

Señor Director

División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-139683- -00009-0000

Fecha: 2013-05-28 15:16:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 59

Re.: Expediente **No. 09 139683**

Solicitud de Patente de invención para: **“MODULACIÓN DE RECEPTORES QUIMIOSENSORIALES Y LIGANDOS RELACIONADOS CON LOS MISMOS”**

Solicitante: **SENOMYX INC**

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

Yo, **Margarita Castellanos Abondano**, identificada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio **No.165** notificado por fijación en lista del 15 de enero de 2013, estando dentro del término de la prórroga solicitada el 10 de abril de 2013, en los siguientes términos:

De la solicitud de patente

El Examinador señala lo siguiente:

- “El objeto de las reivindicaciones 61-62, con referencia a método de tratamiento, no es patentable”.
- “La reivindicación 1 y sus dependientes, que se refieren a un método de cribado, se encuentran caracterizadas por el objetivo, efecto fisiológico o su actividad funcional. Se sugiere caracterizar el ensayo de acuerdo a sus elementos esenciales”.

- “Las reivindicaciones 1, 4, 42 y 63, se encuentran de manera independiente de la número 1. Se sugiere aclarar, las dependencias o los inventos que desea proteger, de acuerdo a lo mencionado en la descripción”.
- “La reivindicación 5, se encuentra caracterizada por la actividad biológica”.
- “Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización de los compuestos, composiciones y proceso de preparación, que han sido elaborados o probados con sus respectivas estructuras o ingredientes, es decir, que se encuentra debidamente sustentados en el capítulo descriptivo y que se encuentran bajo un mismo concepto común e inventivo”.

Con el fin de atender las observaciones formuladas a este respecto, y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 55 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas de la siguiente manera:

- Las reivindicaciones 1 a 6 y 61 a 62 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas.
- Las dependencias de las reivindicaciones se han modificado de acuerdo con las sugerencias del Examinador.
- Con respecto a la objeción formulada a las reivindicaciones 63-64 alegando que mencionan un procedimiento no definido por características tales como etapas y condiciones específicas de cada etapa, se aclara a su Despacho que ambas reivindicaciones indican que se debe hacer reaccionar el compuesto "con una base", lo cual es claro para una persona versada en la materia al momento de ejecutar la invención. Por lo tanto, el solicitante considera que dichas

reivindicaciones definen las características esenciales del método de forma específica.

- Se presenta un nuevo pliego reivindicatorio cuyo alcance ha sido simplificado con respecto al originalmente presentado, y por lo tanto, es menos complejo y constituye una generalización razonable de los compuestos, composiciones y procesos de preparación ejemplificados.

Así entonces, teniendo en cuenta las anteriores aclaraciones y las modificaciones efectuadas al capítulo reivindicatorio, consideramos que las objeciones que por claridad hizo su Despacho quedan superadas ya que las reivindicaciones del nuevo pliego se refieren a materia patentable, son claras, concisas y se encuentran debidamente soportadas en la descripción.

Novedad y Nivel Inventivo

Su Despacho concluye que los documentos US2007/0104709 (D1) y US3843804 (D2) afectan la novedad de las reivindicaciones 1-6 y que los documentos D1 y US2006/0045953 (D3) afectan el nivel inventivo de las reivindicaciones 7-64. Su Despacho enuncia:

- “Las características esenciales del método de cribado de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1”.

Asimismo, el Examinador señala que las características esenciales del mejorador del ligando del receptor quimio-sensorial de la reivindicación 4, habían sido divulgadas previamente en el documento D1”.

- “La persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría otro heteroátomo y posición de la función amida, de acuerdo al documento D1, en los mejoradores de ligando del receptor quimiosensorial del documento D3, para llegar así al objeto de la reivindicación 7 de la solicitud”.

- “No se evidencia además, que los mejoradores del ligando del receptor quimiosensorial, de la presente solicitud tiene un efecto inesperado y superior a los divulgados en el estado de la técnica”.

En cuanto a las objeciones del examinador deseamos poner de presente lo siguiente:

En primer lugar, se pone de presente que debido a que las reivindicaciones 1 a 6 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio, la objeción formulada por falta de novedad frente a los documentos D1 y D2 se debe tener por superada.

De otro lado, con respecto a la falta de nivel inventivo, se aclara lo siguiente:

De acuerdo con el artículo 18 de la Decisión 486:

“Artículo 18.- Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

De conformidad con el anterior artículo, se exponen a continuación las razones por las cuales la presente invención es inventiva frente a las enseñanzas de los documentos D1 y D3:

El problema planteado en la presente solicitud consiste en la necesidad de proporcionar métodos, compuestos, composiciones y un proceso de preparación de mejoradores de ligando del receptor quimiosensorial. Este problema es el que precisamente soluciona la presente invención toda vez que proporciona un método, mejoradores de ligando del receptor quimiosensorial, composiciones que lo contienen y su proceso de fabricación, que presentan los efectos deseados.

Ahora bien, con las modificaciones efectuadas al pliego reivindicatorio se deben tener por superadas las objeciones por nivel inventivo toda vez que los compuestos ahora reivindicados son estructuralmente diferentes de los compuestos divulgados en los documentos citados D1 y D3. En particular, los documentos D1 y D3 no proporcionan ninguna divulgación o sugerencia que pudiese motivar a una persona versada en el área técnica a modificar los compuestos de referencia de modo tal de obtener los compuestos reivindicados, tal como se muestra a continuación:

Reivindicación 1:

El compuesto de formula (I) de la reivindicación 1 requiere la presencia de un grupo sulfonamida cíclico. Ni D1 ni D3 divulgan o sugieren un compuesto que tiene un grupo sulfonamida cíclico, o sugieren modificar los compuestos divulgados para incluir un grupo sulfonamida cíclico. Por lo tanto, una persona versada en la materia no derivaría de manera obvia u evidente el compuesto de formula (I) a partir de las enseñanzas de los documentos D1 y D3.

Reivindicación 2:

El compuesto de formula (IIc) de la reivindicación 2 incluye un núcleo de pirimidona bicíclica fusionada. Los documentos D1 y D3 no enseñan o sugieren un compuesto que tiene un núcleo de pirimidonabicíclica fusionada, o sugiere modificar los compuestos divulgados para incluir un núcleo de pirimidona bicíclica fusionada. Por lo tanto, D1 y D3 no sugieren o hacen obvio el compuesto de fórmula (IIc) ni la composición de la reivindicación 2.

Reivindicación 8:

El compuesto de formula (IIIa) de la reivindicación 8 requiere la presencia de un núcleo de piridona bicíclico fusionado. Ni D1 ni D3 divulgan o sugieren un compuesto que tiene un grupo sulfonamida cíclico, o sugieren modificar los compuestos divulgados para incluir un núcleo de piridona bicíclico fusionado.

Por lo tanto, D1 y D3 no sugieren o hacen obvio el compuesto de fórmula (IIIa) de la reivindicación 8.

Así entonces, teniendo en cuenta que las características técnicas estructurales de la materia de invención reivindicada en el nuevo pliego reivindicatorio no son enseñadas ni sugeridas en los documentos D1 y D2 citados, es claro que a partir de dichos documentos no era posible para un técnico medio obtener de manera obvia y/o evidente la presente invención.

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 30, 16 y 18 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se proceda con la concesión de la presente solicitud.

Anexos

Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 55 reivindicaciones.

Señor Director,


Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. 39.779.654 de Usaquén

T.P.A. No. 70.819 de C.S.J.

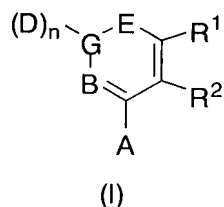
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.

Tel.: 7560770

Bogotá D.C. **27 MAYO 2013**

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la Fórmula estructural (I):



o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo, en donde:

R^1 y R^2 , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo arilo, arilo sustituido, heteroarilo o heteroarilo sustituido;

A es arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, $-\text{CN}$, $-\text{OR}^9$, $-\text{S}(\text{O})_c\text{R}^9$, $-\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, $-\text{NHR}^9$, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CO}_2\text{R}^9$, $-\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^9\text{CSNR}^{10}\text{R}^{11}$, o $-\text{NR}^9\text{C}(=\text{NH})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$;

B es $-\text{N}-$ o $-\text{C}(\text{R}^{12})-$;

R^{12} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$, $-\text{CN}$, $-\text{OR}^{13}$, $-\text{S}(\text{O})_d\text{R}^{13}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ o $-\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$;

G es $-\text{S}(\text{O})_2-$;

n es 0;

E es $-\text{NR}^{17}-$;

siempre que E sea $-\text{NR}^{17}-$ solamente cuando G forme un enlace único con E;

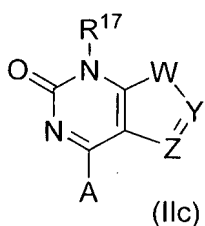
R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo,

heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido;

c, d, e y f son independientemente 0, 1 o 2; y

R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , y R^{16} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido; o alternativamente, R^9 y R^{10} , R^{10} y R^{11} , R^{13} y R^{14} , o R^{15} y R^{16} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

2. Una composición ingerible que comprende una cantidad realizadora del sabor dulce de un compuesto que tiene la Fórmula estructural (IIc):



en donde:

A es $-\text{CN}$, $-\text{OR}^9$, $-\text{NHR}^9$, $-\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^9\text{CSNR}^{10}\text{R}^{11}$ o $-\text{NR}^9\text{C}(=\text{NH})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$;

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido;

R^9 , R^{10} , o R^{11} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo

sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido; o alternativamente, R^9 y R^{10} , o R^{10} y R^{11} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido;

W es -S-;

Y es $-C(R^{26})-$;

Z es $-C(R^{27})-$;

R^{26} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, halo, -CN, -NO₂, -OR³¹, -S(O)_hR³¹, -OCOR³¹, -NR³¹R³², -CONR³¹R³², -CO₂R³¹, -SO₂NR³¹R³², -NR³¹SO₂R³², -B(OR³¹)(OR³²), -P(O)(OR³¹)(OR³²) o -P(O)(R³¹)(OR³²);

R^{27} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, halo, -CN, -NO₂, -OR³³, -S(O)_iR³³, -OCOR³³, -NR³³R³⁴, -CONR³³R³⁴, -COR³³, -CO₂R³³, -SO₂NR³³R³⁴, -NR³³SO₂R³⁴, -B(OR³³)(OR³⁴), -P(O)(OR³³)(OR³⁴) o -P(O)(R³³)(OR³⁴) o alternativamente R^{24} y R^{26} , o R^{26} y R^{27} conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido;

h e i son independientemente 0 o 1;

R^{31} , R^{32} , R^{33} , y R^{34} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido; o alternativamente R^{31}

y R^{32} o R^{33} y R^{34} conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos Forman um anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido; y

la cantidad realzadora del sabor dulce no es una cantidad terapéuticamente efectiva.

3. La composición ingerible de la reivindicación 2, en donde

R^{27} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{33}$, $-\text{S}(\text{O})_i\text{R}^{33}$, $-\text{OCOR}^{33}$, $-\text{NR}^{33}\text{R}^{34}$, $-\text{CONR}^{33}\text{R}^{34}$ o $-\text{CO}_2\text{R}^{33}$; y

R^{26} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{31}$, $-\text{S}(\text{O})_h\text{R}^{31}$, $-\text{OCOR}^{31}$, $-\text{NR}^{31}\text{R}^{32}$, $-\text{CONR}^{31}\text{R}^{32}$ o $-\text{CO}_2\text{R}^{31}$.

4. La composición ingerible de la reivindicación 2, en donde

A es $-\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, $-\text{NHOR}^9$, $-\text{NOR}^9$, $-\text{OR}^9$, $-\text{NR}^9\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^9\text{CSNR}^{10}\text{R}^{11}$ o $-\text{NR}^9\text{C}(=\text{NH})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{S}(\text{O})_c\text{R}^9$, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CO}_2\text{R}^9$ o $-\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$; y

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido.

5. La composición ingerible de la reivindicación 2, en donde

A es $-\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, $-\text{NHOR}^9$, $-\text{OR}^9$, $-\text{NR}^9\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{NR}^9\text{CSNR}^{10}\text{R}^{11}$ o $-\text{NR}^9\text{C}(=\text{NH})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(\text{O})_c\text{R}^9$, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CO}_2\text{R}^9$ o $-\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$;

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido;

R^{27} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR³³, -S(O)_iR³³, -OCOR³³, -NR³³R³⁴, -C(O)NR³³R³⁴ o -CO₂R³³; y

R^{26} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR³¹, -S(O)_hR³¹, -OC(O)R³¹, -NR³¹R³², -C(O)NR³¹R³² o -CO₂R³¹, o alternativamente R^{26} y R^{27} conjuntamente con el(os) átomo(s) al(os) cual(es) ellos están unidos forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

6. La composición ingerible de la reivindicación 5, en donde

A es -NH₂;

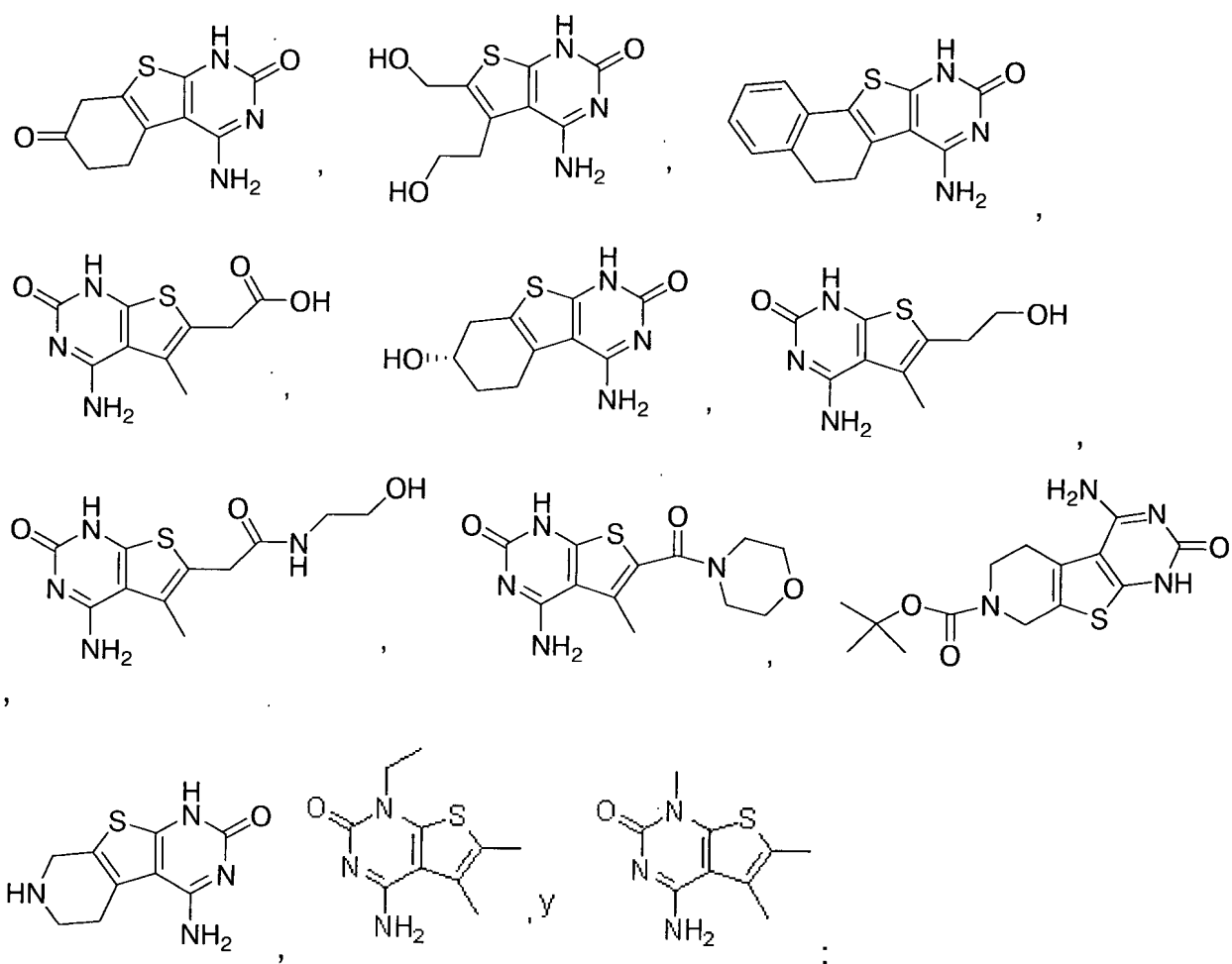
R^{17} es hidrógeno, metilo, etilo, propilo, *iso*-propilo, *n*-butilo, *iso*-butilo, *sec*-butilo, *t*-butilo, fenilo o bencilo;

R^{26} y R^{27} son independientemente hidrógeno, alcanilo, alcanilo sustituido, alcoxi, ácido carboxílico, amida de ácido carboxílico, o éster de ácido carboxílico;

o alternativamente, R^{26} y R^{27} conjuntamente con el(os) átomo(s) al(os) cual(es) ellos están unidos forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

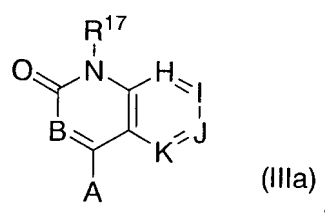
7. La composición ingerible de la reivindicación 2, que tiene la Fórmula estructural seleccionada del grupo integrado por:





o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo.

