

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94-76 - Of. 305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tel: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobar

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Radi: 03-056084- -0000 /-0000

REC: 2007-03-22 10:20AM Dep. 2000 NUEVAS CREACIONES

TEL: 2 PATENTES

ENV: 1 RESPUESTA

REC: 2007-03-22 10:20AM Dep. 2000 NUEVAS CREACIONES

2578

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E.

S.

D.

Re: Expediente No. 03-056.084

Solicitud de patente a nombre de JANSSEN PHARMACEUTICA, N.V.

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 94-76, Of. 305, obrando como apoderada de la sociedad JANSSEN PHARMACEUTICA, N. V., domiciliada en Beerse, Bélgica, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 12927 notificado por fijación en lista el 9 de Noviembre de 2006, relacionado con el concepto técnico de fondo No. 1710, me permito manifestar lo siguiente:

1. 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 de nuevo el capítulo reivindicatorio en el cual se han realizado las siguientes modificaciones:

1.1 Se reemplazó la expresión "2-MeO-fenil" por la expresión "2-carboximetoxi-fenil" en el disclaimer al final de la reivindicación 1 y reivindicación 2, en el compuesto R14 para el sustituyente Ar, con el fin de incluir dentro de este disclaimer el compuesto número 16 de la tabla 1 de la anterioridad citada por el examinador.

1.2. El preámbulo de la antigua reivindicación 3 se redactó en términos del compuesto y al final de la misma se agregó la expresión: "para el tratamiento de desordenes en mamíferos que involucra la acción del receptor CCK-1."

En cuanto a las anteriores modificaciones, me permito decir que no amplía de ninguna manera la materia objeto de la presente solicitud, por el contrario realza la novedad de los compuestos reivindicados sobre aquellos presentes en la anterioridad EP0293220.

Para este efecto, me permito acompañar el recibo 07-22,296 de 16 de marzo de 2007, con lo cual queda cubierta la tasa correspondiente a la modificación de una solicitud de patente en cuanto a sus reivindicaciones.

2. Excepciones a la patentabilidad.

El examinador señala en su concepto técnico 1710 que: *"Teniendo en cuenta lo anterior, el contenido de la reivindicación 3, que trata de "un método de tratamiento..." no es patentable."*

Sobre este particular me permito manifestar que a la luz de la modificación realizada en esta reivindicación queda cabalmente superada dicha objeción.

3. Novedad

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina indica que la invención se considera como nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica, lo que quiere obviamente significar, a contrario sensu, es que la invención no se considera como nueva si está comprendida en el estado de la técnica. Esto es de lógica hermenéutica y gramática elemental. Si de acuerdo con el espíritu de la norma legal indicada, la invención no se considera como nueva si está "comprendida" en el estado de la técnica, dicha norma se está refiriendo, naturalmente, a la totalidad del invento y no a alguno o a algunos de sus componentes. Para que la invención pierda su calidad de novedosa, es claro que ella, TODA ELLA, ha de estar contenida en *"el conjunto de conocimientos existentes que son aplicables al proceso industrial"* como define el estado de la técnica el Tribunal de Justicia del Acuerdo de Cartagena (Proceso No. 6-IP-89, sentencia de 31 de octubre de 1989, publicada en Jurisprudencia del Tribunal de Justicia del Acuerdo de Cartagena, Tomo II, BID-INTAL, Buenos Aires, 1994, página 60).

Lo anterior es conocido como el concepto de NOVEDAD ABSOLUTA, de conformidad con el cual para desvirtuar el requisito de novedad de una invención será necesario que lo reivindicado por la invención bajo estudio corresponda de forma total en un documento o anterioridad señalado, conclusión a la que se llega después de un análisis exhaustivo mediante una comparación entre los capítulos reivindicatorios en discusión.

Ahora bien, si un determinado elemento, condición o circunstancia de la nueva creación ya hace parte del estado de la técnica no quiere ello decir, desde luego, que la invención deba ser rechazada por carecer del requisito de novedad. No sin razón ha dicho el mencionado Tribunal: *"hay que advertir que toda creación es, en cierta forma, producto del estado de la técnica existente, en el sentido de que el inventor ha de tener en cuenta un conjunto de conocimientos técnicos que le permitan crear nuevos procedimientos aplicables a la industria"* (Ibidem, páginas 53 y 54) (el subrayado es nuestro).

Hasta aquí se puede concluir que la novedad como mínimo debe contemplar los siguientes aspectos:

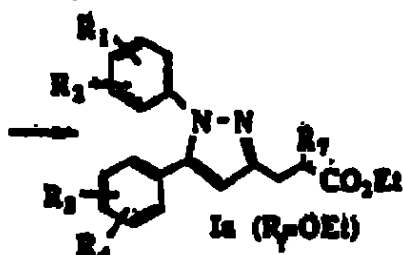
- Que la invención en estudio esté contenida de forma **TOTAL y ABSOLUTA** en el documento que se menciona como anterioridad o de forma independiente en los documentos que se mencionan, si son varios.

- Que la invención en estudio puede partir de conocimientos conocidos, caso en el cual habrá que hacer la comparación no de lo conocido sino de lo inédito y novedoso, teniendo que analizarse el valor agregado que aporta la

invención con sus nuevas características al campo técnico al cual pertenece la invención en estudio.

En el concepto técnico 1710, el examinador afirma que:

"La publicación EP 0293220, revela compuestos de fórmula (Ia)



,cuyos sustituyentes se revelan en la descripción.

Comparando elemento por elemento, muchos de los compuestos de la presente solicitud, así como su método de síntesis, son iguales a los de la presente solicitud, y puede afectar la novedad de la presente solicitud."

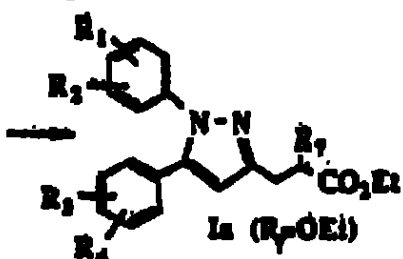
En cuanto a la novedad de la presente solicitud, me permito decir que luego de revisar los sustituyentes dentro de la reivindicación 1 de la presente solicitud y lo revelado en D1 (EP 0293220), se encontró únicamente que el compuesto de dicha anterioridad que se superponía con los de la presente solicitud era el compuesto 16 de la tabla 1.

En consecuencia, en el disclaimer de la reivindicación 1, se procedió a introducir la expresión 2-carboximetoxi-fenil con el fin de que ya no haya superposición entre los compuestos. Por consiguiente, me permito decir que la presente solicitud es novedosa sobre las enseñanzas de dicho documento.

4. Nivel inventivo

El examinador manifiesta que:

"La publicación EP 0293220, revela compuestos de fórmula (Ia):



,cuyos sustituyentes se revelan en la descripción. Son agentes antiinflamatorios y agentes para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proveer derivados de difenilpirazoles como agentes terapéuticos, es una derivación evidente del estado de la técnica ya que las enseñanzas del documento citado enseñarían a una persona versada en la materia a fabricar los compuestos de la presente solicitud."

"Finalmente, no se demuestran propiedades sorprendentes o inesperadas de los compuestos de la presente solicitud en comparación con los del estado de la técnica."

A este respecto me permito decir que el documento D1, enseña o sugiere derivados 2-y 3-pirazol sustituidos del ácido propiónico, particularmente enseña N-hidroxi y N-alquil pirazolpropanamida. Estos compuestos según la anterioridad presentan actividad farmacológica para aliviar la inflamación, el asma, las condiciones dermatológicas como la psoriasis, la dermatitis y condiciones de inflamación gastrointestinal entre otras. No obstante, la referencia D1 falla en sugerirle o enseñarle a la persona versada en la materia los derivados de los compuestos de la presente invención como moduladores receptores de CCK-1, es decir que puedan ser compuestos agonistas o antagonistas selectivos para el receptor de CCK-1.

