

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **3 029 608**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

A61P 37/00 (2006.01)

A61K 31/4725 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DE
PATENTE EUROPEA

T1

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.11.2020** PCT/EP2020/083566

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.06.2021** WO21105317

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.11.2020** E 20811359 (7)

97 Fecha y número de publicación de la solicitud europea: **05.10.2022** EP 4065572

30 Prioridad:

28.11.2019 EP 19383057

46 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de las reivindicaciones de la solicitud:
24.06.2025

71 Solicitantes:

AGOMAB SPAIN, S.L.U. (100.00%)
Parque Empresarial de Touro Parcelas 26-27,
Fonte Diaz
15822 Touro, A Coruña, ES

72 Inventor/es:

BOSSER ARTAL, RAMÓN;
PAMPÍN CASAL, BEGOÑA y
PALOMINO LARIA, JULIO CASTRO

74 Agente/Representante:

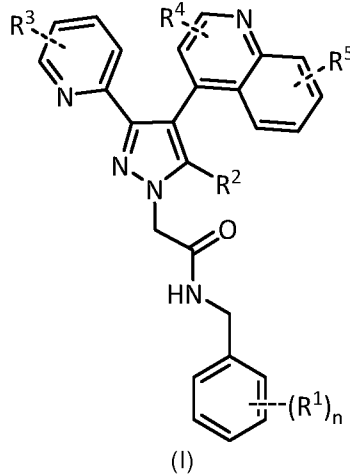
ARIAS SANZ, Juan

54 Título: **DERIVADOS DE BENCILAMIDA COMO INHIBIDORES DEL RECEPTOR I DEL FACTOR DE
CRECIMIENTO TRANSFORMANTE BETA / ALK5**

ES 3 029 608 T1

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



5 en la que:

- R¹ representa independientemente 1 o 2 grupos seleccionados de:

- a) átomo de halógeno,
- b) alquilo C₁-C₆ lineal o ramificado sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 átomos de halógeno,
- c) grupo ciano,
- d) alcoxilo C₁-C₃,
- e) -COOH,

10

- R² representa un grupo seleccionado de:

- a) átomo de hidrógeno,
- b) alquilo C₁-C₃,

15

- R³ representa un grupo seleccionado de:

- a) átomo de hidrógeno,
- b) alquilo C₁-C₃ sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 átomos de halógeno,
- c) átomo de halógeno,

- R⁴ y R⁵ representan independientemente un grupo seleccionado de:

20

- a) átomo de hidrógeno,
- b) alquilo C₁-C₃ sustituido opcionalmente con 1, 2 o 3 átomos de halógeno,
- c) átomos de halógeno,

- n tiene un valor de 0, 1 o 2

y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

25

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R², R⁴ y R⁵ representan átomos de hidrógeno.

3. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que n es 0 o n es 1 o 2 y cada R¹ representa independientemente un átomo de halógeno.
- 5 4. Un compuesto según la reivindicación 3, en el que n es 1 o 2 y cada R¹ representa un átomo de halógeno.
5. Un compuesto según la reivindicación 4, en el que n es 1 o 2 y cada R¹ se selecciona del grupo que consiste en átomos de flúor y cloro.
- 10 6. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que R³ representa un grupo seleccionado de átomo de hidrógeno, grupo etilo y grupo metilo.
7. Un compuesto según la reivindicación 6, en el que R³ representa un grupo metilo.
- 15 8. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R², R⁴ y R⁵ representan independientemente átomos de hidrógeno, n es 0 o n es 1 o 2 y cada R¹ representa independientemente un átomo de halógeno, y R³ representa un grupo seleccionado de átomo de hidrógeno, grupo etilo y grupo metilo.
- 20 9. Un compuesto según la reivindicación 8, en el que n es 1 o 2, cada R¹ se selecciona del grupo que consiste en átomos de flúor y cloro y R³ representa un grupo metilo.
10. Compuesto según la reivindicación 1, que es uno de:
- 25 N-bencil-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-fluorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-clorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-bromobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-cianobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-metoxibencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 30 N-(4-metilbencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(4-(terc-butil)bencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-bencil-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(3-metilbencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(3-fluorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 35 N-(3-clorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(3-cianobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2-metilbencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2-metilbencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2-fluorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 40 N-(2-fluorobencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-bencil-2-(3-(6-etilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 2-(3-(6-etilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)-N-(2-metilbencil)acetamida
 N-(4-metilbencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2-clorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 45 N-(2-clorobencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2,6-difluorobencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2,6-difluorobencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2,6-dimetilbencil)-2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2,6-dimetilbencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 50 N-(2-etilbencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida
 N-(2,6-diclorobencil)-2-(3-(6-metilpiridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamida

clorhidrato del ácido 4-((2-(3-(piridin-2-il)-4-(quinolin-4-il)-1H-pirazol-1-il)acetamido)metil)benzoico