8. Un compuesto que tiene la Fórmula estructural (IIIa):



en donde,

A es arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -OR⁹, -S(O)₆R⁹, -NHOR⁹,

-NR⁹COR¹⁰, -NR⁹R¹⁰, -CONR⁹R¹⁰, -CO₂R⁹, -NR⁹CO₂R¹⁰, -NR⁹CONR¹⁰R¹¹,
-NR⁹CSNR¹⁰R¹¹, o -NR⁹C(=NH)NR¹⁰R¹¹;

B es -N- o -C(R¹²)-;

R¹² es hidrogeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -NR¹³R¹⁴, -CN, -OR¹³, -S(O)_dR¹³, -CO₂R¹³ o -CONR¹³R¹⁴;

H es -C(R³⁵)- o -N-;

I es -C(R³⁶) o -N-;

J es -C(R³⁷)- o -N-;

K es -C(R³⁸)- o -N-;

R³⁵ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR³⁹, -S(O)_jR³⁹, -OCOR³⁹, -NR³⁹R⁴⁰, -CONR³⁹R⁴⁰, -CO₂R³⁹, -SO₂NR³⁹R⁴⁰, -NR³⁹SO₂R⁴⁰, -B(OR³⁹)(OR⁴⁰),
-P(O)(OR³⁹)(OR⁴⁰) o -P(O)(R³⁹)(OR⁴⁰);

R³⁶ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴¹, -S(O)_kR⁴¹, -OCOR⁴¹, -NR⁴¹R⁴², -CONR⁴¹R⁴², -CO₂R⁴¹, -SO₂NR⁴¹R⁴², -NR⁴¹SO₂R⁴², -B(OR⁴¹)(OR⁴²),
-P(O)(OR⁴¹)(OR⁴²) o -P(O)(R⁴¹)(OR⁴²);

R³⁷ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴³, -S(O)_lR⁴³, -OCOR⁴³, -NR⁴³R⁴⁴,

-CONR⁴³R⁴⁴, -CO₂R⁴³, -SO₂NR⁴³R⁴⁴, -NR⁴³SO₂R⁴⁴, -B(OR⁴³)(OR⁴⁴),
 -P(O)(OR⁴³)(OR⁴⁴) o -P(O)(R⁴³)(OR⁴⁴);

R³⁸ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴⁵, -S(O)_mR⁴⁵, -OCOR⁴⁵, -NR⁴⁵R⁴⁶, -CONR⁴⁵R⁴⁶, -COR⁴⁵, -CO₂R⁴⁵, -SO₂NR⁴⁵R⁴⁶, -NR⁴⁵SO₂R⁴⁶, -B(OR⁴⁵)(OR⁴⁶), -P(O)(OR⁴⁵)(OR⁴⁶) o -P(O)(R⁴⁵)(OR⁴⁶); o alternativamente R³⁶ y R³⁷ o R³⁷ y R³⁸ tomados conjuntamente con el átomo al cual ellos están unidos, forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, cicloheteroalquilo, o cicloheteroalquilo sustituido;

j, k, l y m son independientemente 0, 1 o 2; y

R³⁹, R⁴⁰, R⁴¹, R⁴², R⁴³, R⁴⁴, R⁴⁵, y R⁴⁶ son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido o alternativamente R³⁹ y R⁴⁰, R⁴¹ y R⁴², R⁴³ y R⁴⁴ o R⁴⁵ y R⁴⁶ conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido;

con la condición de que a lo sumo, dos de H, I, J y K sean -N-.

9. El compuesto de la reivindicación 8, en donde R¹⁷ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo o arilalquilo sustituido.

10. El compuesto de la reivindicación 8, en donde

H es -C(R³⁵)-;

I es -C(R³⁶);

J es $-\text{C}(\text{R}^{37})-$; y

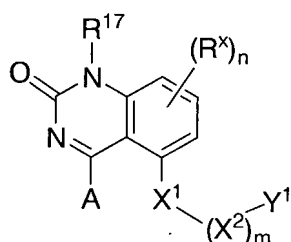
K es $-\text{C}(\text{R}^{38})-$.

11. El compuesto de la reivindicación 8, en donde

A es CN , OR^9 , NO_2 , $\text{S}(\text{O})_c\text{R}^9$, NHOR^9 , $\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, NR^9R^{10} , $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, CO_2R^9 o $\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$; y

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido.

12. El compuesto de la reivindicación 8, que tiene la Fórmula Estructural (IIIa1)



(IIIa1)

en donde,

A es arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, $-\text{CN}$, $-\text{OR}^9$, $-\text{S}(\text{O})_c\text{R}^9$, $-\text{NOR}^9$, $-\text{NHOR}^9$, $-\text{NR}^9\text{COR}^{10}$, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{CO}_2\text{R}^9$ or $-\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^{10}$;

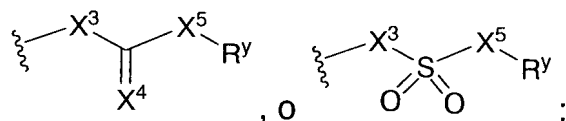
R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido;

X^1 es $-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-$, $-\text{NR}^9-$, $-\text{S}-$, $-\text{S}(\text{O})-$, o $-\text{S}(\text{O})_2-$;

X^2 es alquileno, alquileno sustituido, heteroalquileno, o heteroalquileno sustituido;

m es 0 o 1;

Y¹ es cicloheteroalquilo, cicloheteroalquilo sustituido, o



X³ y X⁵ son independientemente una unión covalente, -O- o -NR⁹-;

X⁴ es O, NR⁹, N-OR⁹, o S;

R^x es halo, -NO₂, -CN, -OH, -NH₂, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido;

n es 0, 1, 2, o 3;

R^y ES hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilosustituido, heteroalquilo, heteroalquilosustituido, heteroarilo, heteroarilosustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilosustituido, -NR⁹R¹⁰;

c es 0, 1, o 2; y

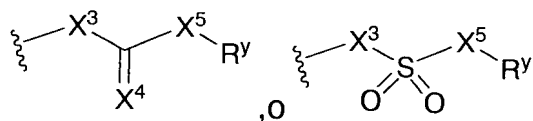
cada R⁹ y R¹⁰ es independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido;

con la condición de que cuando X¹ es -O- o -S-, y m es cero; entonces X³ no es -O-.

13. El compuesto de la reivindicación 12, en donde

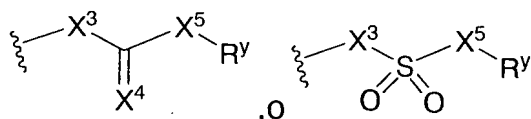
X¹ es -CH₂-; y

Y¹ es

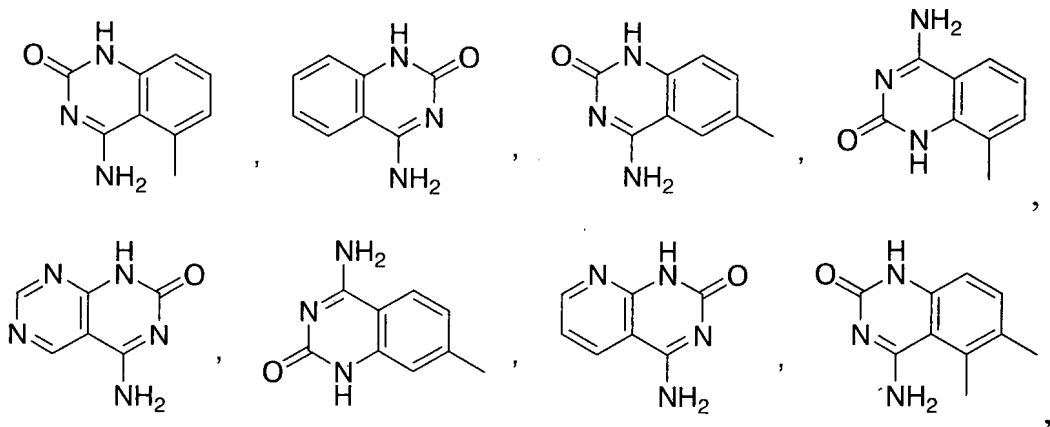


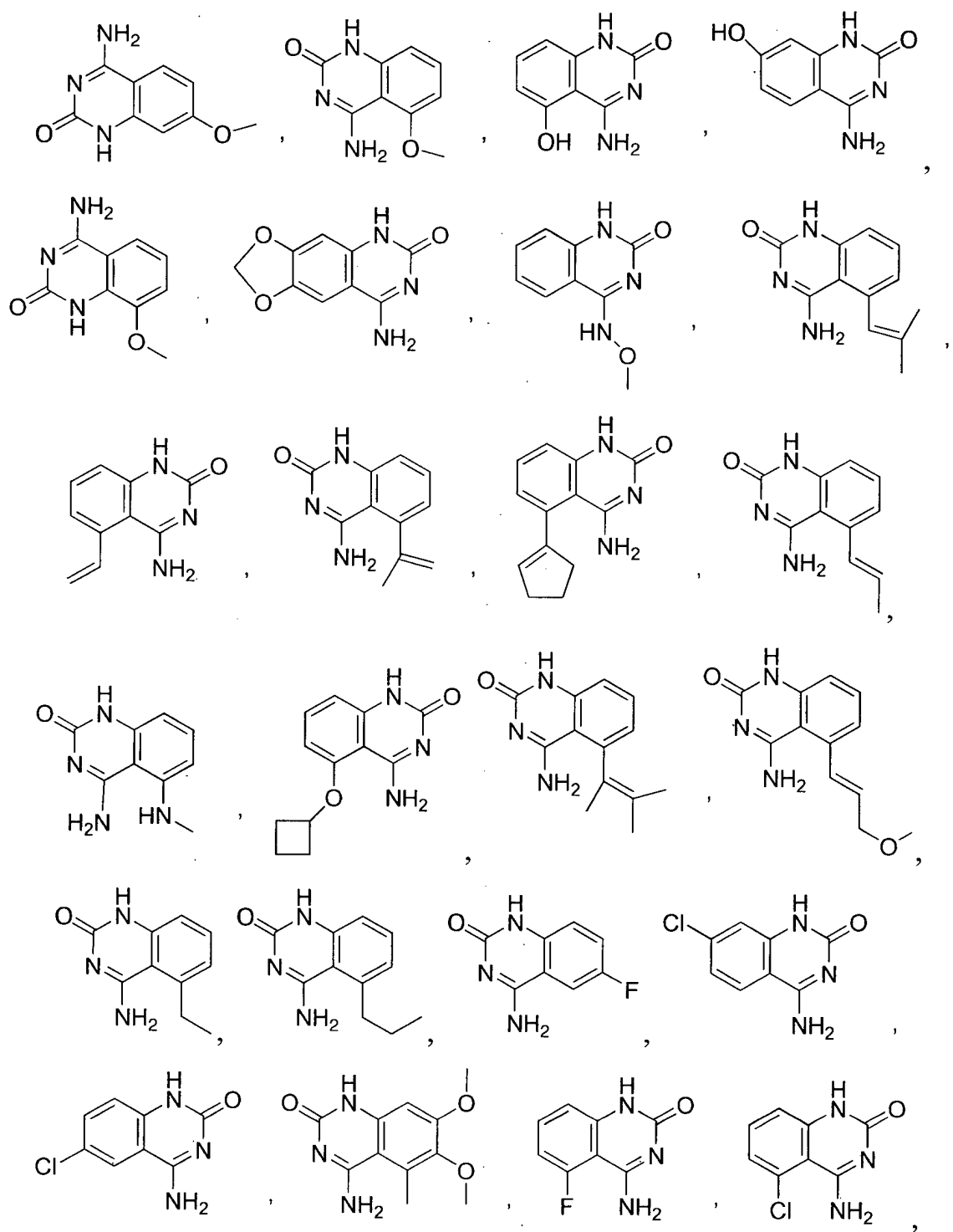
14. El compuesto de la reivindicación 12, en donde
 X^1 es $-O-$, $-NR^9-$, o $-S-$;
 m es 0 o 1, y
 Y^1 es cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

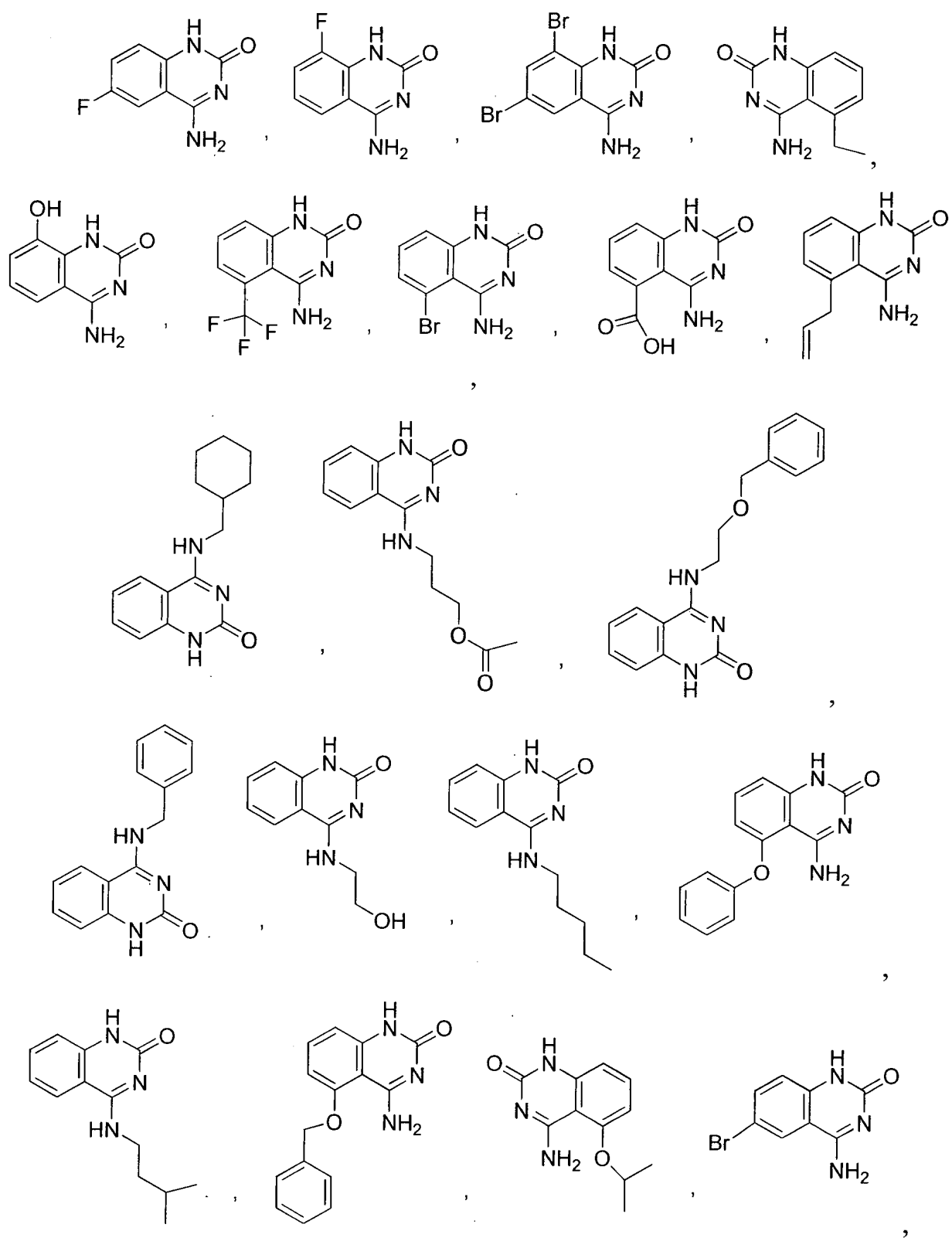
15. El compuesto de la reivindicación 12, en donde
 X^1 es $-O-$, $-NR^9-$, o $-S-$;
 m es 1, y
 Y^1 es