En este sentido, me permito dirigir la atención del examinador a la pagina 4 de la descripción de la solicitud en estudio, donde se establece que la patente estadounidense No. 5,051,518 correspondiente a la anterioridad EP0293220 revela pirazoles para aliviar la inflamación y para desórdenes cardiovasculares en mamíferos. Es decir, si bien este documento revela pirazoles diferentes a los de la presente solicitud, también es cierto que la persona versada en la materia no habría estado motivada a partir de las enseñanzas de este documento para encontrar de manera evidente nuevos moduladores del receptor de CCK-1 como los expuestos en la invención en estudio.

De otra parte, en cuanto a que no hay datos experimentales, me permito decir que el examinador podrá constatar que compuestos de la técnica más cercana como lo es el compuesto Dexloxiglumida diverge en estructura con respecto a los compuestos de la presente solicitud y por ende no tendría sentido realizar un estudio comparativo entre estos compuestos pues no corresponden a estructuras farmacológicamente parecidas.

En cuanto a los compuestos de la anterioridad D1, resulta sorprendente que los compuestos ahora reivindicados posean la actividad de ser moduladores receptores de CCK-1, es decir que puedan ser compuestos agonistas o antagonistas selectivos para el receptor de CCK-1 sobre las enseñanzas de la referencia D1 que muestra compuestos diferentes a los revelados en la presente solicitud.

En consecuencia, atentamente me permito decir que quedan cabalmente superadas las objeciones en cuanto a la novedad y nivel inventivo de la presente solicitud con respecto al documento D1 y por lo tanto solicito a ese despacho que se conceda el privilegio de patente para esta invención.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C.39.779.452 de Usaquén
T.P. 68228
Cód. 5376

2878 265

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO DE PAGO DE SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
REC: 03-058084-00007-0000
FOL: 2007-03-22 10:30:00 UNP. 2000 NUL. CANCELACIONES
IMP. 2 PATENTES
EVO: 1 REGISTRO
ACT 444 RESPUESTA REGULAR Folios: 09

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 22,296
FECHA : MARZO 16 DE 2007

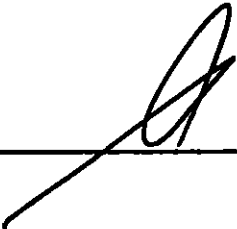
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-4	63068214	15/03/2007	8,526,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEAS COMERCIALES	99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

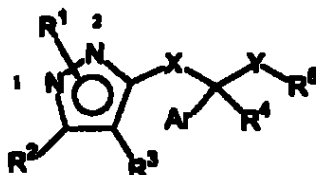
SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un receptor modulador CCK – 1 que tiene por formula general:



5

en donde

R^1 es un sustituyente de posición 1- o 2- seleccionado del grupo formado por hidrogeno,

- 10 a) fenil, opcionalmente mono – di – o tri sustituido con R^p o mono sustituido en carbonos adyacentes con $-OC_{1-4}$ alquilenos O^+ ; R^p se selecciona del grupo formado por $-OH$, $-C_{1-8}$ alquil, $-OC_{1-8}$ alquil, $-C_{6-8}$ cicloalquil, $-OC_{3-8}$ cicloalquil, $-CN$ – NO_2 – $N(R^y)R^2$ (en donde R^y y R^2 se seleccionan independientemente de H o C_{1-8} alquil, o pueden ser
- 15 tomados ambos con el nitrógeno o la unión para formar otro anillo de hidrocarburo alifático, teniendo dicho anillo 5 a 7 miembros, y opcionalmente uno o dos enlaces insaturados en el anillo), $-(C=O)N(R^y)R^2$, $-(N-R^h)COR^t$, $-(N-R^h)SO_2 C_{1-8}$ alquil (en donde RR^t es H o C_{1-8} alquil), $-(C=O)C_{1-8}$ alquil, -
- 20 b) fenil o piridil fusionado a dos miembros adyacentes del anillo a una porción de hidrocarburo de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros, cuya porción tiene un átomo de carbono reemplazado por $>S$, $>NH$ o $>N(C_{1-4}$ alquil) y cuya porción tiene hasta un átomo de carbono adicional reemplazado por N , los
- 25 anillos fusionados opcionalmente mono -, di – o tri – sustituidos con R^p ;

- c) fenil fusionado a dos miembros de anillos adyacentes a una porción de hidrocarburo de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros cuya porción tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados opcionalmente mono -, di - o tri - sustituidos con R^P;
- 5
- d) naftil, opcionalmente mono -, di - o tri - sustituido con R^P
- e) un grupo hidrocarburo aromático monocíclico que tiene cinco átomos anillo que tiene un átomo de carbón, el cual es el punto de unión, con un átomo de carbono reemplazado por >O, >S, >NH o >N(C₁₋₄alquil),
- 10
- teniendo hasta dos átomos de carbono adicionales reemplazados por N, opcionalmente mono -, di - o tri - sustituido con R^P y opcionalmente benzofusionado en la condición de que dos o menos de dichos átomos de anillo de carbono se reemplazan con un heteroátomos, en donde la porción benzofusionada es
- 15
- opcionalmente mono -, di - o tri - sustituido con R^P;
- f) un grupo hidrocarburo aromático monocíclico que tiene seis átomos de carbono, teniendo un átomo de carbono que es el punto de enlace, con uno o dos átomos de carbono reemplazados con N, opcionalmente mono -, di - o tri - sustituido con R^P y opcionalmente
- 20
- benzofusionado, en donde la porción benzo fusionada es opcionalmente mono -, di - o tri - sustituido con R^P
- g) adamantanyl o C₅₋₇cicloalquil monocíclico, teniendo opcionalmente uno o dos miembros de carbono reemplazados opcionalmente con >O, >NH o >N(C₁₋₄alquil) y teniendo opcionalmente uno o dos
- 25
- enlaces insaturados en el anillo;
- h) un C₁₋₆ alquil;
- i) C₁₋₄alquil, mono sustituido por un sustituyente seleccionado del grupo formado por cualquiera de los nombrados en a) hasta g);

R² se selecciona del grupo formado por hidrogeno,

a) Un C_{1-6} alquil

b) adamantanil o C_{5-7} cicloalquil monociclito, teniendo opcionalmente uno o dos miembros de carbono reemplazados opcionalmente con $>O$, $>NH$ o $>N(C_{1-4}alquil)$ y teniendo opcionalmente uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

R^q se selecciona del grupo formado por $-OH$, $-C_{1-6}alquil$, $-OC_{1-6}alquil$, $-C_{3-6}cicloalquil$, $-OC_{3-6}cicloalquil$, $-CN - NO_2 - N(R^y)R^2$ (en donde R^y y R^2 se seleccionan independientemente de H o $C_{1-6}alquil$, o pueden ser tomados ambos con el nitrógeno o la unión para formar otro anillo de hidrocarburo alifático, teniendo dicho anillo tiene 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado por $>O$, $=N$, $>ANH$ o $>N(C_{1-4}alquil)$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo), $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-R^h)COR^t$, $-(N-R^h)SO_2C_{1-6}alquil$ (en donde R^t es H o $C_{1-6}alquil$), $-(C=O)C_{1-6}alquil$, $-(S(O)_n)C_{1-6}alquil$ (en donde n es seleccionado de 0, 1 o 2), $-SO_2N(R^y)R^z$, $-SCF_3$, halo, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-COOH$ y $-COOC_{1-6}alquil$;

c) fenil, opcionalmente, mono-, di- o tri-sustituido con R^q o monosustituido sobre carbonos adyacentes con $-OC_{1-4}alquilenO-$;

d) fenil o piridill unido a dos miembros del anillo adyacente o a tres mitades de miembros hidrocarbonatos para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$, $>NH$ o $N(C_{1-4}alquil)$ la cual tiene hasta un átomo de carbono opcionalmente reemplazado por N , los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^q ;

e) fenil unido a dos miembros del anillo adyacente para formar una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático de seis miembros unidos, dicha mitad

tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los
anillos fusionados, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^q ;

f) naftil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^q ;

g) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene cinco

5 átomos en el anillo, el cual tiene un átomo de carbono que es el punto
de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$,