- 5
11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 o sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un portador o diluyente farmacéuticamente aceptable.
- 10
12. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, para su uso en el tratamiento y/o la prevención de una enfermedad o un estado patológico susceptible de mejorar por inhibición del receptor I del factor de crecimiento transformante β (TGF β R1/ALK5).
- 15
13. Un compuesto para su uso según la reivindicación 12, en el que la enfermedad o el estado patológico se selecciona del grupo que consiste en enfermedades gastrointestinales, tales como enfermedades inflamatorias del intestino entre ellas enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, fibrosis hepática y cáncer, específicamente cáncer de estómago, cáncer de esófago y cáncer colorrectal; enfermedades fibróticas de la piel, tales como esclerodermia, dermatopatía fibrosante nefrógena, enfermedad mixta del tejido conjuntivo, escleromixedema, escleredema y fascitis eosinofílica; enfermedades oculares fibróticas tales como xeroftalmia, degeneración macular asociada con la edad, cicatrización en la córnea y la conjuntiva, fibrosis poscatarata, vitreoretinopatía proliferativa y retinopatía diabética proliferativa.
- 20
14. Una combinación que comprende un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 y un agente terapéutico usado para el tratamiento y/o la prevención de una enfermedad seleccionada del grupo que consiste en enfermedades gastrointestinales, tales como enfermedades inflamatorias del intestino entre ellas enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, fibrosis hepática y cáncer, específicamente cáncer de estómago, cáncer de esófago y cáncer colorrectal; enfermedades fibróticas de la piel, tales como esclerodermia, dermatopatía fibrosante nefrógena, enfermedad mixta del tejido conjuntivo, escleromixedema, escleredema y fascitis eosinofílica; enfermedades oculares fibróticas tales como xeroftalmia, degeneración macular asociada con la edad, cicatrización en la córnea y la conjuntiva, fibrosis poscatarata, vitreoretinopatía proliferativa y retinopatía diabética proliferativa.
- 25
15. Uso de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento y/o la prevención de una enfermedad o un estado patológico susceptible de mejorar por inhibición del receptor I del factor de crecimiento transformante β (TGF β R1/ALK5).
- 30
16. Uso según la reivindicación 15, en el que la enfermedad o el estado patológico se selecciona del grupo que consiste en enfermedades gastrointestinales, tales como enfermedades inflamatorias del intestino entre ellas enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, fibrosis hepática y cáncer, específicamente cáncer de estómago, cáncer de esófago y cáncer colorrectal; enfermedades fibróticas de la piel, tales como esclerodermia, dermatopatía fibrosante nefrógena, enfermedad mixta del tejido conjuntivo, escleromixedema, escleredema y fascitis eosinofílica; enfermedades oculares fibróticas tales como xeroftalmia, degeneración macular asociada con la edad, cicatrización en la córnea y la conjuntiva, fibrosis poscatarata, vitreoretinopatía proliferativa y retinopatía diabética proliferativa.
- 35
17. Un método para el tratamiento y/o la prevención de una enfermedad o un estado patológico susceptible de mejorar por inhibición del receptor I del factor de crecimiento transformante β (TGF β R1/ALK5) que comprende la administración a un sujeto que lo necesita de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.
- 40
18. Un método según la reivindicación 17, en el que la enfermedad o el estado patológico se selecciona del grupo que consiste en enfermedades gastrointestinales, tales como enfermedades inflamatorias del intestino entre ellas enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, fibrosis hepática y cáncer, específicamente cáncer de estómago, cáncer de esófago y cáncer colorrectal; enfermedades fibróticas de la piel, tales como esclerodermia, dermatopatía fibrosante nefrógena, enfermedad mixta del tejido conjuntivo, escleromixedema, escleredema y fascitis eosinofílica; enfermedades oculares fibróticas tales como xeroftalmia, degeneración macular asociada con la edad, cicatrización en la córnea y la conjuntiva, fibrosis poscatarata, vitreoretinopatía proliferativa y retinopatía diabética proliferativa.
- 45
- 50
- 55