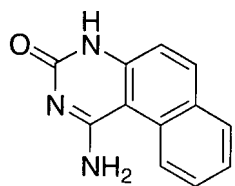


16. El compuesto de la reivindicación 10, que tiene la Fórmula estructural seleccionada del grupo integrado por

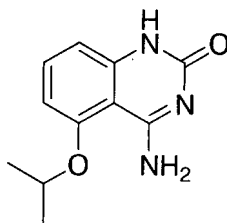




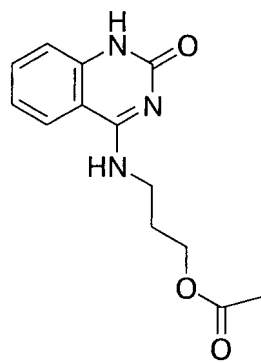




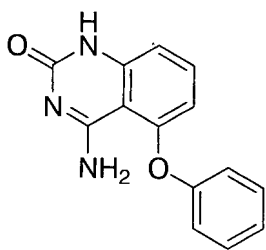
,



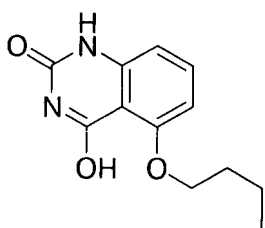
,



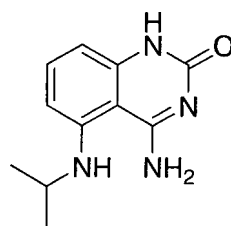
,



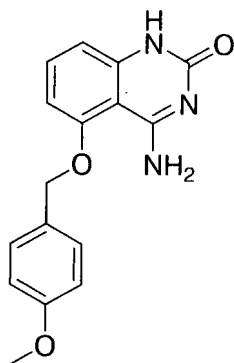
,



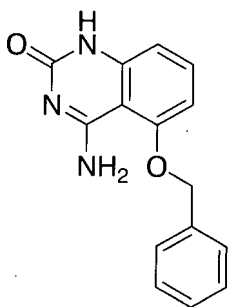
,



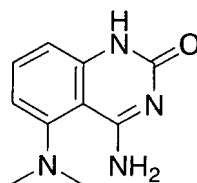
,



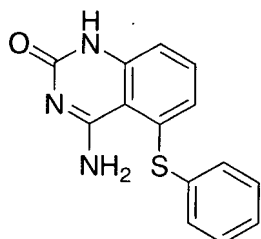
,



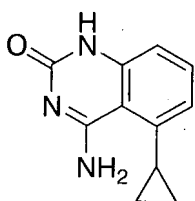
,



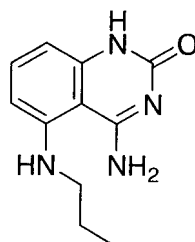
,



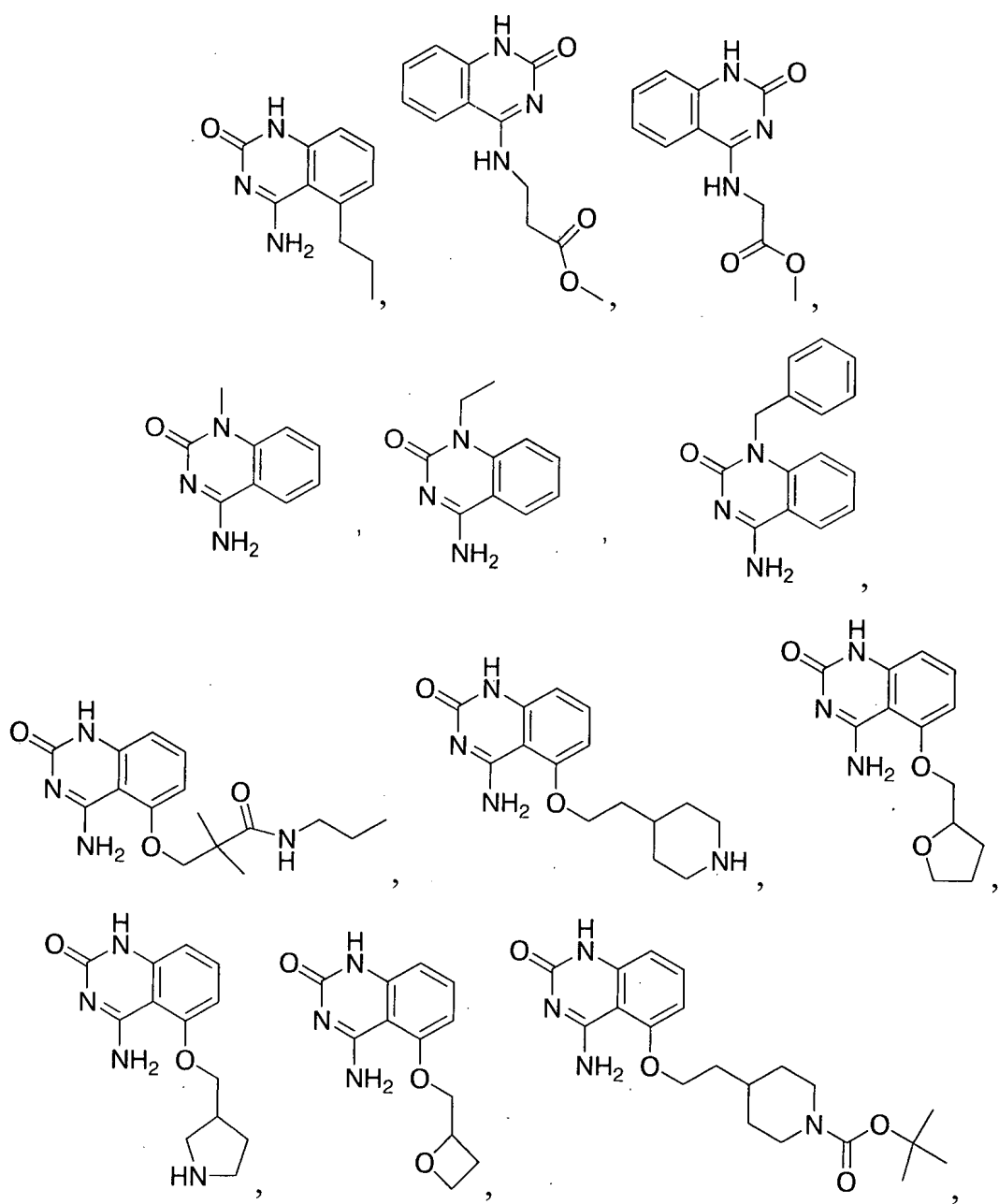
,

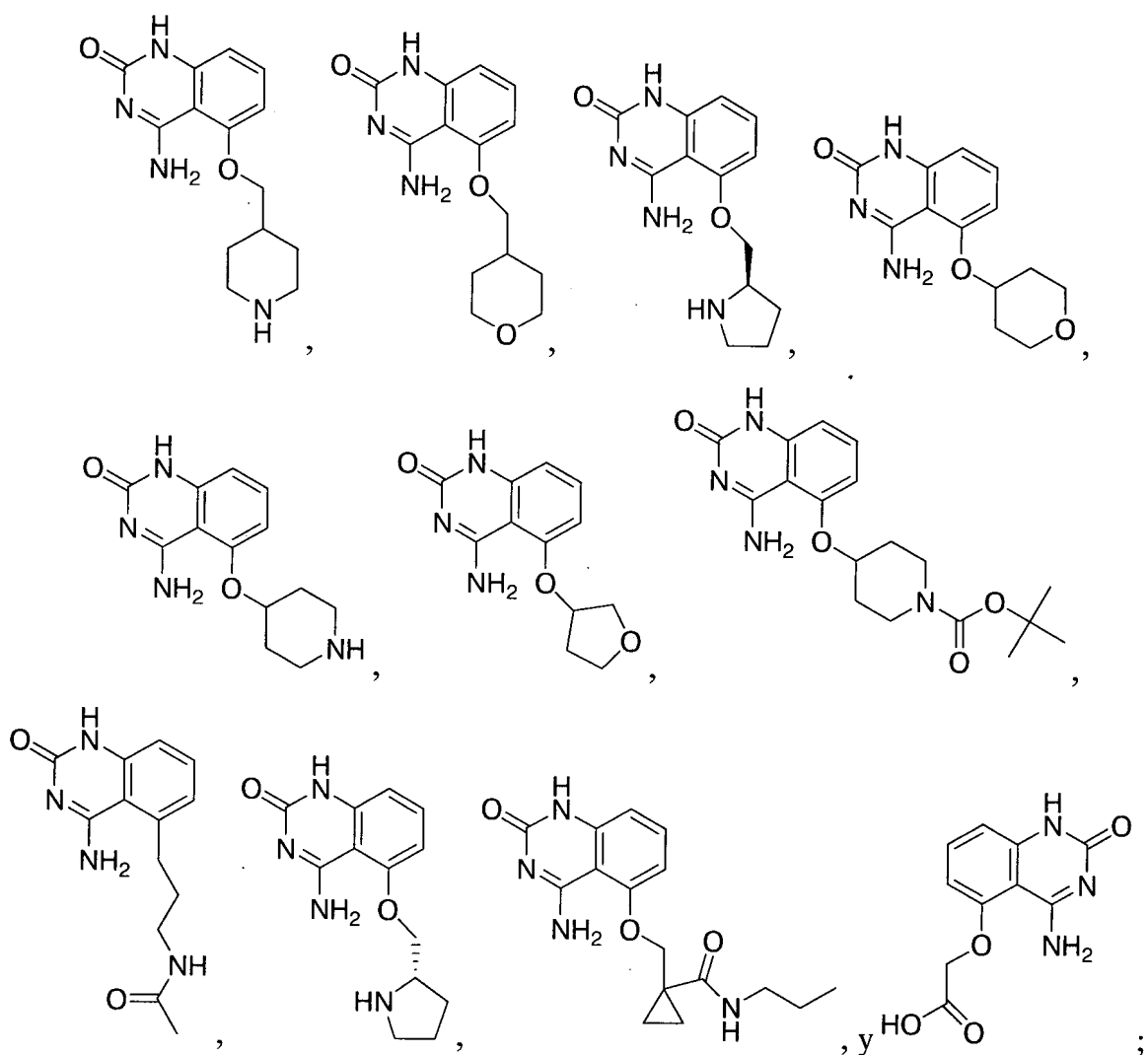


,



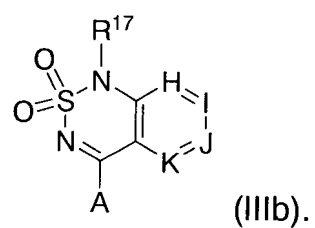
,





o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo.

17. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene la Fórmula estructural (IIIb):



en donde,

H es-C(R³⁵)- o -N-;

I es-C(R³⁶) o -N-;

J es-C(R³⁷)- o -N-;

K es-C(R³⁸)- o -N-;

R³⁵ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR³⁹, -S(O)_jR³⁹, -OCOR³⁹, -NR³⁹R⁴⁰, -CONR³⁹R⁴⁰, -CO₂R³⁹, -SO₂NR³⁹R⁴⁰, -NR³⁹SO₂R⁴⁰;

R³⁶ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴¹, -S(O)_kR⁴¹, -OCOR⁴¹, -NR⁴¹R⁴², -CONR⁴¹R⁴², -CO₂R⁴¹, -SO₂NR⁴¹R⁴², -NR⁴¹SO₂R⁴²;

R³⁷ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴³, -S(O)_lR⁴³, -OCOR⁴³, -NR⁴³R⁴⁴, -CONR⁴³R⁴⁴, -CO₂R⁴³, -SO₂NR⁴³R⁴⁴, -NR⁴³SO₂R⁴⁴;

R³⁸ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, -CN, -NO₂, -OR⁴⁵, -S(O)_mR⁴⁵, -OCOR⁴⁵, -NR⁴⁵R⁴⁶, -CONR⁴⁵R⁴⁶, -COR⁴⁵, -CO₂R⁴⁵, -SO₂NR⁴⁵R⁴⁶, -NR⁴⁵SO₂R⁴⁶.

j, k, l y m son independientemente 0, 1 o 2; y

R³⁹, R⁴⁰, R⁴¹, R⁴², R⁴³, R⁴⁴, R⁴⁵, y R⁴⁶ son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido,

acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido o alternativamente R^{39} y R^{40} , R^{41} y R^{42} , R^{43} y R^{44} o R^{45} y R^{46} conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido;

con la condición de que a lo sumo, dos de H, I, J y K sean -N-.

18. El compuesto de la reivindicación 17, en donde A es -CN, $-OR^9$, $-S(O)_cR^9$, $-NR^9COR^{10}$, $-NHOR^9$, $-NR^9R^{10}$, $-CONR^9R^{10}$, $-CO_2R^9$, $-NR^9CO_2R^{10}$, $-NR^9CONR^{10}R^{11}$, $-NR^9CSNR^{10}R^{11}$, o $-NR^9C(=NH)NR^{10}R^{11}$.

19. El compuesto de la reivindicación 17, en donde R^{17} es hidrógeno, alquilo, o alquilo sustituido.

20. El compuesto de la reivindicación 17, en donde

H es $-C(R^{35})-$;

I es $-C(R^{36})-$;

J es $-C(R^{37})-$; y

K es $-C(R^{38})-$.

21. El compuesto de la reivindicación 17, en donde

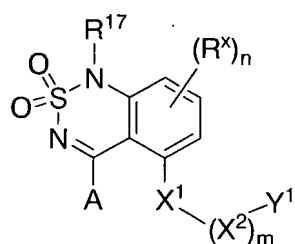
A es $-NH_2$,

R^{17} es hidrógeno, metilo, etilo o bencilo; y

R^{35} , R^{36} , R^{37} y R^{38} son independientemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, -CN, alcanilo, alcanilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, cicloalcanilo, cicloalcanilo sustituido, cicloalquenilo, cicloalquenilo sustituido, heteroalcanilo, heteroalcanilo sustituido,

cicloheteroalquilo, cicloheteroalquilo sustituido, -O-alcanilo, -O-(alcanilo sustituido), -O-alquenilo, -O-(alquenilo sustituido), -NH-alcanilo, -NH-(alcanilo sustituido), -NH-alquenilo, -NH-(alquenilo sustituido), -S-alcanilo, -S-(alcanilo sustituido), -S-alquenilo, o -S-(alquenilo sustituido).

22. El compuesto de la reivindicación 17, que tiene la Fórmula estructural (IIIb1):



(IIIb1)

en donde,

A es arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -OR⁹, -S(O)_cR⁹, -NOR⁹, -NHOR⁹, -NR⁹COR¹⁰, -NR⁹R¹⁰, -CONR⁹R¹⁰, -CO₂R⁹ o -NR⁹CO₂R¹⁰;

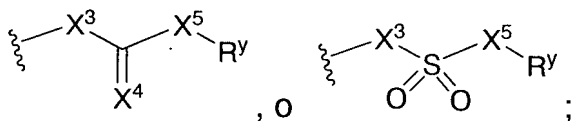
R¹⁷ es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido;

X¹ es -CH₂-, -O-, -NR⁹-, -S-, -S(O)-, o -S(O)₂-;

X² es alquileno, alquileno sustituido, heteroalquileno, o heteroalquileno sustituido;

m es 0 o 1;

Y¹ es heteroarilo, heteroarilo sustituido, cicloheteroalquilo, cicloheteroalquilo sustituido, o



X^3 y X^5 son independientemente un enlace covalente, $-\text{O}-$ o $-\text{NR}^9-$;

X^4 es O , NR^9 , N-OR^9 , o S ;

R^x es halo, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{NH}_2$, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido;

n es 0, 1, 2, o 3;

R^y es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, $-\text{NR}^9\text{R}^{10}$; y

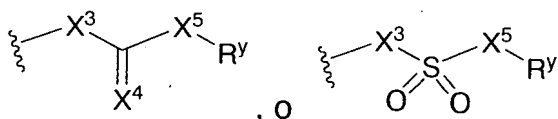
cada R^9 y R^{10} es independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido;

con la condición de que cuando X^1 sea $-\text{O}-$ o $-\text{S}-$, y m sea cero; entonces X^3 no sea $-\text{O}-$.

23. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

X^1 es $-\text{CH}_2-$; e

Y^1 es



24. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

X^1 es $-O-$, $-NR^9-$, o $-S-$;

m es 0 o 1, e

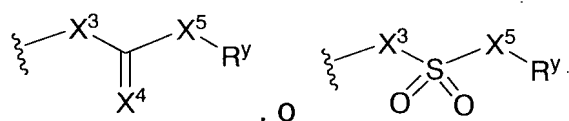
Y^1 es cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

25. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

X^1 es $-O-$, $-NR^9-$, o $-S-$;

m es 1, e

Y^1 es



26. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

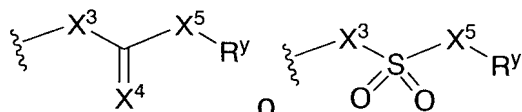
X^2 es metileno, etileno, propileno, *iso*-propileno, butileno, *iso*-butileno, *sec*-butileno, pentileno, hexileno, heptileno, dimetiletileno, metilciclopropileno, ciclopropilmetileno, etenileno, propenileno, o butenileno.

27. El compuesto de la reivindicación 19, en donde Y^1 es piperidinilo, piperidinilo sustituido, tetrahydrofuranilo, tetrahydrofuranilo sustituido, tetrahydropiranilo, tetrahydropiranilo sustituido, dihydrofuranilo, dihydrofuranilo sustituido, pirrolidinilo, pirrolidinilo sustituido, oxetanilo, oxetanilo sustituido, un anillo sacárido o su derivado, un anillo sacárido sustituido o su derivado.

28. El compuesto de la reivindicación 22, en donde Y^1 es piridinilo, piridinilo sustituido, pirrolilo, pirrolilo sustituido, furanilo, furanilo sustituido, pirazolilo, pirazolilo sustituido, isoxazolilo, isoxazolilo sustituido, oxazolilo, y oxazolilo sustituido.

29. El compuesto de la reivindicación 22, en donde el cicloheteroalcanilo sustituido o el cicloheteroalquenilo sustituido comprende uno o más sustituyentes seleccionados del grupo integrado por alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, -CN, -OR⁹, -NO₂, -S(O)_cR⁹, -NOR⁹, -NHOR⁹, -NR⁹COR¹⁰, -NR⁹R¹⁰, -CONR⁹R¹⁰, -CO₂R⁹, y -NR⁹CO₂R¹⁰.