$>S$, $>NH$ o $N(C_{1-8} \text{alquil})$, teniendo hasta un átomo de carbono adicional

opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono o di

sustituido con R^q y opcionalmente benzofusionado, con la condición

10 que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono en el anillo

estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad

benzofusionada esta opcionalmente mono-, di- o tri- sustituidos con

R^q ;

h) un grupo hidrocarbonato aromático monocíclico que tiene un

15 anillo de seis átomos, que tiene un átomo de carbono el cual es

el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono

reemplazados por N, opcionalmente mono- o di- sustituido con

R^q y opcionalmente benzofusionado, donde la mitad

benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos

20 con R^q ; y

i) un alquil C_{1-4} monosustituido por un sustituyente seleccionado del

grupo que consiste de cualquiera de b) a h);

R^3 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo, alquil C_{1-8} y $-CF_3$;

X es un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o

25 un alquinileno lineal C_{2-4} o un alquilen lineal $C_{0-3}-CH=$ (donde R^4 es un

enlace covalente), opcionalmente mono

o disustituido con un alquil C_{1-4} ;

Y es un enlace covalente o un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o un

alquinileno lineal C_{2-4} opcionalmente mono- o di-sustituido con un alquil C_{1-4} ;

R^4 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo o alquil C_{1-6} o un enlace covalente donde X es un alquileo lineal $C_{0-3}-CH=$;

Ar es seleccionado del grupo que consiste de:

- a) fenil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituido con R^f o monosustituido sobre carbonos adyacentes con $-OC_{1-4}alquileoO-$;

R^f es seleccionado del grupo que consiste de $-OH$, $-alquilC_{1-6}$, $-OalquilC_{1-6}$, $-cicloalquilC_{3-6}$, $-OcicloalquilC_{3-6}$, $-CN$, $-NO_2$, $-N(R^y)R^z$ (en donde R^y y R^z son independientemente seleccionados de H o alquil C_{1-6} o puede ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con $>O$, $=N$, $>NH$ o $>N(alquilC_{1-4})$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo, $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-R^h)COR^i$, $-(N-R^h)SO_2alquilC_{1-6}$ (en donde R^i es H o alquil C_{1-6}), $-(C=O)alquilC_{1-6}$, $-(S(=O)_n)alquilC_{1-6}$, (donde n es seleccionado de 0, 1 o 2), $-SO_2N(R^y)R^z$, $-SCF_3$, halo, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-COOH$ y $-COOC_{1-6}alquil$;

- b) fenil o piridil fusionados a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros , dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(alquilC_{1-4})$ tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri- sustituidos con R^f ;

- c) fenil fusionado a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos

átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^r;

d) naftil, opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^r;

e) un grupo hidrocbonato aromático monocíclico que tiene un anillo de

5 cinco átomos ,que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por >O, >S; >NH o >N(alquilC₁₋₄), que tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^r y opcionalmente benzofusionado con la condición

10 de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^r;

y

f) un grupo hidrocbonado aromático monocíclico que tiene seis

15 átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^r y opcionalmente benzofusionados, donde la mitad benzofudnsionada está opcionalmente mono-,di-sustituida con R^r;

20 R⁵ es seleccionado del grupo que consiste de:

a) -COOR⁶, donde R⁶ es seleccionado del grupo que consiste de H y alquil -C₁₋₄,

b) -CONR⁷R⁸, donde R⁷ y R⁸ son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilC₁₋₆ y cicloalquilC₃₋₆ opcionalmente hidroxi-sustituidos o R⁷ y R⁸ pueden ser tomados

25 junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros , opcionalmente tiene un carbono reemplazado con >O, =N-, >NH o

N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

c) -NHCOR⁹, -N(alquil C₁₋₄)COR⁹, -NHSO₂R¹⁰, -N(alquil C₁₋₄)SO₂R¹⁰, donde R⁹ es seleccionado del grupo que consiste de H, alquilC₁₋₄ Y -OalquilC₁₋₄ y R¹⁰ es seleccionado del grupo que consiste de -CF₃ y -alquil C₁₋₄;

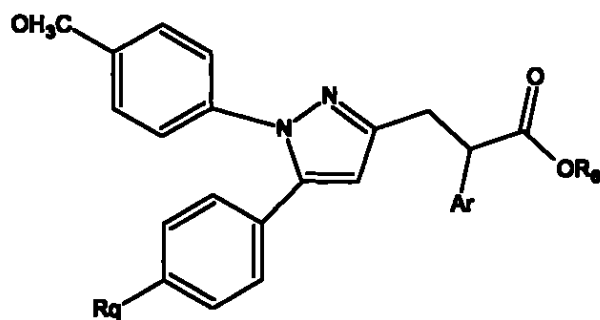
d) tetrazolil, 3-hidroxi-isoxazol-5-il, 2H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 5-oxo-4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 2H-[1,2,4]triazol-3-sulfinil, 3H-[1,2,3]triazol-4-ilsulfanil,

e) -SalquilC₁₋₃-COOR⁶, -OalquilC₁₋₃-COOR⁶, -OalquilC₁₋₃-CON R⁷R⁸, -OalquilC₁₋₃-tetrazolil, y

f) -CN y -(CH₂)₁₋₄-OH;

y enantiómeros, diastereoisómeros y sales farmacéuticamente aceptables y ésteres de los mismos,

excepto, dicho modulador receptor CCK-1 no incluye mezclas racémicas de compuestos de la fórmula general:



donde R⁹, Ar y R⁶ son seleccionados concurrentemente del grupo que consiste de:

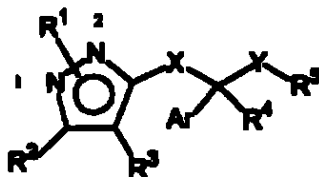
CP#	R ⁹	Ar	R ⁶
R1	-Cl	fenil-	-CH ₂ CH ₃
R2	-Cl	3,4-diMeo-fenil-	-CH ₂ CH ₃
R3	-Cl	4-Meo-fenil-	-CH ₂ CH ₃
R4	-CH ₃	2-naftil-	-CH ₂ CH ₃
R5	-CH ₃	1-naftil-	-CH ₂ CH ₃

273 4

	R6	-CH ₃	2-MeO-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R7	-CH ₃	2-piridil	-CH ₂ CH ₃
	R8	-CH ₃	2-carboximetil-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R9	-CH ₃	3-piridil-	-CH ₂ CH ₃
5	R10	-Cl	4-Meo-fenil-	-H
	R11	-Cl	3,4-diMeO-fenil-	-H
	R12	-CH ₃	2-naftil	-H
	R13	-CH ₃	1-naftil	-H
	R14	-CH ₃	2-carboximetoxifenil	-H
10	R15	-CH ₃	2-carboxi-fenil-	-H

2. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo farmacéuticamente aceptable y un modulador de receptor CCK-1 que tiene la fórmula general:

15



en donde:

R¹ es un sustituyente en la posición 1 o 2 seleccionado del grupo consistente de hidrógeno,

20

- a) fenil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituido con R^p o monosustituido sobre el carbonos adyacentes con -Oalquilenoc₁₋₄O-; R^p es seleccionado del grupo consistente de -OH, -alquilC₁₋₆, -OalquilC₁₋₆, -cicloalquilC₃₋₆, -OcicloalquilC₃₋₆, -CN, -NO₂, -N(R^y)R^z (donde R^y y R^z son independientemente seleccionados del H o alquilC₁₋₆, o puede ser tomado junto con el nitrógeno de unión para

