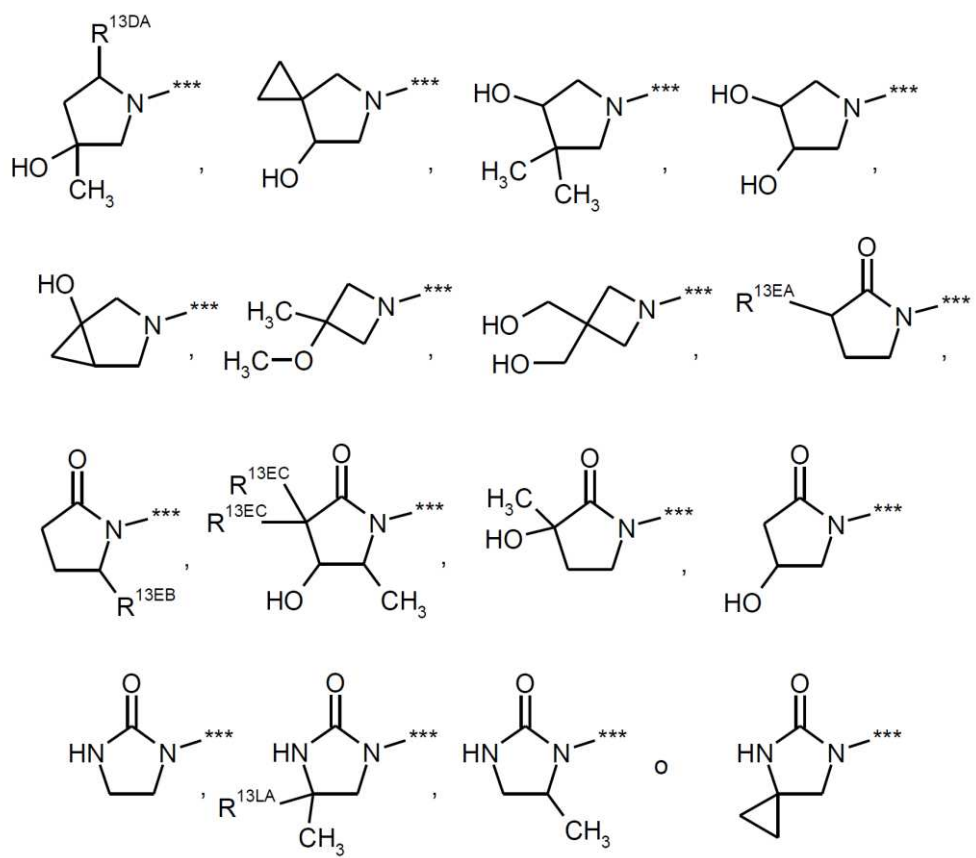


20 donde
 $**$ marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,
 R^{3A} es flúor o cloro,
 R^{3B} es hidrógeno o flúor,
y
25 R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

4. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3

30 donde
 R^1 es un grupo de la fórmula



donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

R^{13DA} es hidrógeno o metilo,

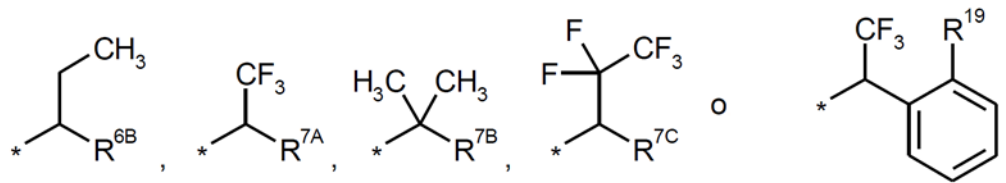
R^{13EA} es hidroxilo o hidroximetilo,

R^{13EB} es metilo o hidroximetilo,

R^{13EC} es hidrógeno o metilo,

R^{13LA} es hidrógeno o metilo,

R² es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

R^{6B} es trifluorometoximetilo,

R^{7A} es metilo, etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

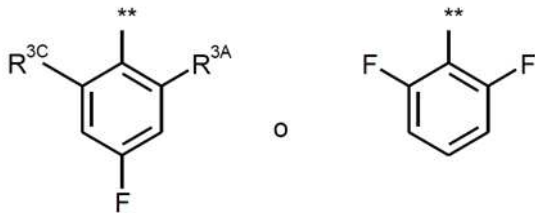
R^{7B} es trifluorometilo, difluorometilo o 2,2,2-trifluoroetilo,