30. El compuesto de la reivindicación 22, en donde Y es



31. El compuesto de la reivindicación 22, en donde -X³-C(X⁴)-X⁵- es -C(O)-, -C(O)-NH-, -NH-C(O)-, -NH-C(O)-NH-, -C(O)-O-, -O-C(O)-, -O-C(O)-O-, -NH-C(O)-O-, -O-C(O)-NH-, -C(NH)-, -C(NH)-NH-, -NH-C(NH)-, -NH-C(NH)-NH-, -C(NH)-O-, -O-C(NH)-, -O-C(NH)-O-, -NH-C(NH)-O-, -O-C(NH)-NH-, -C(N-OH)-, o -C(S)-.

32. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

A es -NR⁹R¹⁰;

R¹⁷ es hidrógeno; e

Y¹ es piperidinilo, piperidinilo sustituido, tetrahydrofuranilo, tetrahydrofuranilo sustituido, tetrahydropyranilo, tetrahydropyranilo sustituido, dihydrofuranilo, dihydrofuranilo sustituido, pyrrolidinilo, pyrrolidinilo sustituido, oxetanilo, oxetanilo sustituido, un anillo monosacárido, un anillo monosacárido

sustituido, piridinilo, piridinilo sustituido, pirrolilo, pirrolilo sustituido, furanilo, furanilo sustituido, pirazolilo, pirazolilo sustituido, isoxazolilo, isoxazolilo sustituido, oxazolilo, u oxazolilo sustituido.

33. El compuesto de la reivindicación 22, en donde

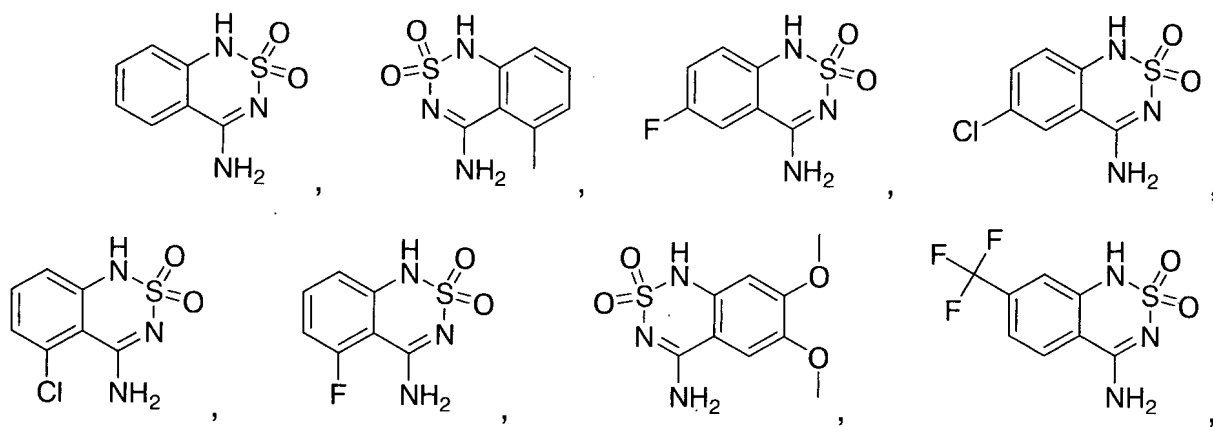
A es $-NR^9R^{10}$;

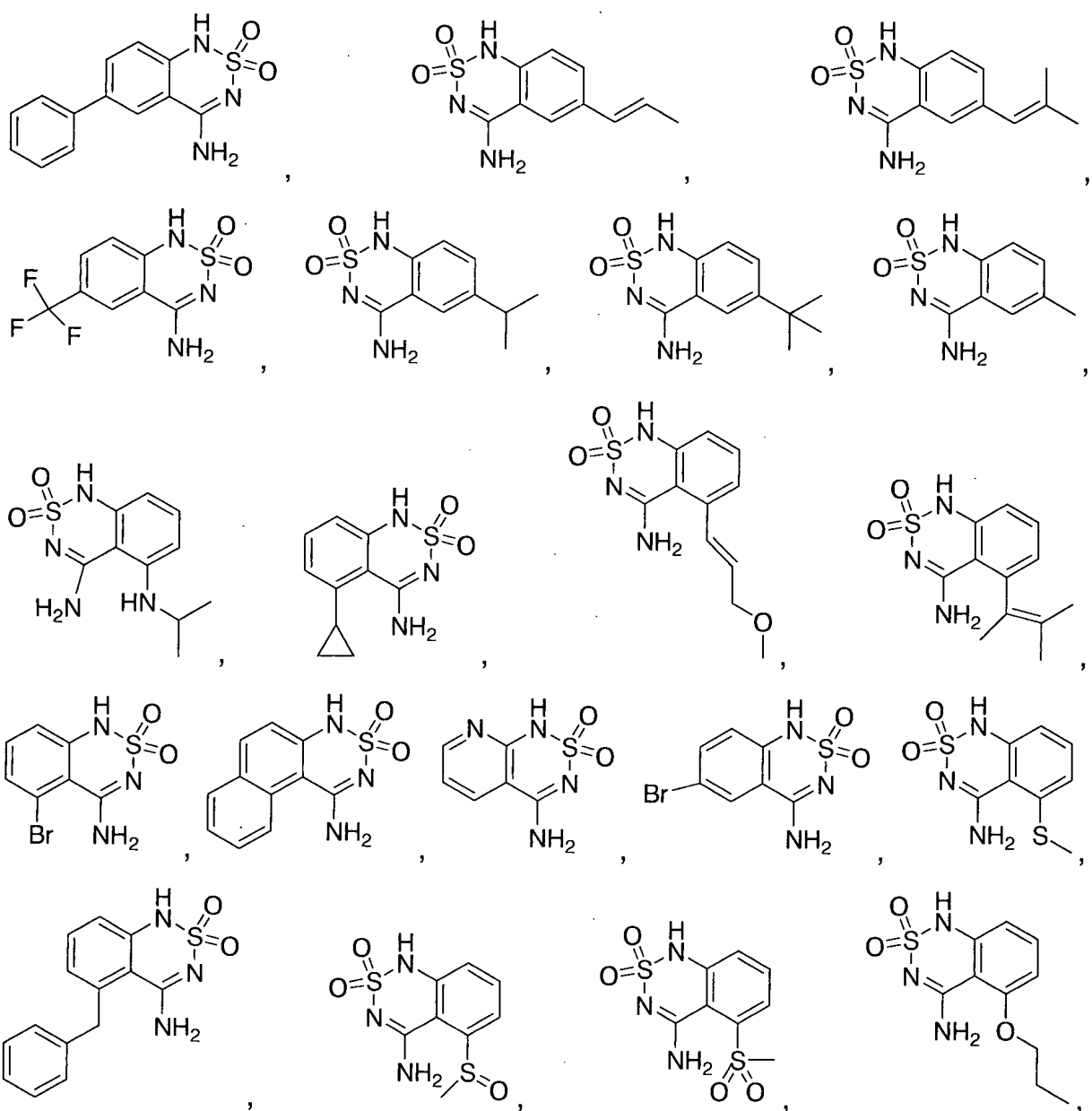
R^{17} es hidrógeno;

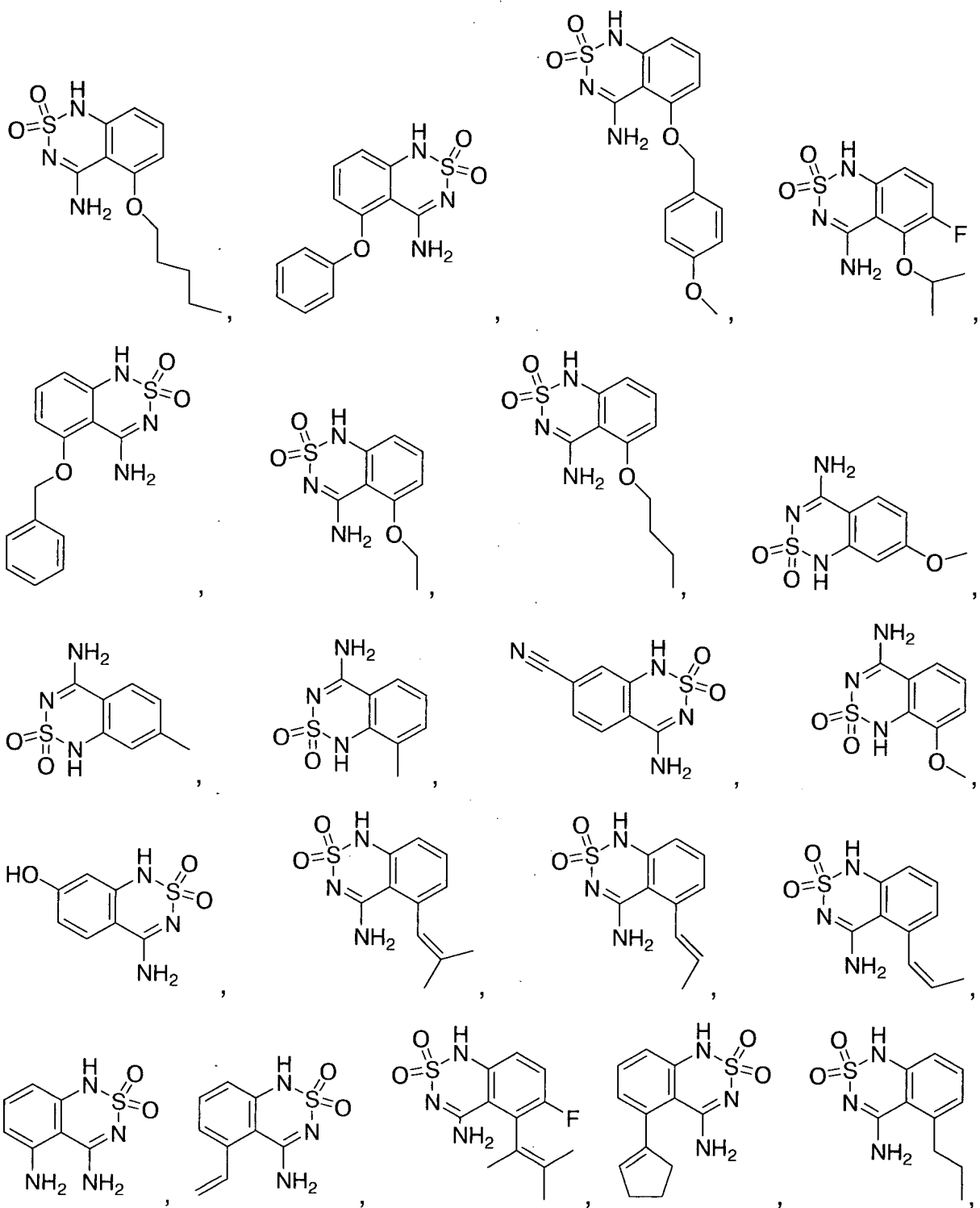
Y^1 es $-X^3-C(X^4)-X^5-$; y

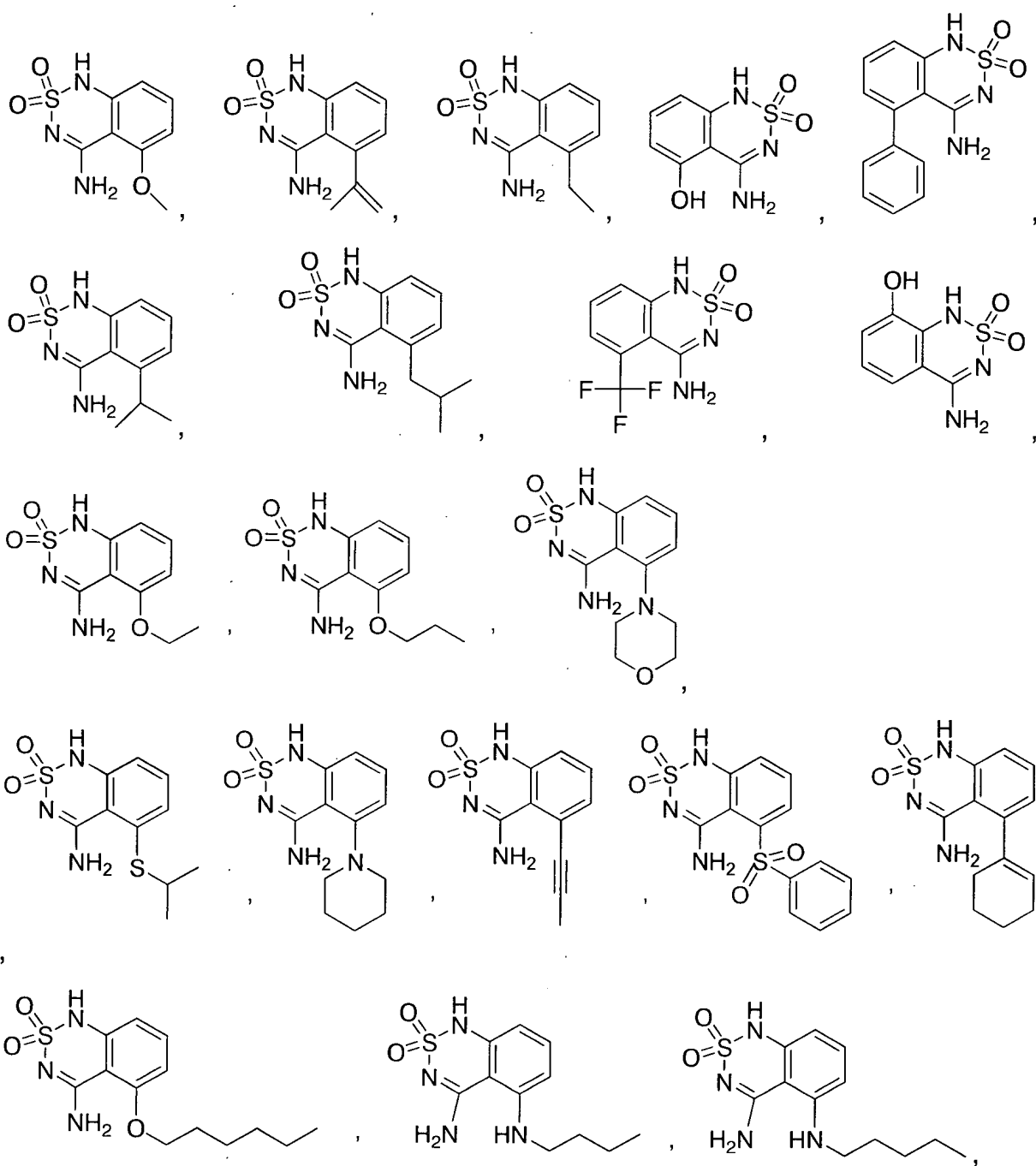
$-X^3-C(X^4)-X^5-$ es $-C(O)-$, $-C(O)-NH-$, $-NH-C(O)-$, $-NH-C(O)-NH-$, $-C(O)-O-$, $-O-C(O)-$, $-O-C(O)-O-$, $-NH-C(O)-O-$, $-O-C(O)-NH-$, $-C(NH)-$, $-C(NH)-NH-$, $-NH-C(NH)-$, $-NH-C(NH)-NH-$, $-C(NH)-O-$, $-O-C(NH)-$, $-O-C(NH)-O-$, $-NH-C(NH)-O-$, $-O-C(NH)-NH-$, $-S(O)_2-$, $-NH-S(O)_2-$, $-S(O)_2-NH-$, $-O-S(O)_2-$, $-S(O)_2-O-$, $-C(N-OH)-$, o $-C(S)-$.