25

formar un anillo hidrocarbonado alifático de otra manera, dicho anillo tiene 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con $>O$, $=N-$, $>NH$ o $N(\text{alquilC}_{1-4})$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo), $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-R^h)COR^t$, $-(N-R^h)SO_2\text{alquilC}_{1-8}$ (en donde R^t es H o alquilC_{1-8}), $-(C=O)\text{alquilC}_{1-8}$, $-(S(=O)_n)-\text{alquilC}_{1-8}$ (donde n es seleccionado de 0,1 o 2), $-SO_2N(R^y)R^z$, $-SCF_3$, halo, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-COOH$ y $-COOC_{1-8}\text{alquil}$;

b) fenil o piridil fusionados a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de 5 miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$, $>NH$ o $N(\text{alquilC}_{1-4})$, la cual tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri-sustituídos con R^p ;

c) fenil unido a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituídos con R^p ;

d) naftil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituído con R^p ;

e) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos ,que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(\text{alquilC}_{1-4})$, que tiene hasta dos átomos de carbono adicionales opcionalmente reemplazados por N, opcionalmente mono-,di- o tri-sustituídos con R^p y opcionalmente benzofusionados con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la

mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^p ;

f) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^p y opcionalmente benzofusionado, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^p ;

g) adamantanil o cicloalquil C_{5-7} monocíclico, opcionalmente teniendo uno o dos miembros de carbono opcionalmente reemplazados por $>O$, $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$ y opcionalmente teniendo uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

h) un alquil C_{1-6} ;

i) un alquil C_{1-4} , monosustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente de cualquiera de a) a g);

R^2 es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno,

a) alquil C_{1-6} ;

b) adamantanil o cicloalquil C_{5-7} monocíclico, opcionalmente teniendo uno o dos miembros de carbono opcionalmente reemplazados por $>O$, $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$ y opcionalmente teniendo uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

R^q es seleccionado del grupo consistente de $-OH$, alquil C_{1-6} , $-O\text{alquil}C_{1-6}$, $-O\text{cicloalquil}C_{3-6}$, $-CN$, $-NO_2$, $-N(R^y)R^z$ (donde R^y y R^z son independientemente seleccionados del H o alquil C_{1-6} , o puede ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonado alifático de otra manera, dicho anillo tiene 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con $>O$, $=N-$, $>NH$ o $N(\text{alquil}C_{1-4})$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo), $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-R^t)COR^t$, $-(N-$

R^b SO₂alquilC₁₋₈ (en donde R^t es H o alquilC₁₋₈), -(C=O)alquilC₁₋₈, -(S=(O)_n)-alquilC₁₋₈ (donde n es seleccionado de 0,1 o 2), -SO₂N(R^y)R^z, -SCF₃, halo, -CF₃, -OCF₃, -COOH y -COOC₁₋₈alquil;

- 5 c) fenil, opcionalmente mono-, di- o tri- sustituido con R^q o monosustituido sobre carbonos adyacentes con -Oalquileno C₁₋₄ O-;
- 10 d) fenil o piridil unidos a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por >O, >S, >NH o >N(alquilC₁₋₄)y
- 15 e) fenil fusionado a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^q;
- 20 f) naftil, opcionalmente sustituido con R^q;
- 25 g) un grupo hidrocarbonato aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por >O, >S, >NH o >N(alquilC₁₋₈), que tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono-, di-sustituidos con R^q y opcionalmente benzofusionados con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^q;

- h) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^p y opcionalmente benzofusionados, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^q ; y
- i) un alquil C_{1-4} , monosustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente de cualquiera de b) a h);

10 R^3 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo, alquil C_{1-6} y $-CF_3$;

X es un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o un alquinileno lineal C_{2-4} o un alquilen C_{0-3} -CH= (donde R^4 es un enlace covalente), opcionalmente mono o disustituido con un alquil C_4 ;

Y es un enlace covalente o un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o un alquinileno lineal C_{2-4} opcionalmente mono o disustituido con un alquil C_{1-4} ;

R^4 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo o alquil C_{1-6} o un enlace covalente donde X es un alquilen C_{0-3} -CH=;

Ar es seleccionado del grupo que consiste de:

20 a) fenil, opcionalmente mono, di o tri sustituido con R^f o monosustituido sobre carbonos adyacentes con $-OC_{1-4}$ alquilen $O-$;

R^f es seleccionado del grupo que consiste de $-OH$, $-alquilC_{1-6}$, $-OalquilC_{1-6}$, $-cicloalquilC_{3-6}$, $-OcicloalquilC_{3-6}$, $-CN$, $-NO_2$, $-N(R^y)R^z$ (en donde R^y y R^z son independientemente seleccionados de H o alquil C_{1-6} o pueden ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con $>O$, $=N-$, $>NH$ o $>N(alquilC_{1-4})$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo, $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-$

R^bCOR^t , $-(N-R^b)SO_2\text{alquil}C_{1-8}$ (en donde R^t es H o $\text{alquil}C_{1-8}$), $-(C=O)\text{alquil}C_{1-8}$, $-(S(O)_n)-\text{alquil}C_{1-8}$, (donde n es seleccionado de 0, 1 o 2), $-SO_2N(R^y)R^z$, $-SCF_3$, halo, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-COOH$ y $-COOC_{1-8}\text{alquil}$;

5 b) fenil o piridil fusionados a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$ y la cual tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente
10 sustituido por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri- sustituidos con R^f ;

c) fenil unido a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos
15 átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^f ;

d) naftil, opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^f ;

e) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos ,que tiene un átomo de carbono el cual es el
20 punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$, que tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono-,di- o tri-sustituidos con R^f y opcionalmente benzofusionado con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de
25 carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^f ; y

f) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el

punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^r y opcionalmente benzofusionados, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^r;

5

R⁵ es seleccionado del grupo que consiste de:

a) -COOR⁶, donde R⁶ es seleccionado del grupo que consiste de H y alquil-C₁₋₄,

10

b) -CONR⁷R⁸, donde R⁷ y R⁸ son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilC₁₋₆ y cicloalquilC₃₋₆ opcionalmente hidroxi-sustituidos o R⁷ y R⁸ pueden ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con >O, =N-, >NH o N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

15

c) -NHCOR⁹, -N(alquilC₁₋₄)COR⁹, -NH SO₂R¹⁰, -N(alquilC₁₋₄) SO₂R¹⁰, donde R⁹ es seleccionado del grupo que consiste de H, alquilC₁₋₄ Y -OalquilC₁₋₄ y R¹⁰ es seleccionado del grupo que consiste de -CF₃ y - alquil C₁₋₄;

20

d) tetrazolil, 3-hidroxi-isoxazol-5-il, 2H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 5-oxo-4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 2H-[1,2,4]triazol-3-sulfinil, 3H-[1,2,3]triazol-4-ilsulfanil,

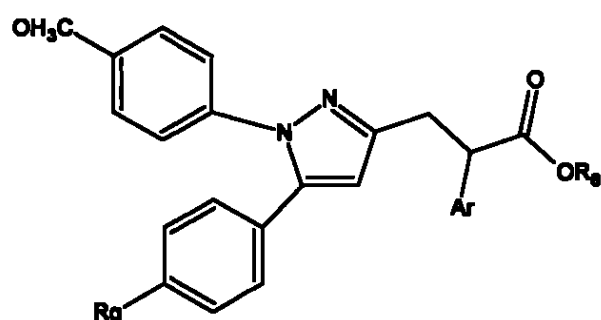
e) -SalquilC₁₋₃-COOR⁶, - OalquilC₁₋₃-COOR⁶, -OalquilC₁₋₃-CON R⁷R⁸, -O alquilC₁₋₃-tetrazolil, y

25

f) -CN y -(CH₂)₁₋₄-OH;

y enantiómeros, diastereoisómeros y sales farmacéuticamente aceptables y ésteres de los mismos,

excepto , dicho modulador de receptor CCK-1 no incluye mezclas racémicas de compuestos de la fórmula general:

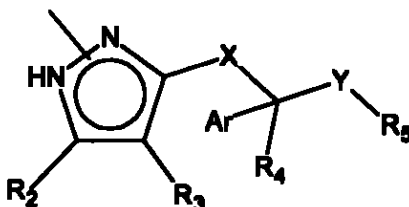


donde R^q, Ar y R⁶ son seleccionados concurrentemente del grupo que consiste de:

5	CP#	R ^q	Ar	R ⁶
	R1	-Cl	fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R2	-Cl	3,4-diMeo-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R3	-Cl	4-Meo-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R4	-CH ₃	2-naftil-	-CH ₂ CH ₃
10	R5	-CH ₃	1-naftil-	-CH ₂ CH ₃
	R6	-CH ₃	2-MeO-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R7	-CH ₃	2-piridil	-CH ₂ CH ₃
	R8	-CH ₃	2-carboximetil-fenil-	-CH ₂ CH ₃
	R9	-CH ₃	3-piridil-	-CH ₂ CH ₃
15	R10	-Cl	4-Meo-fenil-	-H
	R11	-Cl	3,4-diMeO-fenil-	-H
	R12	-CH ₃	2-naftil	-H
	R13	-CH ₃	1-naftil	-H
	R14	-CH ₃	2-carboximetoxi-fenil	-H
20	R15	-CH ₃	2-carboxi-fenil-	-H

3. Un compuesto como modulador de receptor CCK-1 que tiene la fórmula general:

R1



5

en donde R¹ es un sustituyente en la posición 1 o 2 seleccionado del grupo consistente de hidrógeno,

a) fenil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituido con R^P o monosustituido

sobre el carbonos adyacentes con -Oalquilenoc₁₋₄O-; R^P es

10

seleccionado del grupo consistente de -OH, -alquilC₁₋₆, -O alquilC₁₋₆, -

cicloalquilC₃₋₆, -OcicloalquilC₃₋₆, -CN, -NO₂, -N(R^Y)R^Z (donde R^Y y R^Z

son independientemente seleccionados del H o alquilC₁₋₆, o puede ser

tomado junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo

hidrocarbonado alifático de otra manera, dicho anillo tiene 5 a 7

15

miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con >O, =N-,

>NH o N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente tiene uno o dos enlaces

insaturados en el anillo), -(C=O)N (R^Y)R^Z, -(N-R^b)COR^t, -(N-

R^b)SO₂alquilC₁₋₆ (en donde R^t es H o alquilC₁₋₆), -(C=O)alquilC₁₋₆, -

(S=(O)_n)-alquilC₁₋₆ (donde n es seleccionado de 0,1 o 2), -SO₂

20

N(R^Y)R^Z, -SCF₃, halo, -CF₃, -OCF₃, -COOH y -COOC₁₋₆alquil;

b) fenil o piridil fusionados a dos miembros del anillo adyacente para una

mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo

aromático fusionado de 5 miembros, dicha mitad tiene un átomo de

carbono reemplazado por >O, >S, >NH o N(alquilC₁₋₄), la cual tiene

25

hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por

N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con

R^P;

- c) fenil unido a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^P ;
- d) naftil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituido con R^P ;
- e) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$, que tiene hasta dos átomos de carbono adicionales opcionalmente reemplazados por N, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^P y opcionalmente benzofusionados con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^P ;
- f) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^P y opcionalmente benzofusionado, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^P ;
- g) adamantanil o cicloalquil C_{5-7} monocíclico, opcionalmente teniendo uno o dos miembros de carbono opcionalmente reemplazados por $>O$, $>NH$ o $>N(\text{alquil}C_{1-4})$ y opcionalmente teniendo uno o dos enlaces insaturados en el anillo;
- h) un alquil C_{1-6} ;
- i) un alquil C_{1-4} , monosustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente de cualquiera de a) a g);

R² es seleccionado del grupo consistente de hidrógeno,

a) un alquilC₁₋₆;

b) adamantanil o cicloalquilC₅₋₇ monocíclico, opcionalmente teniendo uno o dos miembros de carbono opcionalmente reemplazados por >O, >NH o >N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente teniendo uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

R^q es seleccionado del grupo consistente de -OH, alquilC₁₋₆, -OalquilC₁₋₆, -OcicloalquilC₃₋₆, -CN, -NO₂, -N(R^y)R^z (donde R^y y R^z son independientemente seleccionados del H o alquilC₁₋₆, o puede ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonado alifático de otra manera, dicho anillo tiene 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con >O, =N-, >NH o N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo), -(C=O)N(R^y)R^z, -(N-R^b)CORⁱ, -(N-R^b)SO₂alquilC₁₋₆ (en donde Rⁱ es H o alquilC₁₋₆), -(C=O)alquilC₁₋₆, -(S(O)_n)-alquilC₁₋₆ (donde n es seleccionado de 0,1 o 2), -SO₂N(R^y)R^z, -SCF₃, halo, -CF₃, -OCF₃, -COOH y -COOC₁₋₆alquil;

c) fenil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituido con R^q o monosustituido sobre carbonos adyacentes con -Oalquileno C₁₋₄ O-;

d) fenil o piridil unidos a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un anillo aromático fusionado de cinco miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por >O, >S, >NH o >N(alquilC₁₋₄) y tiene hasta un átomo de carbono adicional, opcionalmente reemplazado por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di-, tri-sustituidos con R^q;

e) fenil fusionado a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos

átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^q ;

f) naftil, opcionalmente sustituido con R^q ;

g) un grupo hidrocarbonato aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(\text{alquil } C_{1-8})$, que tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono-, di-sustituidos con R^q y opcionalmente benzofusionados con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^q ;

h) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^p y opcionalmente benzofusionados, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^q ; y

i) un alquil C_{1-4} , monosustituido por un sustituyente seleccionado del grupo consistente de cualquiera de b) a h);

R^3 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo, alquil C_{1-8} y $-CF_3$;

X es un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o un alquinileno lineal C_{2-4} o

un alquilen $C_{0-3}-CH=$ (donde R^4 es un enlace covalente), opcionalmente mono o disustituido con un alquil C_{1-4} ;

Y es un enlace covalente o un alquilen C_{1-4} o un alquenileno lineal C_{2-4} o un alquinileno lineal C_{2-4} opcionalmente mono o disustituido con un alquil C_{1-4} ;

R^4 es seleccionado del grupo que consiste de H, halo o alquil C_{1-6} o un enlace covalente donde X es un alquileo lineal $C_{0-3}-CH=$;

Ar es seleccionado del grupo que consiste de:

- 5 a) fenil, opcionalmente mono, di o tri sustituido con R^f o monosustituido sobre carbonos adyacentes con $-OC_{1-4}alquileoO-$;
- R^f es seleccionado del grupo que consiste de $-OH$, $-alquilC_{1-6}$, $-OalquilC_{1-6}$, $-cicloalquilC_{3-6}$, $-OcicloalquilC_{3-6}$, $-CN$, $-NO_2$, $-N(R^y)R^z$ (en donde R^y y R^z son independientemente seleccionados de H o alquil C_{1-6} o pueden ser tomados junto con el nitrógeno de unión para
- 10 formar un anillo hidrocarbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con $>O$, $=N-$, $>NH$ o $>N(alquilC_{1-4})$ y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo, $-(C=O)N(R^y)R^z$, $-(N-R^h)COR^t$, $-(N-R^h)SO_2alquilC_{1-6}$ (en donde R^t es H o alquil C_{1-6}), $-(C=O)alquilC_{1-6}$, $-(S(=O)_n)-alquilC_{1-6}$, (donde n es seleccionado de 0, 1 o 2), $-SO_2N(R^y)R^z$, $-SCF_3$, halo, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-COOH$ y $-COOC_{1-6}alquil$;
- 15 b) fenil o piridil fusionados a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de tres miembros para formar un
- 20 anillo aromático fusionado de cinco miembros, dicha mitad tiene un átomo de carbono reemplazado por $>O$, $>S$; $>NH$ o $>N(alquilC_{1-4})$ y la cual tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente sustituido por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri- sustituidos con R^f ;
- 25 c) fenil unido a dos miembros del anillo adyacente para una mitad hidrocarbonada provista de cuatro miembros para formar un anillo aromático fusionado de seis miembros, dicha mitad tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, los anillos fusionados opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^f ;