R^{7C} es metilo o etilo,

R¹⁹ es cloro,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



5

donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor o cloro, y

R^{3C} es hidrógeno o flúor,

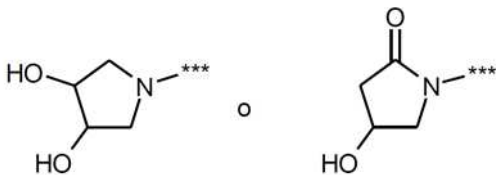
y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

10

5. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4

donde

R¹ es un grupo de la fórmula

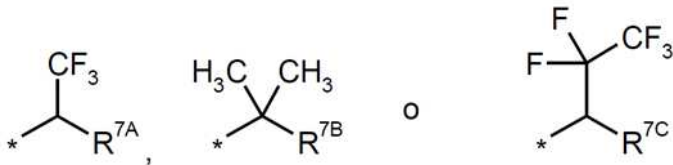


15

donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

R² es un grupo de la fórmula



20

donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

R^{7A} es etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

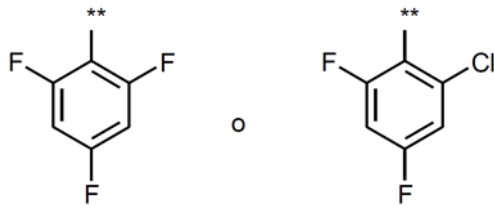
R^{7B} es trifluorometilo,

25

R^{7C} es metilo o etilo,

y

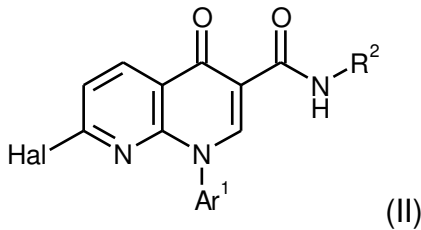
Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

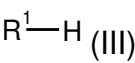
** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,
y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

6. Proceso para preparar los compuestos de la fórmula (I) tal como se define
en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, caracterizado por que
[A] un compuesto de la fórmula (II)

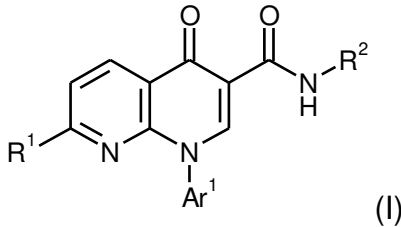


donde R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente
y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro,
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (III)

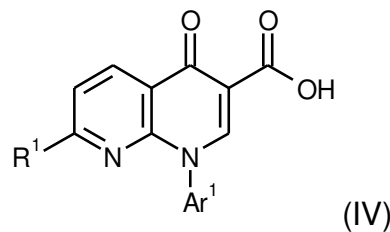


donde R¹ tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la fórmula (I)



donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente,
o

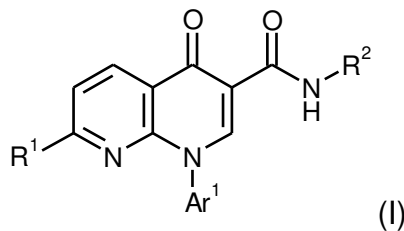
[B] un compuesto de la fórmula (IV)



donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (V)



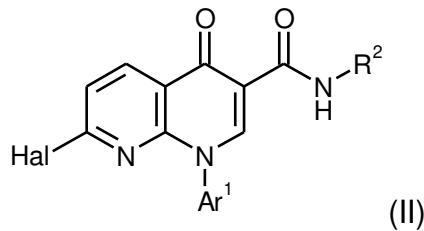
donde R² tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la invención de la fórmula (I)



donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente.

10

7. Compuesto de la fórmula (II),



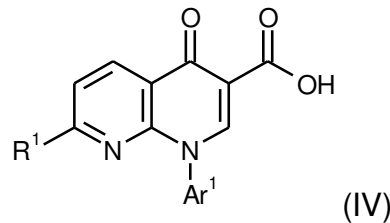
donde R² y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan anterior-
mente para los compuestos de la fórmula (I)

15

y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro.

8. Compuesto de la fórmula (IV)



20

donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan anterior-
mente para los compuestos de la fórmula (I).

9. Medicamento que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en combinación con un excipiente inerte, no tóxico, farmacéuticamente adecuado.