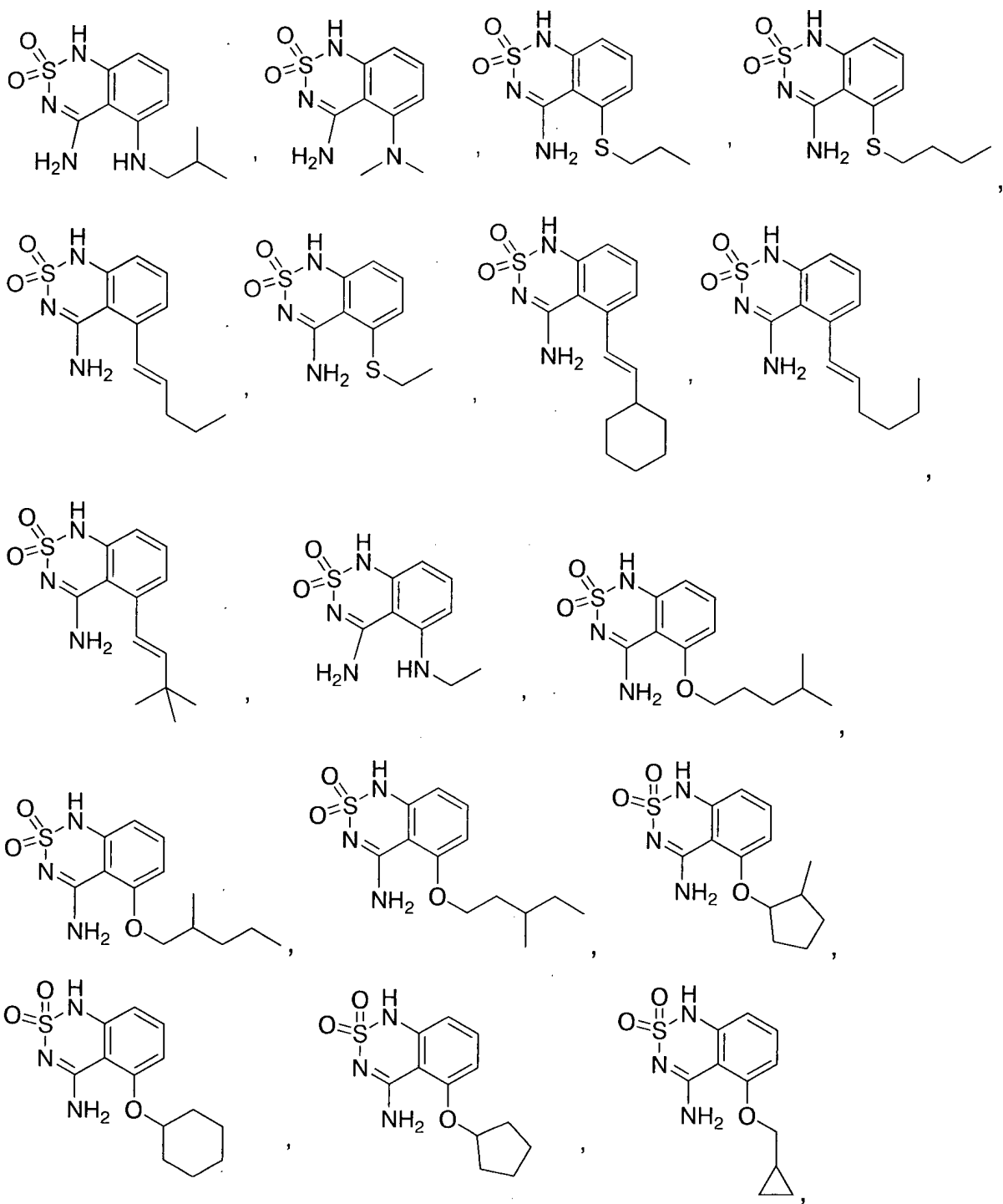
34. El compuesto de la reivindicación 17, que tiene la Fórmula estructural seleccionada del grupo integrado por

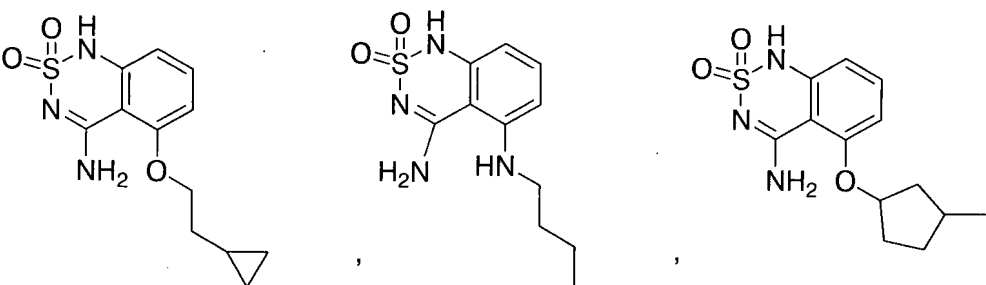
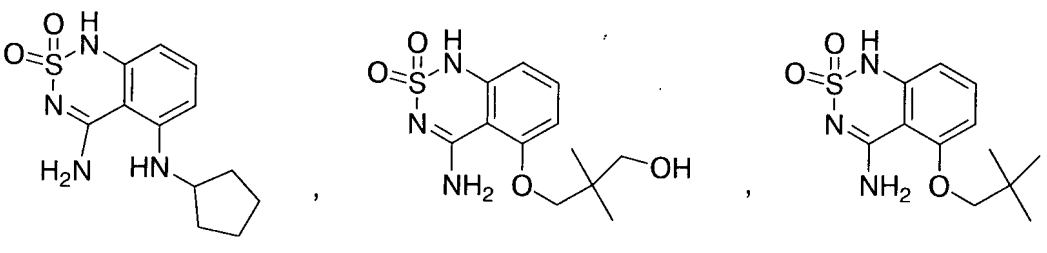
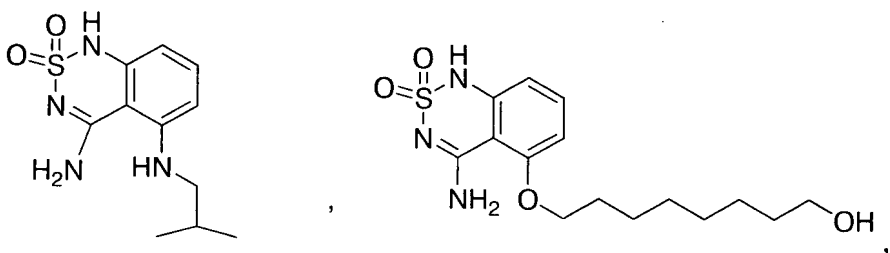
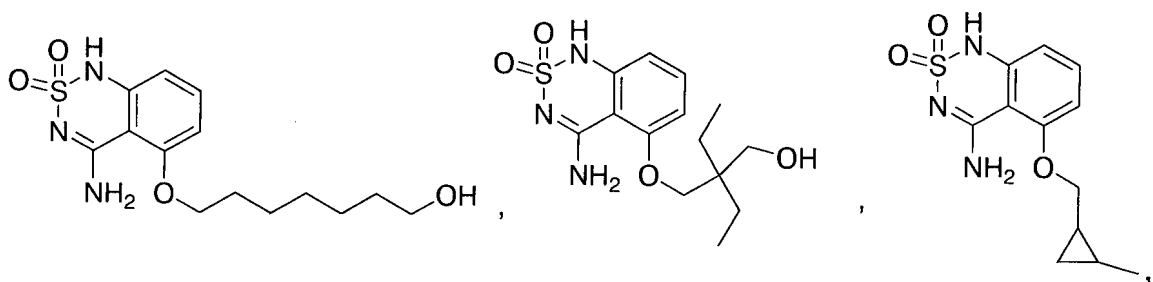
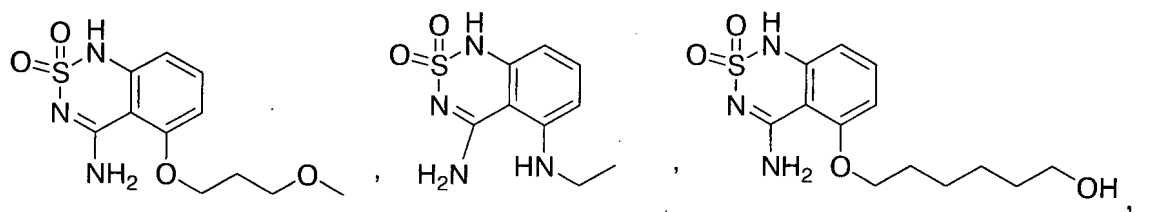


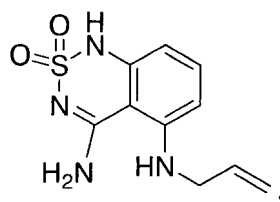
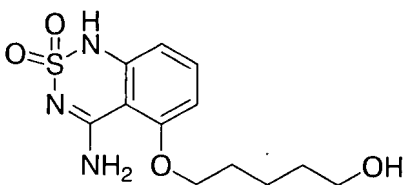
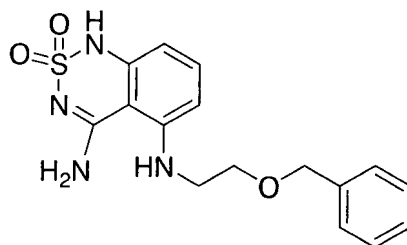
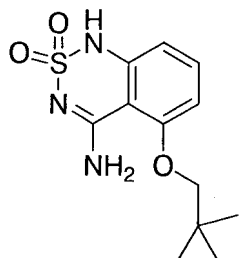
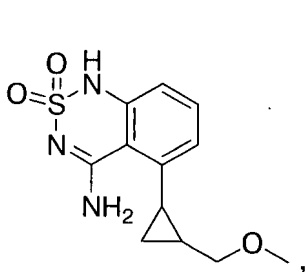
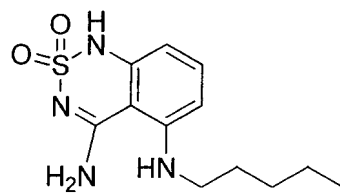
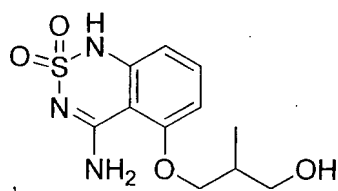
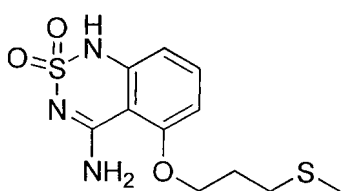
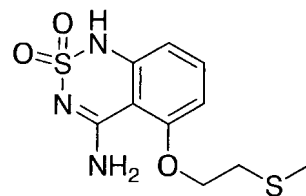
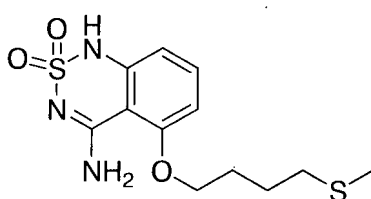
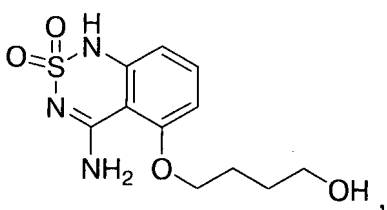
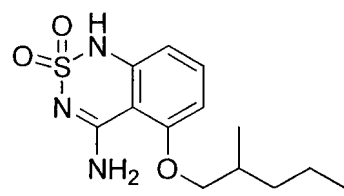
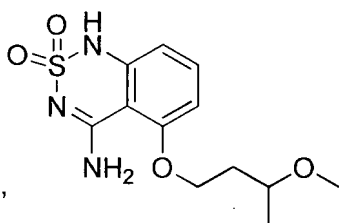
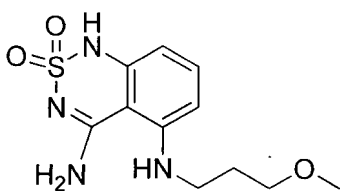
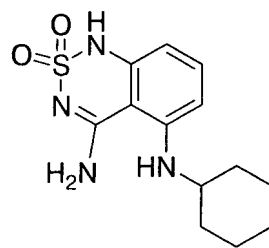
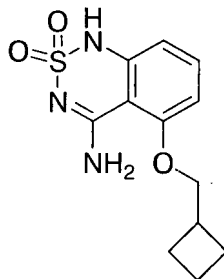
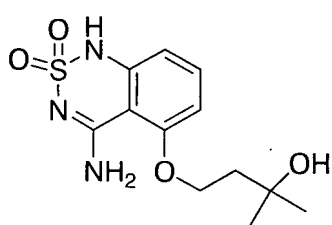