d) naftil, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^f;

e) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene un anillo de cinco átomos, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene un átomo de carbono reemplazado por >O, >S; >NH o >N(alquilC₁₋₄), que tiene hasta un átomo de carbono adicional opcionalmente reemplazado por N, opcionalmente mono-, di- o tri-sustituidos con R^f y opcionalmente benzofusionado con la condición de que dos o cuantos menos de dichos átomos de carbono del anillo estén reemplazados por un heteroátomo, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di- o tri-sustituida con R^f; y

f) un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico que tiene seis átomos en el anillo, que tiene un átomo de carbono el cual es el punto de unión, que tiene uno o dos átomos de carbono reemplazados por N, opcionalmente mono-, o di-sustituidos con R^f y opcionalmente benzofusionados, donde la mitad benzofusionada está opcionalmente mono-, di-sustituida con R^f;

R⁵ es seleccionado del grupo que consiste de:

- a) -COOR⁶, donde R⁶ es seleccionado del grupo que consiste de H y alquil -C₁₋₄,
- b) -CONR⁷R⁸, donde R⁷ y R⁸ son independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alquilC₁₋₆ y cicloalquilC₃₋₆ opcionalmente hidroxi-sustituidos o R⁷ y R⁸ pueden ser tomados junto con el nitrógeno de unión para formar un anillo hidrocarbonato alifático de otra manera, dicho anillo tiene de 5 a 7 miembros, opcionalmente tiene un carbono reemplazado con >O, =N-, >NH o N(alquilC₁₋₄) y opcionalmente tiene uno o dos enlaces insaturados en el anillo;

c) -NHCOR^9 , $\text{-N(alquilC}_{1-4}\text{)COR}^9$, $\text{-NHSO}_2\text{R}^{10}$, $\text{-N(alquilC}_{1-4}\text{)SO}_2\text{R}^{10}$,
 donde R^9 es seleccionado del grupo que consiste de H, alquil C_{1-4} y $\sim$
 -OalquilC_{1-4} y R^{10} es seleccionado del grupo que consiste de -CF_3 y
 $\sim$ alquil C_{1-4} ;

5 d) tetrazolil, 3-hidroxi-isoxazol-5-il, 2H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 5-oxo-
 4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil, 2H-[1,2,4]triazol-3-sulfinil, 3H-
 [1,2,3]triazol-4-ilsulfanil,

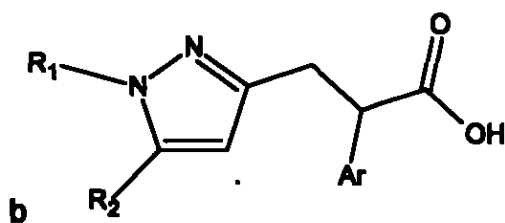
e) $\text{-SalquilC}_{1-3}\text{-COOR}^6$, $\text{-OalquilC}_{1-3}\text{-COOR}^6$, $\text{-OalquilC}_{1-3}\text{-CON R}^7\text{R}^8$, -O
 alquil C_{1-3} -tetrazolil, y

10 f) -CN y $\text{-(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{-OH}$;

y enantiómeros, diastereoisómeros y sales farmacéuticamente aceptables y
 ésteres de los mismos, para el tratamiento de desordenes en mamíferos que
 involucra la acción del receptor CCK-1.

4. Un compuesto que tiene la fórmula general:

15



donde R^2 , R^1 y Ar son seleccionados concurrentemente del grupo que consiste de:

R^2	R^1	Ar
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metil-fenil)- [(S) enantiomero], Na ⁺ sal
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-metil-fenil)-
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-metil-fenil)- [(R) enantiomero],

(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-metil-fenil)- [(S) <i>enantiomero</i>], TFA sal
(4-Metil- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(4-Cloro-fenil)-
(2-Cloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il-
(2-Cloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Fenil-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
Fenil-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Fenoxi-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Nitro-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Benzo[1,3]dioxol-5- il-
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Difluoro- fenil)-

(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2-Trifluorometil- fenil)-
(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Etoxi-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(3,4-Dicloro- fenil)-	(2-fluoro-3- Trifluorometil- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(4- Trifluorometoxi- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3- Trifluorometoxi- fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(3,4-Dicloro- fenil)-	(3-Yodo-fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(3,4-Dicloro- fenil)-	(3,5-Dimetil- fenil)-
(4-Metil- fenil)-	(3,4-Dicloro- fenil)-	(3-Trifluorometil- sulfanil-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il- [(R) <i>enantiomero</i>]
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il- [(S) <i>enantiomero</i>]
(4-Metoxi-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)- [(R) <i>enantiomero</i>]

(4-Metoxi-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)- [(S) <i>enantiomero</i>]
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Bifenil-4-il
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	(3-Trifluorometil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	Naftalen-2-il-

(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(2,3-Dicloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Fluoro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2,6-Dicloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2,3-Dimetoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	[(R) <i>enantiomero</i>]
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	[(S) <i>enantiomero</i>]
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Benzo[b]tiofen-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	4-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-

(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	(3-Trifluorometil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Cloro-fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	(3-Trifluorometil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-

(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	(3-Trifluorometil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(3-Trifluorometil-fenil)-

(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	(4-Trifluorometil-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(3-Trifluorometil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(3-Nitro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	Benzo[1,3]dioxol-5-il-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	Benzo[b]tiofen-4-il-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(2,3-Difluoro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(2-Trifluorometil-fenil)-

295 36

(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	(3,4-Dicloro-fenil)-	(3-Trifluorometoxi-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	Naftalen-1-il-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	Fenil-
(4-Metil-fenil)-	Bencil-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Cloro-4-fluoro-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2,6-Dicloro-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Metoxi-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Fenil-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Metil-fenil)-

(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-Fluoro-fenil)-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Cloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Piridin-3-il-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Naftalen-1-il-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Naftalen-2-il-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Nitro-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	Benzo[1,3]dioxol-5-il-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(2-fluoro-3-Trifluorometil-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3-Yodo-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metoxi-fenil)-	(3,5-Dimetil-fenil)-

292

(3,4-Dicloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Dicloro- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metil-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Fenil-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-2-il-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Nitro-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Difluoro- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(2-Trifluorometil- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Etoxi-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(2-fluoro-3- Trifluorometil- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(4- Trifluorometoxi- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Trifluorometil- sulfanil-fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Yodo-fenil)-

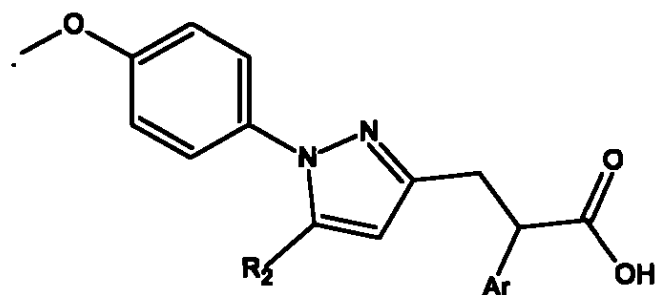
298 29

Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(3,5-Dimetil- fenil)-
Benzo[1,3]dioxo l-5-il-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Dicloro- fenil)-
(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metil-fenil)-
(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Metoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-2-il-
Fenil-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
Fenil-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il-
Fenil-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
Fenil-	(4-Metoxi- fenil)-	Fenil-
(2-Cloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(2-Cloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Fenil-
(2-Cloro- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metil-fenil)-

(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Cloro-fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-1-il-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Metoxi-fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Fenil-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Naftalen-2-il-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	Benzo[1,3]dioxol-5- il-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Difluoro- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2-Trifluorometil- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Etoxi-fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2-fluoro-3- Trifluorometil- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3- Trifluorometoxi- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Trifluorometil- sulfanil-fenil)-

(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3-Yodo- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(3,5-Dimetil- fenil)-
(4-Fenoxi- fenil)-	(4-Metoxi- fenil)-	(2,3-Dicloro- fenil)-

5. Un compuesto que tiene la formula general:



5

donde R^2 y Ar son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

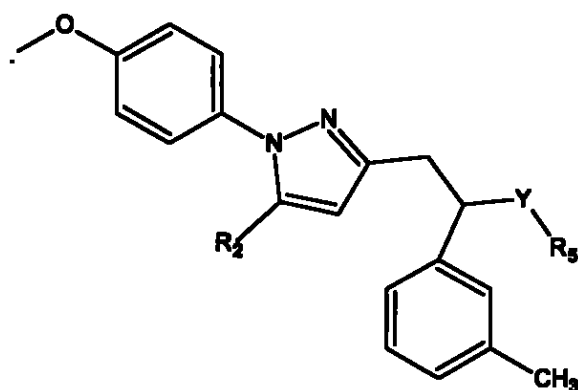
R^2	Ar
(4-Metoxi- fenil)-	Benzofuran-3-il-
(4-Metil-Fenil)-	[1-(2-Trimetilsilanil- etoximetil)-1H-indol-3-il]-
(4-Metil-Fenil)-	(1H-indol-3-il)-
(4-Metil-Fenil)-	(1-Metil-1H-indol-3-il)-
(3,4-Dicloro- fenil)-	Benzofuran-3-il-
Benzo[1,3]dioxol- 5-il-	Benzofuran-3-il-

Fenil- Benzofuran-3-il-

(2-Cloro- Benzofuran-3-il-
fenil)-

(4-Fenoxi- Benzofuran-3-il-
fenil)-

6. Un compuesto que tiene la formula general:

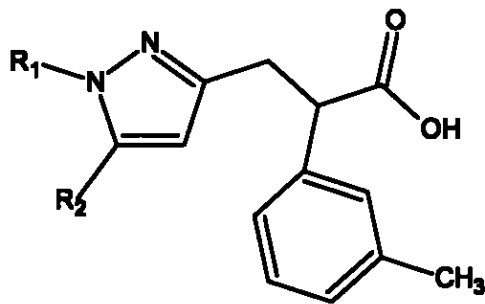


5 donde R^2 y R^5 -Y- son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

R^2	R^5 -Y-
(4-Metil-Fenil)-	(Hidroxi-metil)-
(4-Metil-Fenil)-	(2-hidroxi-ciclohexil- carbamoil)-
(4-Metil-Fenil)-	Carbamoil-
(4-Metil-Fenil)-	(Dimetil-carbamoil)-
(4-Metil-Fenil)-	(Metil-Carbamoil)-
(4-Metil-Fenil)-	(4-Metil-piperacin-1- carbonil)-

(4-Metil-Fenil)-	Ciano-
(4-Metil-Fenil)-	(1H-tetrasol-5-il)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(Carboxi-metoxi-metil)-

7. Un compuesto que tiene la formula general:



5 donde R^2 y R^1 son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

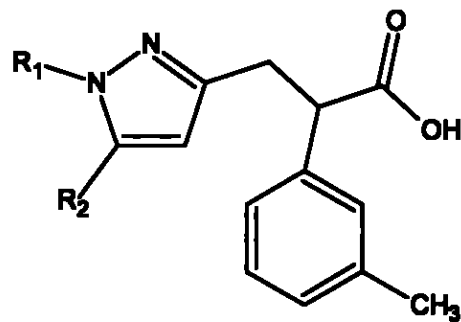
R^2	R^1
(4-Fenoxi-fenil)-	(4-ter-butil-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4-Metanosulfonil-fenil)-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	(2-Cloro-fenil)-
(3-Cloro-fenil)-	(2,4-Dicloro-fenil)-
(4-Benziloxi-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-

(4-Dimetilamino-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(3-Metoksi-4-metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(3-Ciclopentiloksi-4-metoksi-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(4-Bromo-3-metil-fenil)-	(4-Fenoksi-fenil)-
Naftalen-2-il-	(2,4-Dicloro-fenil)-
Naftalen-2-il-	(2-Cloro-fenil)-
Naftalen-2-il-	(4-Metanosulfonil-fenil)-
Naftalen-2-il-	(4- <i>ter</i> -butil-fenil)-
Naftalen-2-il-	(4-Trifluorometoksi-fenil)-
Naftalen-2-il-	(4-Metil-fenil)-
Naftalen-2-il-	(4-Fenoksi-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(2,4-Dicloro-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	(4- <i>ter</i> -butil-fenil)-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	(2,4-Dicloro-fenil)-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	(4-Metanosulfonil-fenil)-

Benzo[1,3]dioxol-5-il-	(4-ter-butil-fenil)-
(3-Cloro-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(3-Cloro-fenil)-	(4-Metanosulfonil-fenil)-
(3-Cloro-fenil)-	(4-ter-butil-fenil)-
(4-Fenoxi-fenil)-	(2,4-Dicloro-fenil)-
(4-Fenoxi-fenil)-	(2-Cloro-fenil)-
(4-Fenoxi-fenil)-	(4-Metanosulfonil-fenil)-
(4-Benziloxi-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(4-Benziloxi-fenil)-	(4-Fenoxi-fenil)-
(4-Dimetilamino-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-
(4-Dimetilamino-fenil)-	(4-Fenoxi-fenil)-
(4-Bromo-3-metil-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(3-Metoxi-4-metil-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-
(3-Metoxi-4-metil-fenil)-	(4-Fenoxi-fenil)-
(3-Ciclopentiloxi-4-metoxi-fenil)-	(4-Fenoxi-fenil)-
(3-Ciclopentiloxi-4-metoxi-fenil)-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-

(3-Ciclopentiloxi-4-
metoxi-fenil)-
(4-Cloro-3-metil-fenil)- (4-Fenoxi-fenil)-
(4-Isopropil-fenil)-

8. Un compuesto que tiene la formula general:



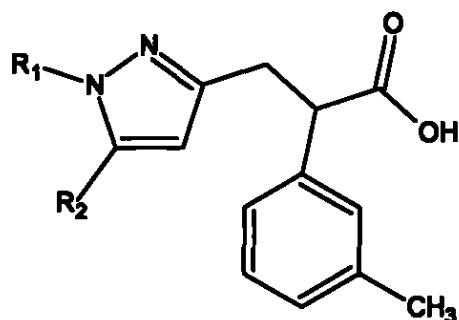
5

donde R^2 y R^1 son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

R^2	R^1
Naftalen-2-il-	Piridin-2-il-
Piridin-3-il-	(2,4-Dicloro-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	Piridin-2-il-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	Piridin-2-il-
(3-Cloro-fenil)-	Piridin-2-il-
(4-Fenoxi-fenil)-	Piridin-2-il-
Piridin-3-il-	(4-ter-butil-fenil)-

9. Un compuesto que tiene la formula general:

5

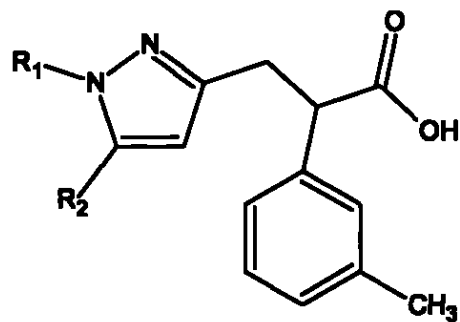


donde R^2 y R^1 son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

R^2	R^1
Naftalen-2-il-	H-
(3,4-Dicloro-fenil)-	Metil
Naftalen-2-il-	Ciclohexil-
H-	(4-Trifluorometoxi-fenil)-
H-	(4-Metil-fenil)-
H-	(4-Fenoxi-fenil)-
(3,4-Dicloro-fenil)-	Ciclohexil-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	H-
Benzo[1,3]dioxol-5-il-	Ciclohexil-