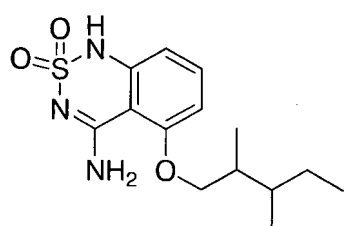




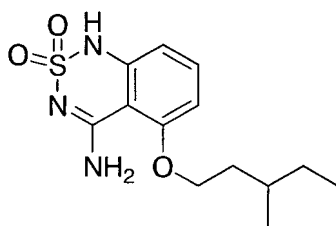




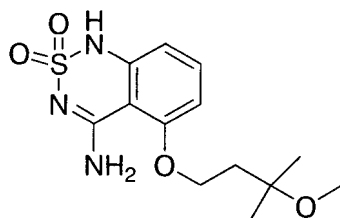




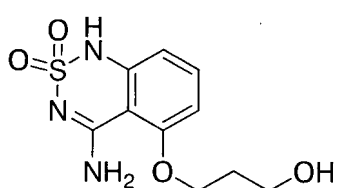
,



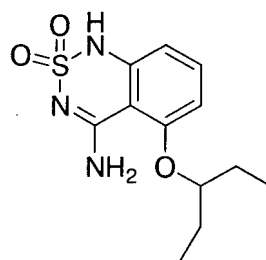
,



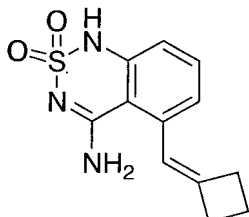
,



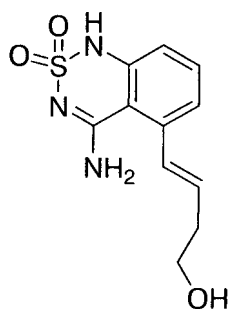
,



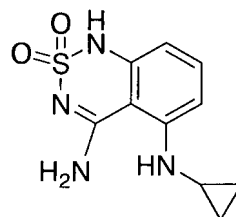
,



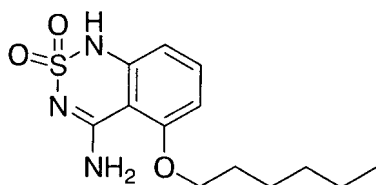
,



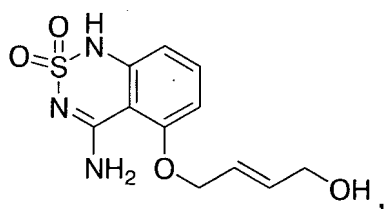
,



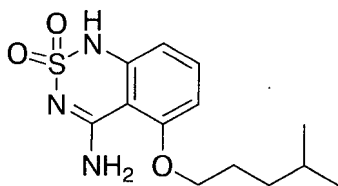
,



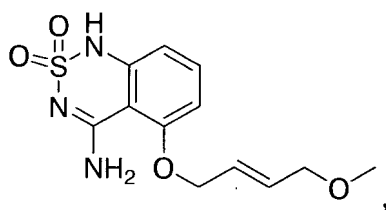
,



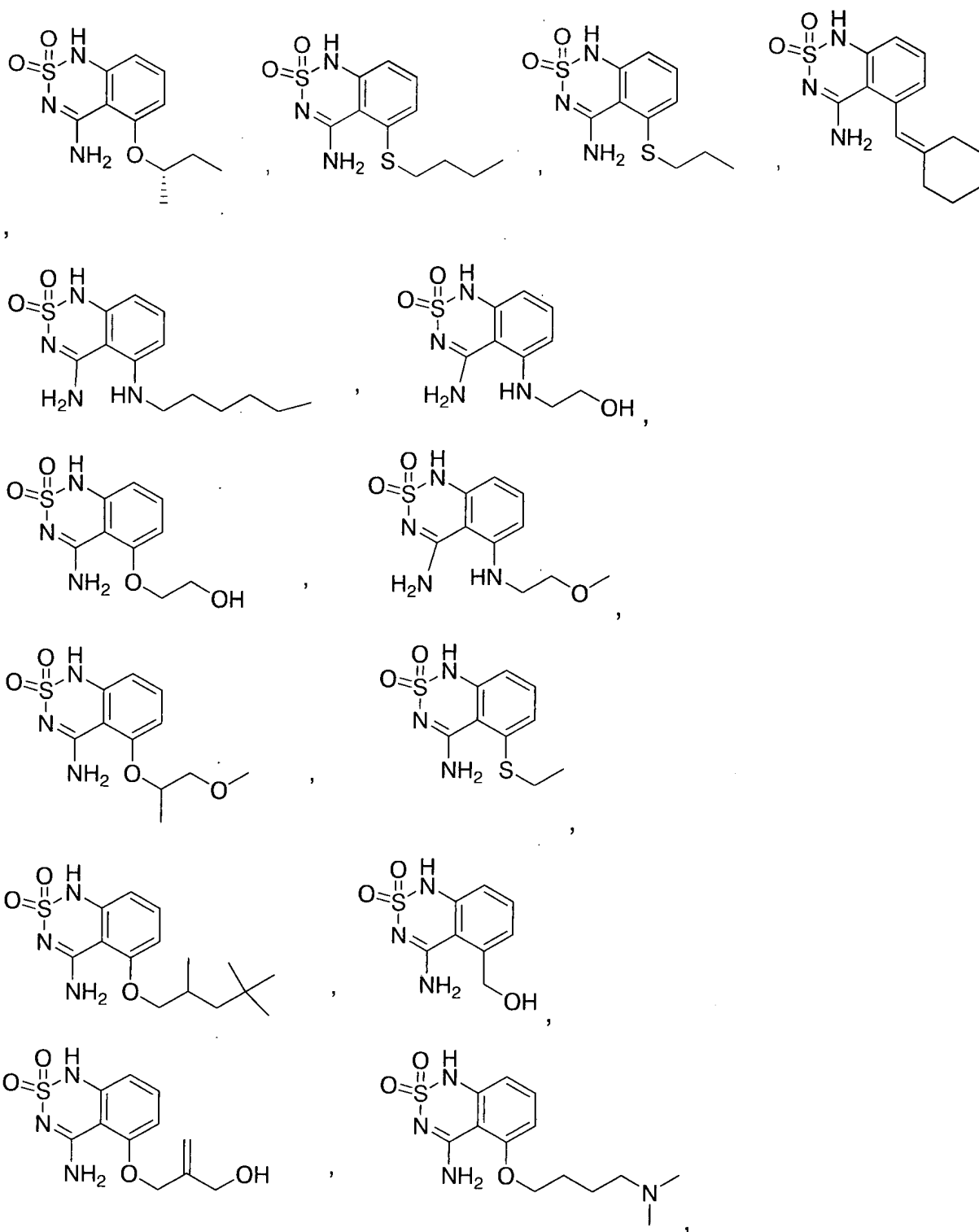
,

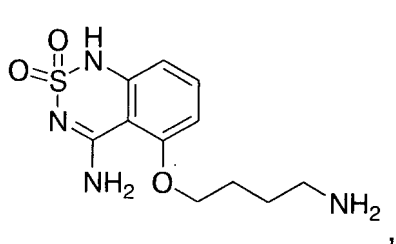
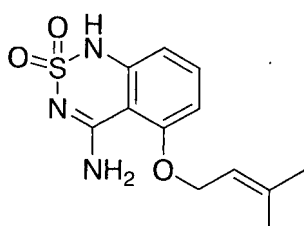
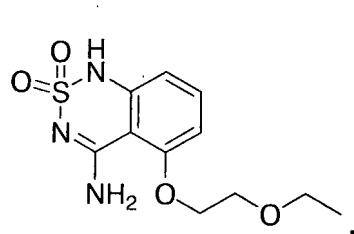
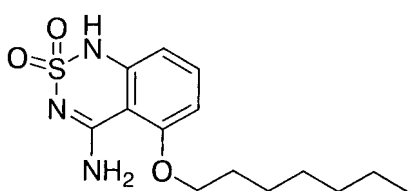
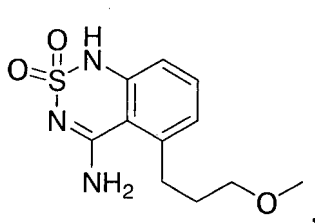
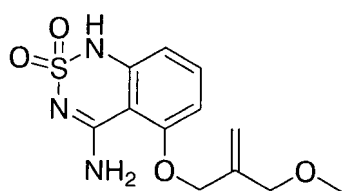
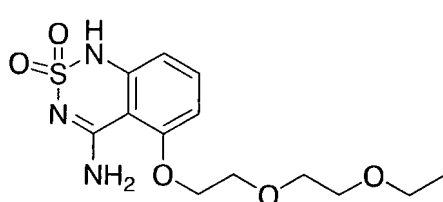
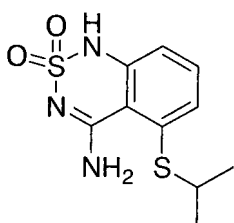
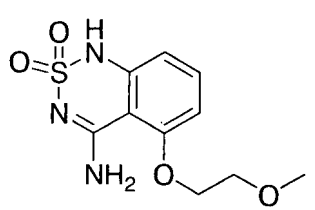
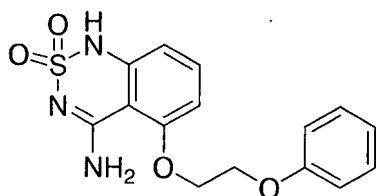
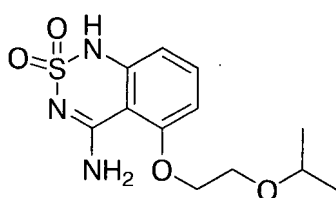
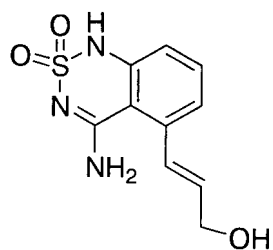


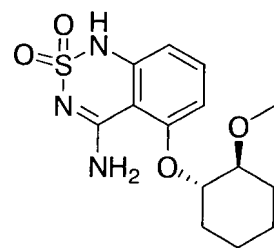
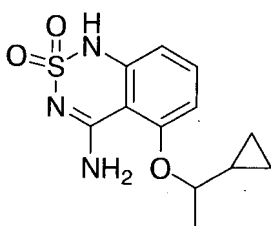
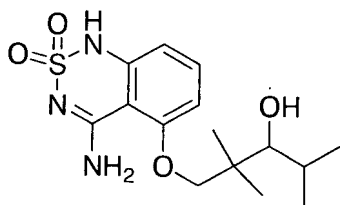
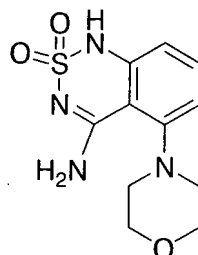
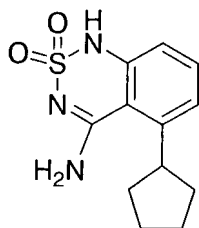
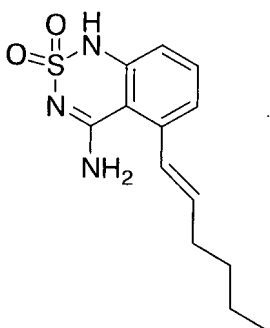
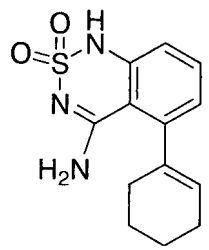
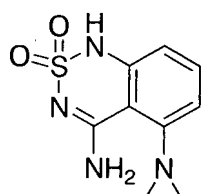
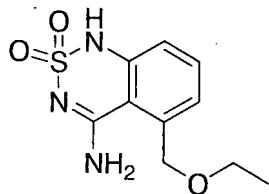
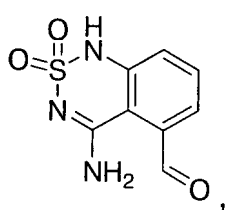
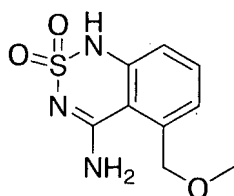
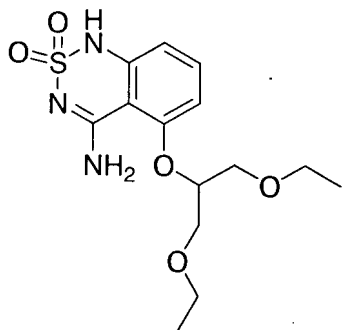
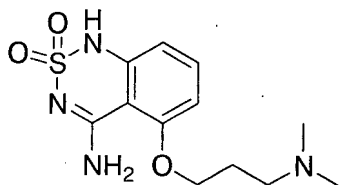
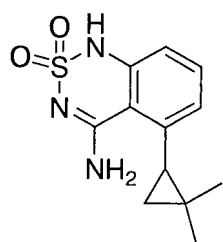
,

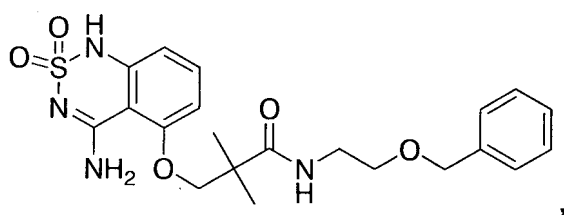
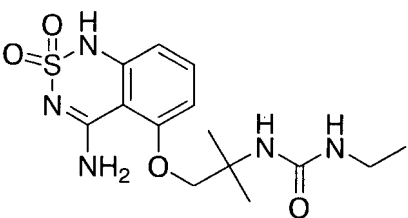
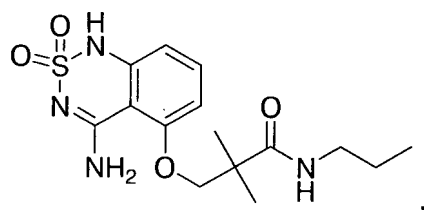
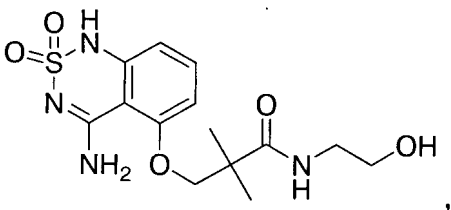
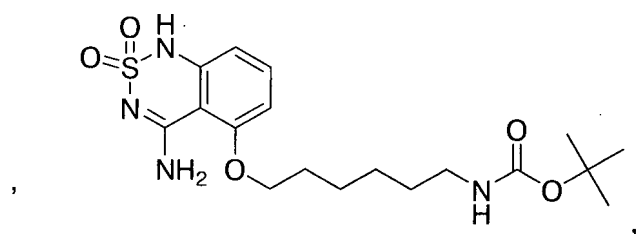
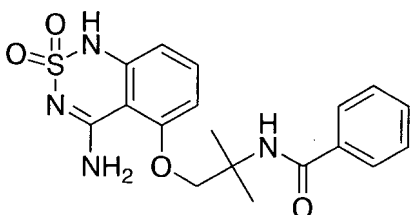
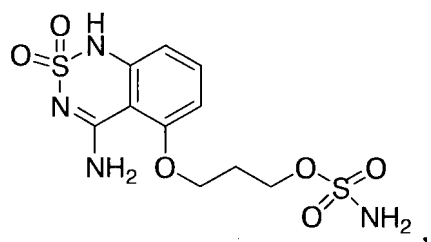
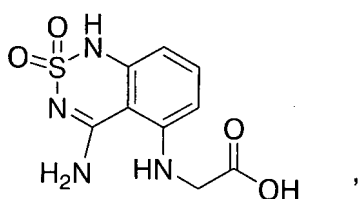
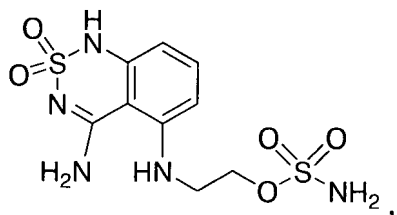
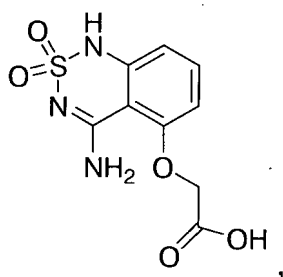
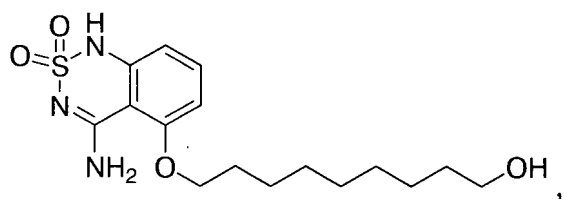
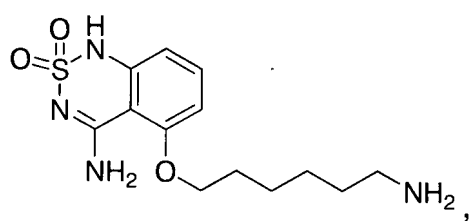


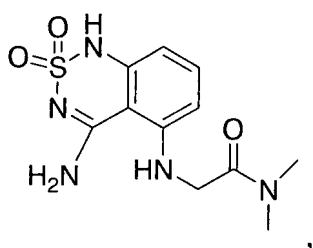
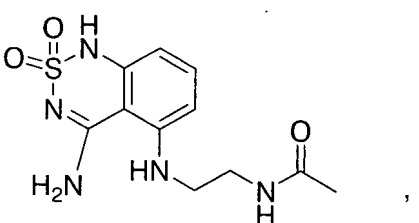
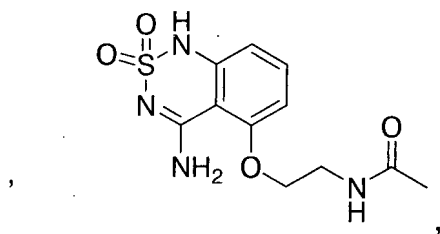
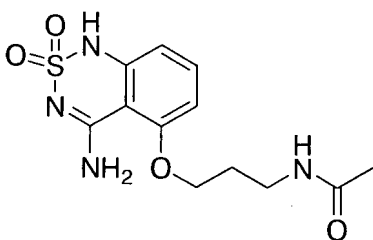
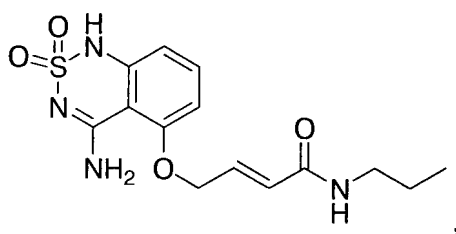
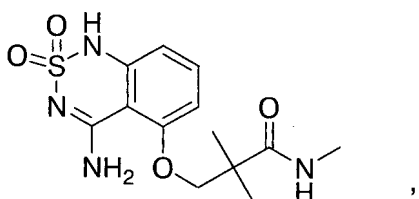
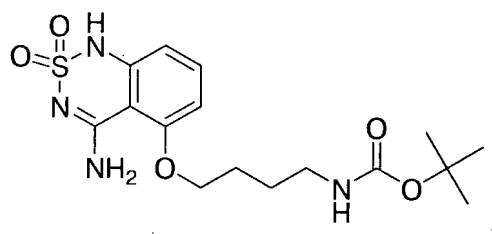
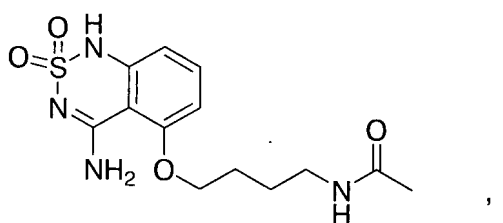
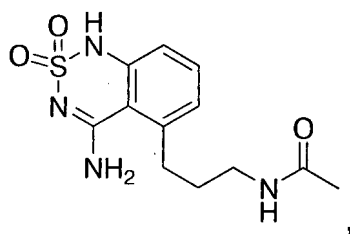
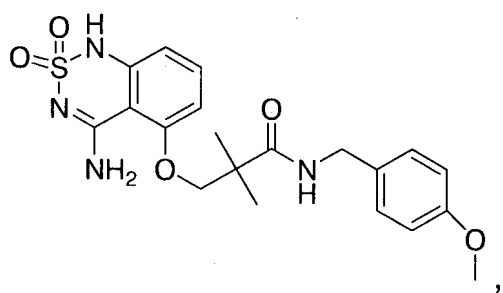
,