(3-Cloro-fenil)-	H-
(3-Cloro-fenil)-	Metil
(3-Cloro-fenil)-	Ciclohexil-
(4-Fenoxi-fenil)-	H-
(4-Fenoxi-fenil)-	Ciclohexil-
(4-Dimetilamino-fenil)-	Ciclohexil-
(4-Bromo-3-metil-fenil)-	Ciclohexil-
(3-Ciclopentiloxi-4-metoxi-fenil)-	Ciclohexil-

10. Un compuesto que tiene la formula general:



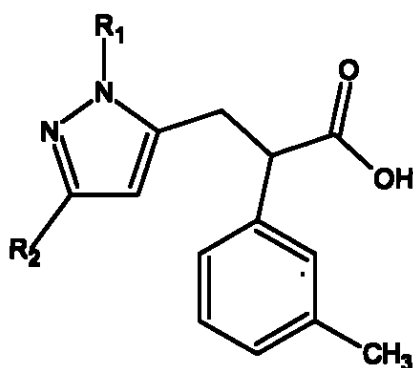
5

Donde R² y R¹ son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

R ²	R ¹
(7-Metoxi-benzofuran-2-il)-	(4-Fenoxi-fenil)-

(7-Metoxi- benzofuran-2-il)-	(4-Trifluorometoxi- fenil)-
(7-Metoxi- benzofuran-2-il)-	(4-Metil-fenil)-
(7-Metoxi- benzofuran-2-il)-	Ciclohexil-

11. Un compuesto que tiene la formula general:



donde R² y R¹ son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten

5 de:

R ²	R ¹
(3,4-Dicloro-fenil)-	Metil
Naftalen-2-il-	Ciclohexil-
H	(4-Fenoxi-fenil)-
Metil-	(4-Fenoxi-fenil)-
H	(4-Trifluorometoxi- fenil)-
H	(4-Metil-fenil)-
Metil-	(4-Trifluorometoxi- fenil)-

Metil- (4-Metil-fenil)-

(4-Bromo-3-metil-fenil)- Ciclohexil-

(3,4-Dicloro-fenil)- Ciclohexil-

Benzo[1,3]dioxol-5-il- Ciclohexil-

(3-Cloro-fenil)- Metil

(3-Cloro-fenil)- Ciclohexil-

(4-Fenoxi-fenil)- Ciclohexil-

12. Un compuesto de la reivindicación 1 seleccionado de:

3-[5-(3,4-Dicloro-fenil)-1-(4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-*m*-toluil-ácido acrílico;

3-[5-(3,4-Dicloro-fenil)-1-(4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-2-*m*-toluil-ácido

5 propionico;

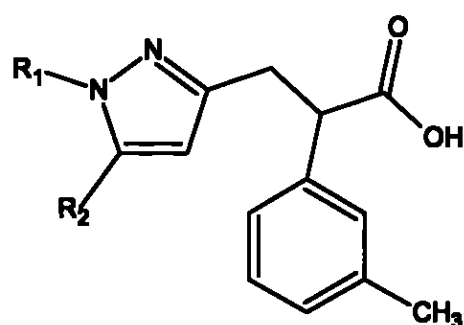
2-Benzofuran-3-il-3-[1-(4-metoxi-fenil)-5-*p*-toluil-1*H*-pirazol-3-il]-ácido propionico;

2-Benzofuran-3-il-3-[5-(4-cloro-fenil)-1-(4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-ácido propionico; y

2-(3-cloro-fenil)-3-[5-(3,4-dicloro-fenil)-1-(4-etoxi-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-ácido

10 acrílico.

13. Un compuesto que tiene la fórmula general:



donde R^2 y R^1 son seleccionados concurrentemente de los grupos que consisten de:

R^2	R^1
Naftalen-2-il-	Piridin-3-il-
Naftalen-2-il-	piridin-4-il-
Naftalen-2-il-	(6-Metil-piridin-2-il)-
Naftalen-2-il-	(3-Metoxi-piridin-2-il)-
Naftalen-2-il-	(5-Metoxi-piridin-2-il)-
Naftalen-2-il-	(6-Metoxi-piridin-3-il)-
Naftalen-2-il-	(4-etoxi-piridin-2-il)-
Naftalen-2-il-	(4-Dimetilamino-fenil)-
Naftalen-2-il-	(5-Dimetilamino-2-metoxi-fenil)-
(3-Dimetilamino-fenil)-	(4-Metil-fenil)-
(3,5-Bis-dimetilamino-fenil)-	(4-Metil-fenil)-

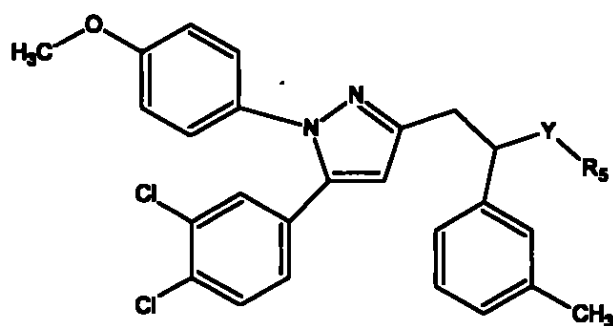
(3-Dimetilamino-4-metoxi- (4-Metil-fenil)-
fenil)-

(1-Metil-piperidin-4-il)- (4-Metil-fenil)-

(1-Metil-piperidin-3-il)- (4-Metil-fenil)-

(4-dimetilamino-ciclohexil)- (4-Metil-fenil)-

14. Un compuesto que tiene la formula general:



donde R^5 -Y- esta seleccionado por los grupos que consisten de:

R^5 -Y-

(3-Hidroxi-isoxazol-5-il)-

(5-Oxo-4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-ilsulfanil)-
metil-

(3H-[1,2,3]Triazol-4-ilsulfanil)-metil-

(2H-[1,2,4]Triazol-3-ilsulfanil)-metil-

(2H-[1,2,4]Triazol-3-sulfinil)-metil-

Trifluorometanosufonilamino-

15. Un compuesto de la reivindicación 1, que tiene la estructura 3-[5-Benzo[1,3]dioxol-5-il-1-(2,5-dicloro-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-(3-cloro-fenil)-ácido acrílico.

5 16. Un compuesto de la reivindicación 1, que tiene la estructura 5-{2-[5-(3,4-dicloro-fenil)-1-(4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol-3-il]-1-*m*-toluil-etil}-1*H*-tetrazol.

EXAMEN TÉCNICO DE FONDO	
Nº Radicación: 23-56089	Fecha de presentación: 23.03.07
Nº Prioridad: 15.06/193498	Fecha de Prioridad: 21.07.07.
Palabras clave:	
Dir 470 103	
hck	

313

CLASIFICACIONES INTERNACIONALES DE BÚSQUEDA			
16L 2945			

DOCUMENTOS CORRESPONDIENTES EN OTROS PAÍSES			
507044/7467			
Patente Original			

BASES DE DATOS CONSULTADAS			
epoline			
upte			

INFORMES DE EXAMENES EN OTRAS OFICINAS		
Oficina	Fecha	Relv. afectadas

ANTERIORIDAD:		ENCONTRADAS	
Documento		Relevancia	Relv. afectadas
ep 0295720		NOV	1-66
		patente	

LITERATURA NO PATENTES			
Documento		Relevancia	Relv. afectadas

Observaciones	
9946 lab.	

Fecha del examen
30.10.06