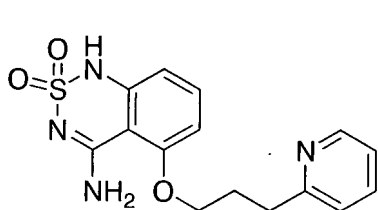




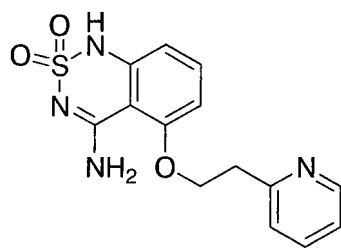




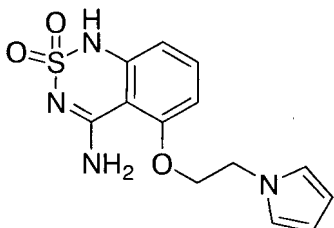




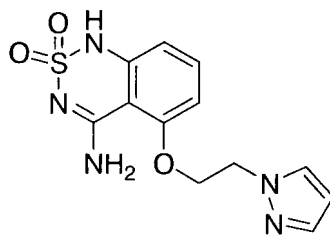
,



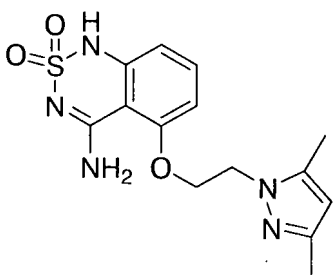
,



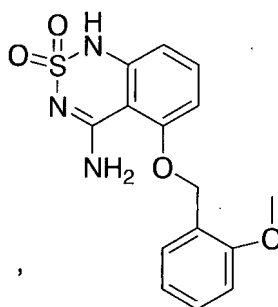
,



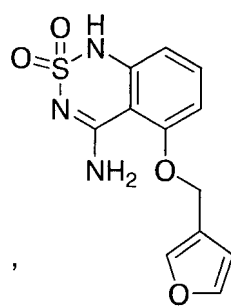
,



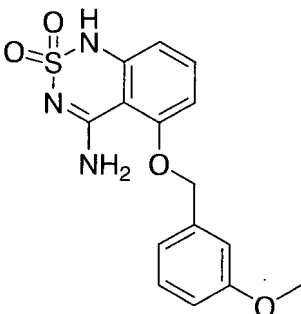
,



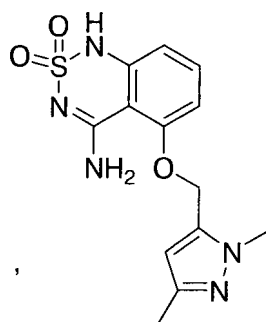
,



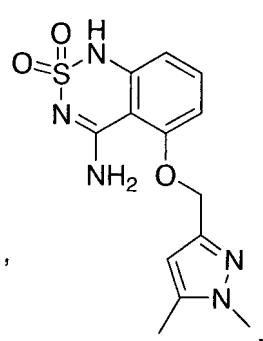
,



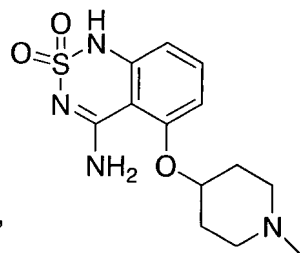
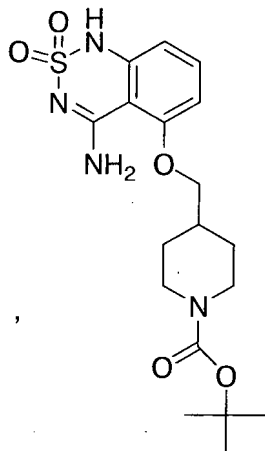
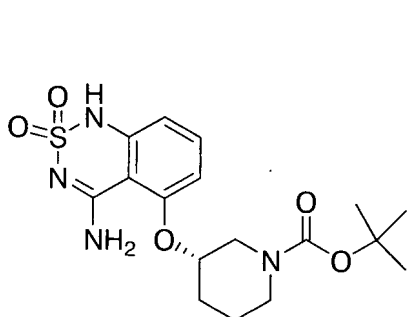
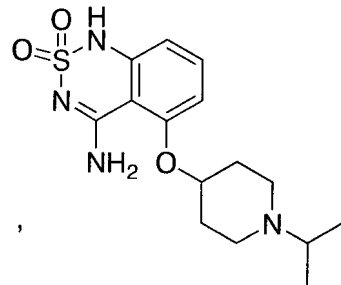
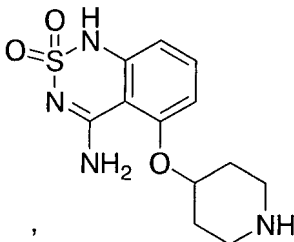
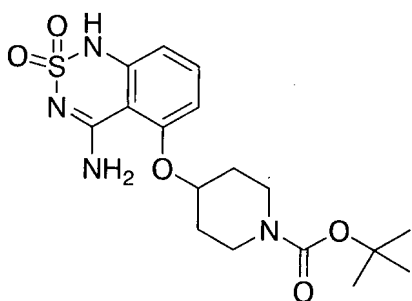
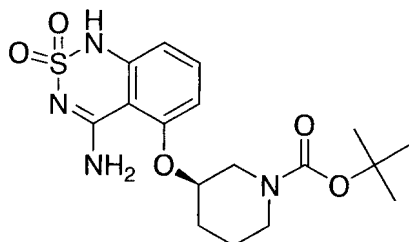
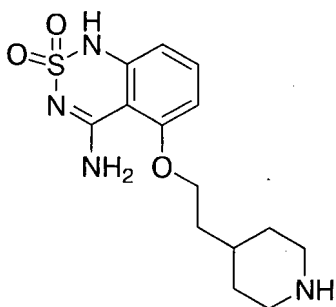
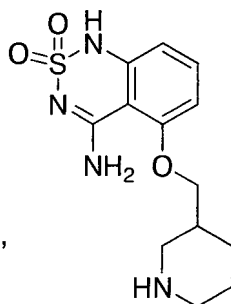
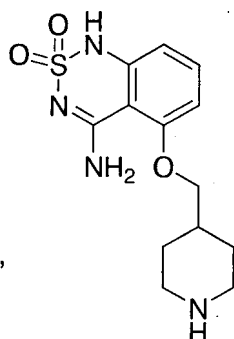
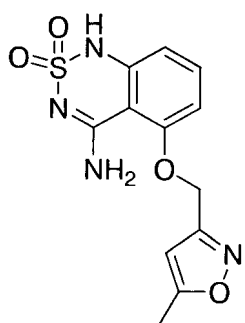
,

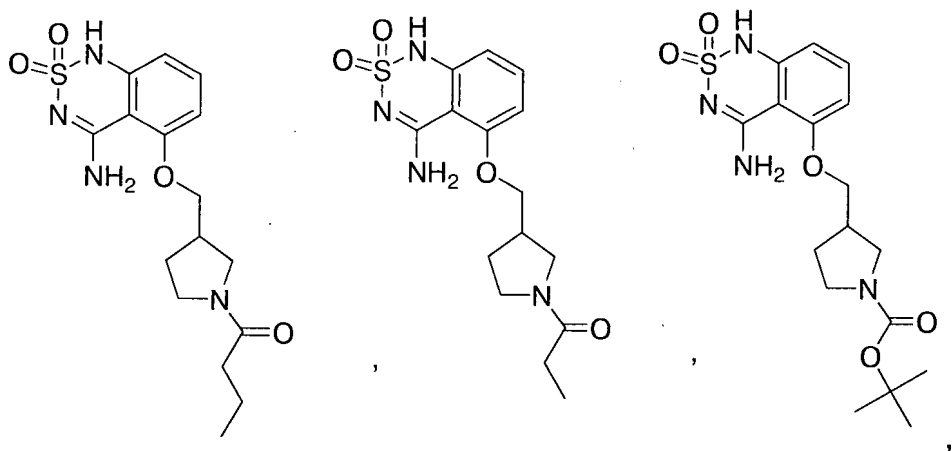
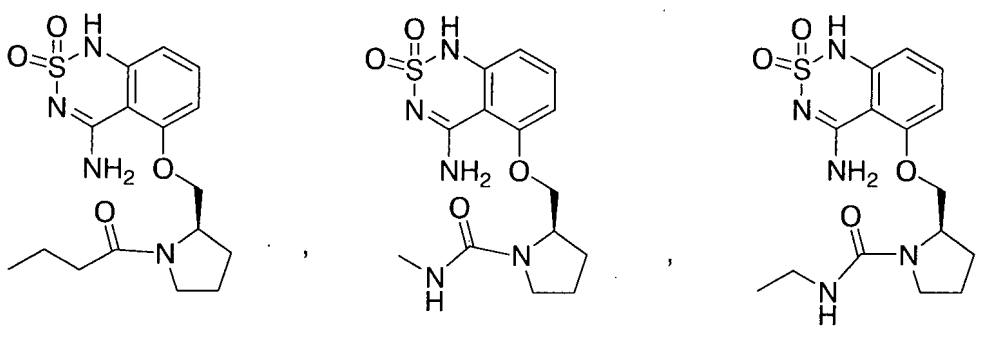
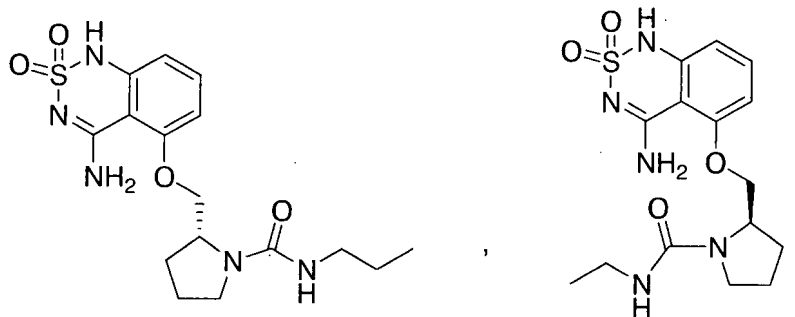
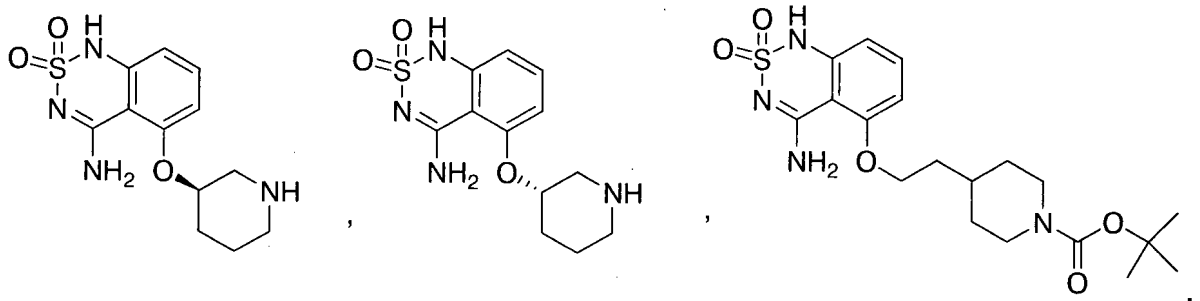


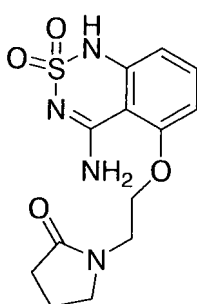
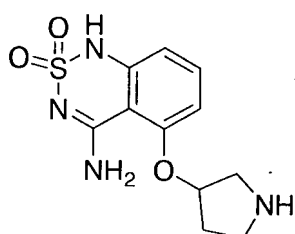
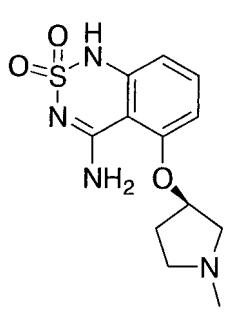
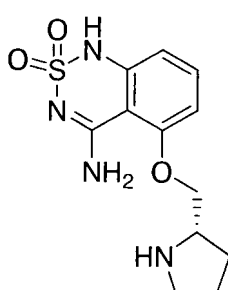
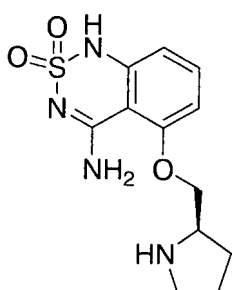
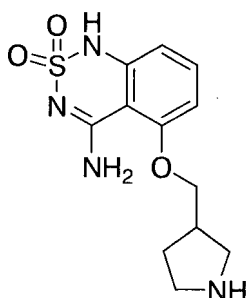
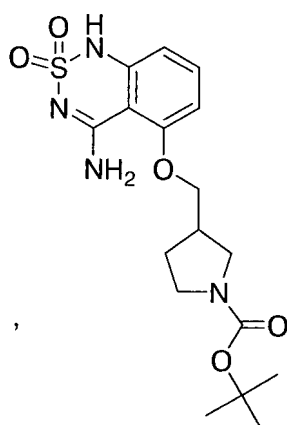
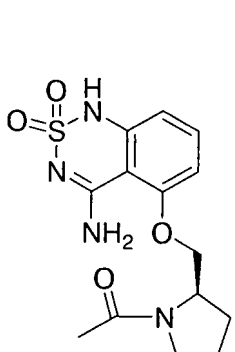
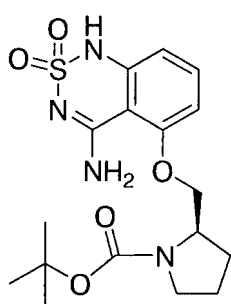
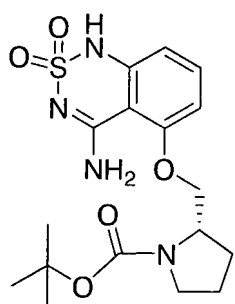
,

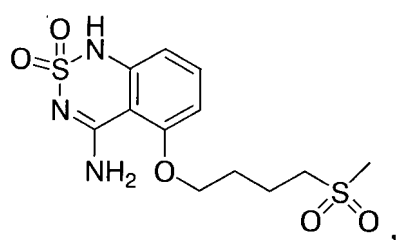
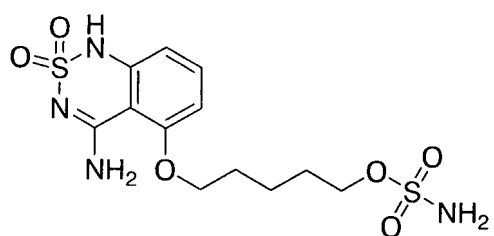
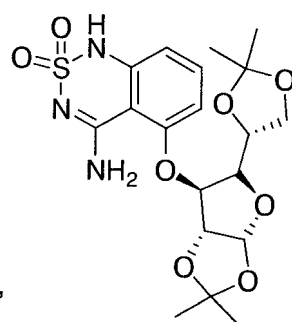
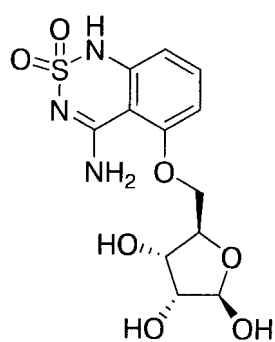
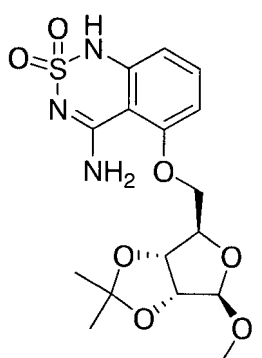
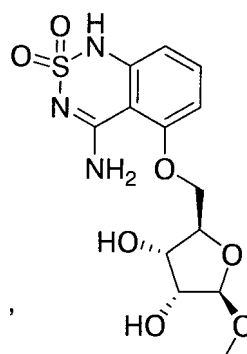
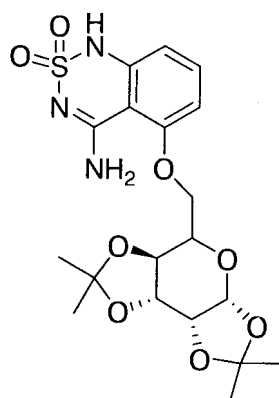
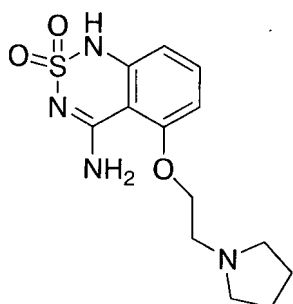
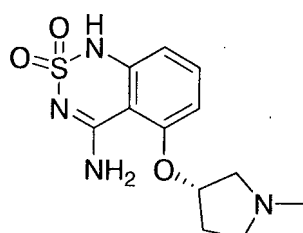
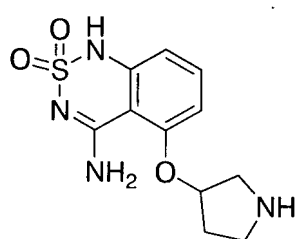


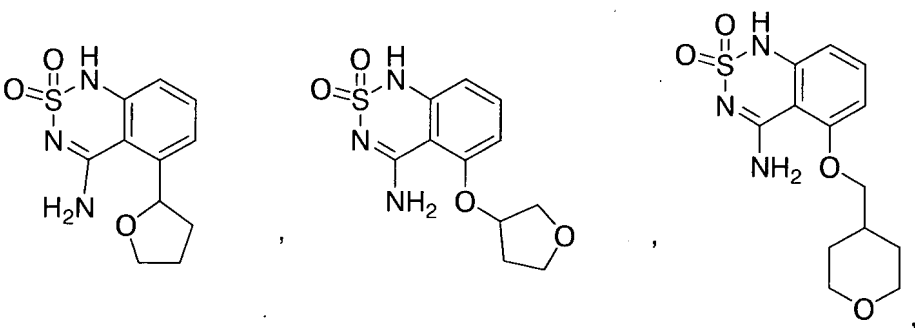
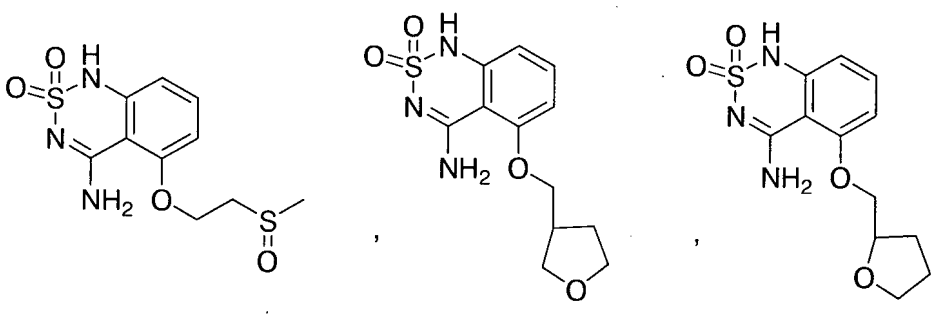
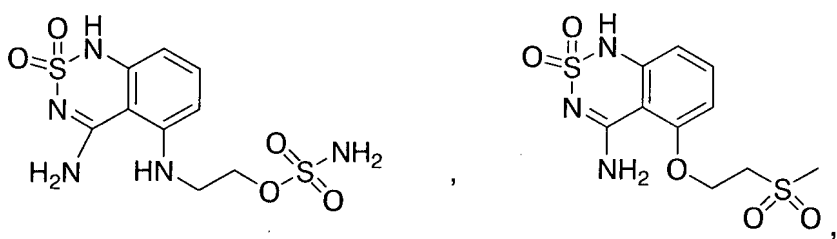
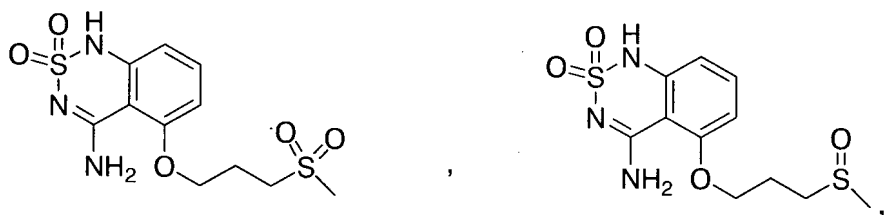
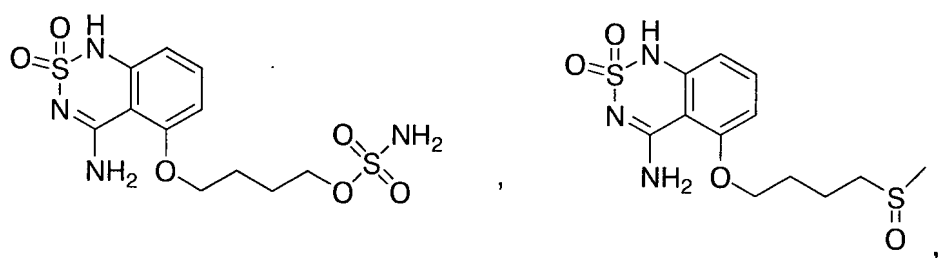
,

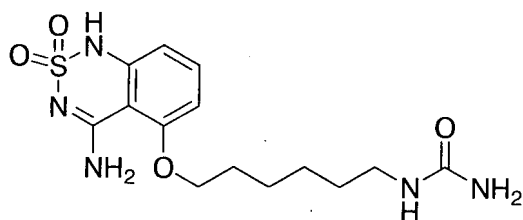
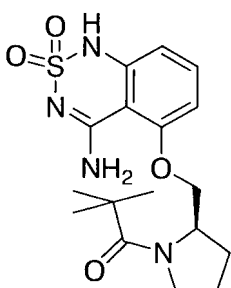
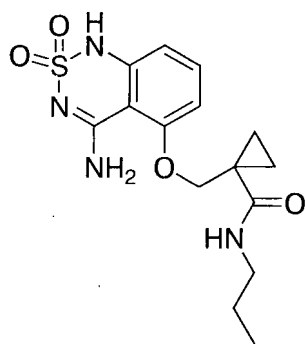
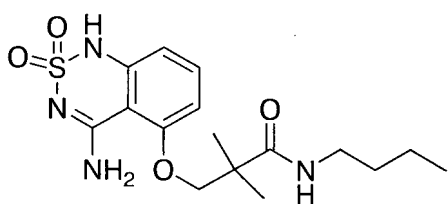
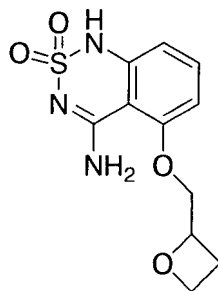
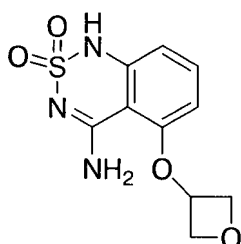
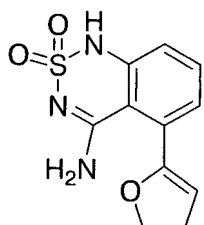
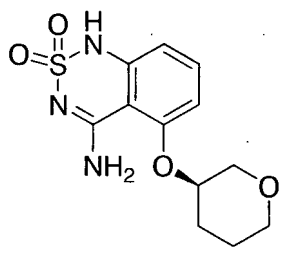
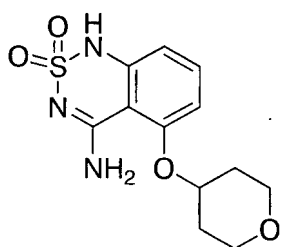


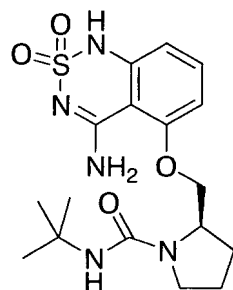
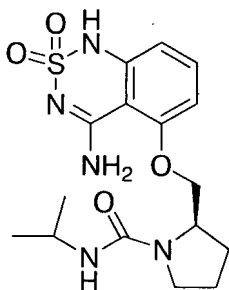
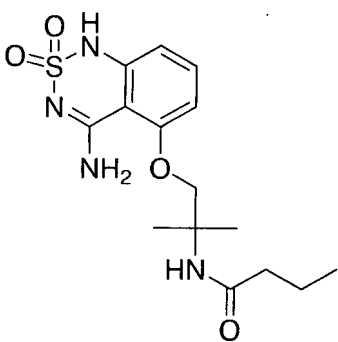
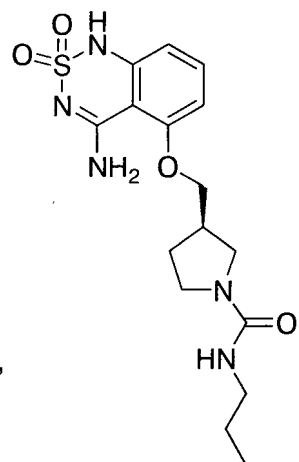
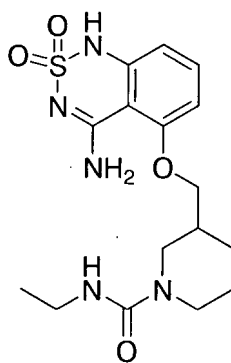
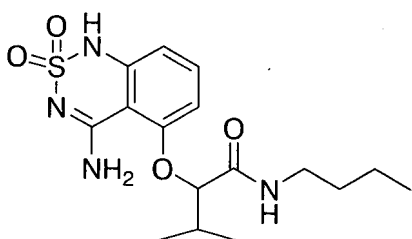
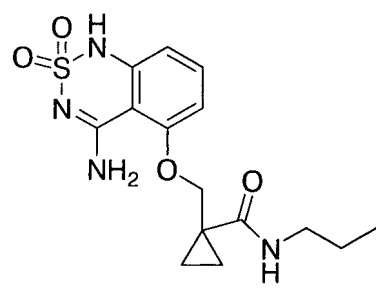
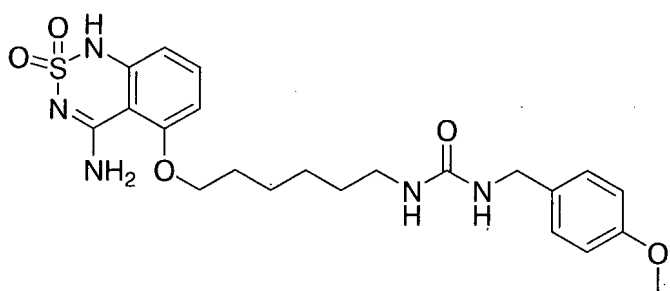
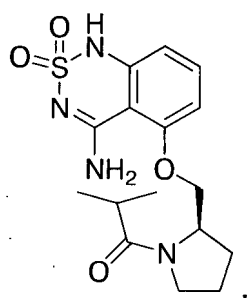
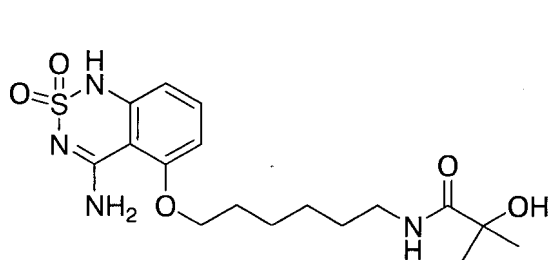


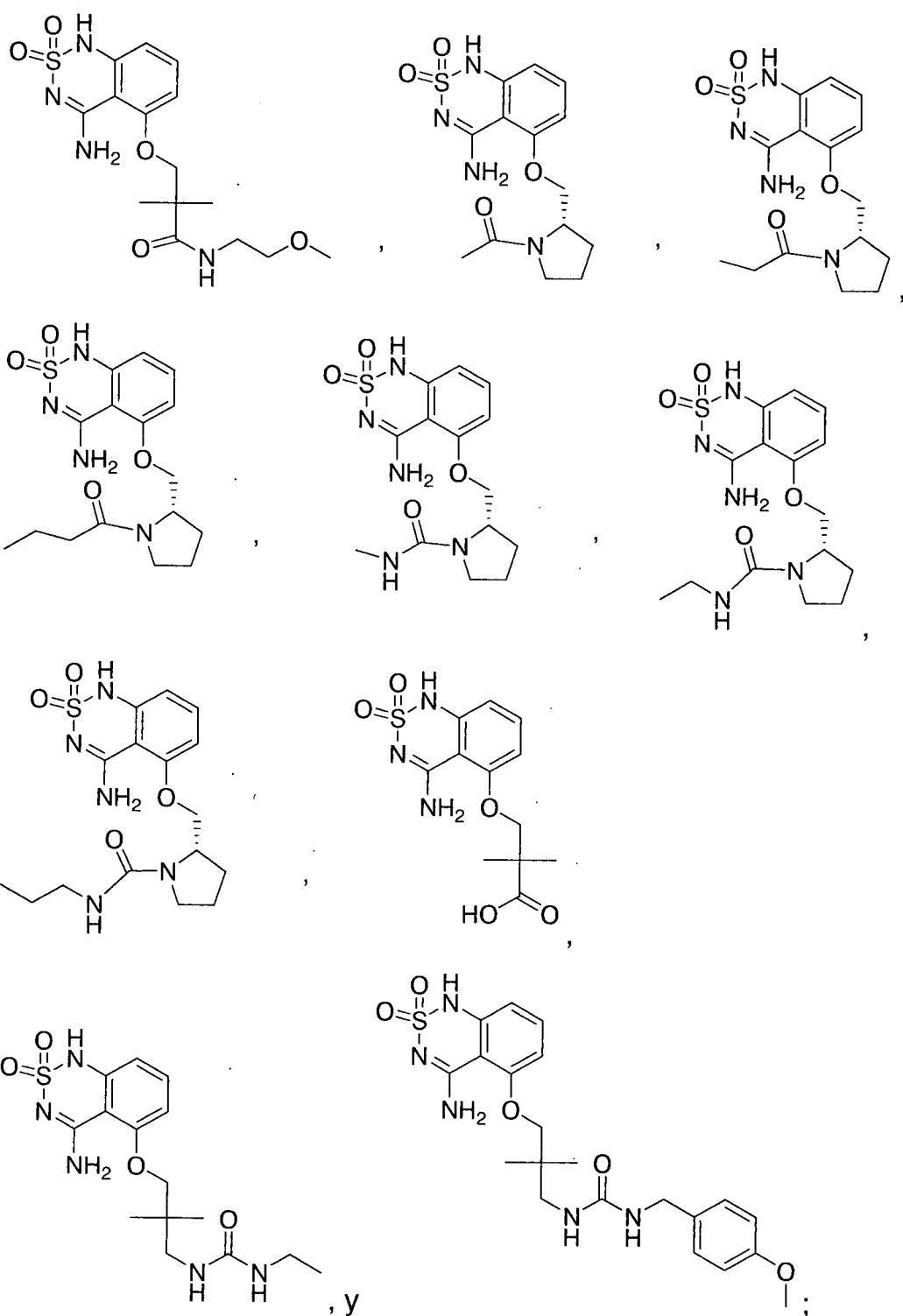












o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo.

35. Una composición ingerible que comprende un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (I) como se describió en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato, y/o éster de la misma.

36. La composición ingerible de la reivindicación 35 o 2, seleccionada del grupo integrado por producto alimenticio o de bebida, producto no comestible, y las combinaciones de los mismos.

37. La composición ingerible de la reivindicación 36, en donde el producto alimenticio o de bebida está seleccionados del grupo integrado por la categoría Sopas; la categoría Alimentos Procesados Secos; la categoría Bebidas; la categoría Comidas Preparadas; la categoría Alimentos Enlatados o Conservados; la categoría Alimentos Procesados Congelados; la categoría Alimentos Procesados Enfriados; la categoría Alimentos "Snack"; la categoría Productos Horneados; la categoría Golosinas; la categoría Productos Lácteos; la categoría Helados; la categoría Reemplazo de Comidas; la categoría Pastas y Fideos; la categoría Salsas, Aderezos, Condimentos; la categoría Alimentos para Bebés; la categoría Alimentos para Untar; recubrimientos, garrapiñados, o glaseados dulces; y las combinaciones de los mismos.

38. La composición ingerible de la reivindicación 36, en donde el producto no comestible está seleccionado del grupo integrado por productos nutricionales y suplementos dietarios, farmacéuticos, medicaciones sin receta médica, productos de cuidado oral, y cosméticos.

39. La composición ingerible de la reivindicación 36, en donde el modificador del ligando del receptor quimiosensorial es un compuesto que tiene la Fórmula estructural (I) según se describió en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo, en una cantidad mejoradora de sabor dulce.

40. La composición ingerible de la reivindicación 37, en donde la cantidad mejoradora de sabor dulce no es una cantidad terapéuticamente efectiva.

41. La composición ingerible de la reivindicación 36, que comprende al menos aproximadamente 0,0001 ppm hasta aproximadamente 10 ppm del compuesto que tiene la Fórmula estructural (I) según se describe en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal o solvato y/o éster de la misma.

42. La composición ingerible de la reivindicación 36, que comprende desde aproximadamente 0,01 ppm hasta aproximadamente 100 ppm del compuesto que tiene la Fórmula estructural (I) según se describe en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato y/o éster del la misma.

43. La composición ingerible de la reivindicación 36, que comprende desde aproximadamente 10 ppm hasta aproximadamente 100.000 ppm del

compuesto que tiene la Fórmula estructural (I) según se describe en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato y/o éster de la misma.

44. La composición ingerible de la reivindicación 36 o 2, que comprende al menos una entidad de sabor dulce.

45. La composición ingerible de la reivindicación 44, en donde el edulcorante está seleccionado del grupo integrado por sacarosa, fructosa, glucosa, galactosa, manosa, lactosa, tagatosa, maltosa, jarabe de maíz (que incluye jarabe de maíz de alta fructosa), D-triptófano, glicina, eritritol, isomalt, lactitol, manitol, sorbitol, xilitol, maltodextrina, maltitol, isomalt, jarabe de glucosa hidrogenado (HGS), hidrolizado de almidón hidrogenado (HSH), esteviosida, rebaudiosida A, otros glucósidos dulces basados en *Stevia*, carrelame, otros edulcorantes basados en guanidina, sacarina, acesulfame-K, ciclamato, sucralosa, alitame, mogrosida, neotame, aspartame, otros derivados de aspartame, y las combinaciones de los mismos.

46. La composición ingerible de la reivindicación 44, en donde al menos una entidad de sabor dulce comprende al menos un edulcorante natural; y al menos un edulcorante artificial o sintetizado.

47. La composición ingerible de la reivindicación 46, en donde el edulcorante es un edulcorante sacárido, un azúcar natural, o un edulcorante semi-sintético de "alcohol de azúcar".

48. La composición ingerible de la reivindicación 46, en donde el edulcorante artificial o sintetizado es un compuesto de sabor dulce no calórico, un compuesto de sabor dulce reducido en calorías, o un compuesto de sabor dulce que no apunta a ser calórico.

49. La composición ingerible de la reivindicación 48, en donde el edulcorante natural está seleccionado del grupo integrado por sacarosa, fructosa, glucosa, tagatosa, maltosa, galactosa, manosa, lactosa, glicina, jarabe de maíz u otros jarabes o concentrados de edulcorantes derivados de fuentes frutales o vegetales naturales, eritritol, isomalt, lactitol, manitol, sorbitol, xilitol, maltodextrina, y mogrosida.

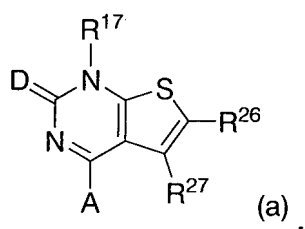
50. La composición ingerible de la reivindicación 48, en donde el edulcorante artificial o sintetizado está seleccionado del grupo integrado por aspartame, sacarina, acesulfame-K, ciclamato, sucralosa, alitame, aspartame, neotame, otros derivados de aspartame, D-triptófano, jarabe de glucosa hidrogenado (HGS), hidrolizado de almidón hidrogenado (HSH), esteviosida, rebaudiosida A, glucósidos dulces basados en *Stevia*, carrelame, y otros edulcorantes basados en guanidina.

51. Una composición edulcorante que comprende un compuesto que tiene una Fórmula estructural (I) según se describió en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIc) como se describió en la reivindicación 2, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo.

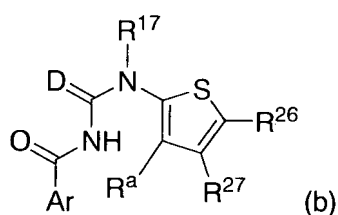
52. Un método de mejoramiento del sabor dulce de una composición ingerible que comprende poner en contacto a la composición ingerible o a los precursores de la misma con la composición que tiene una Fórmula estructural (I) según se describió en la reivindicación 1, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIc) como se describió en la reivindicación 2, o un compuesto que tiene la Fórmula Estructural (IIIa) como se describió en la reivindicación 8, o un tautómero, sal, solvato, y/o éster del mismo.

53. Un método de mejoramiento del sabor dulce de una composición ingerible que comprende poner en contacto a la composición ingerible o a los precursores de la misma con la composición edulcorante de la reivindicación 46.

54. Un proceso para preparar un compuesto que tiene una Fórmula estructural (a):



que comprende hacer reaccionar un compuesto que tiene la Fórmula estructural (b)



con una base,
en donde:

D es oxígeno o azufre;

A es $-\text{NH}_2$ u $-\text{OR}^b$;

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido;

R^{26} y R^{27} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, heteroarilalquilo sustituido, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{31}$, $-\text{S}(\text{O})_h\text{R}^{31}$, $-\text{NR}^{31}\text{R}^{32}$, $-\text{CONR}^{31}\text{R}^{32}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $-\text{SO}_2\text{NR}^{31}\text{R}^{32}$, o $-\text{NR}^{31}\text{SO}_2\text{R}^{32}$; o alternativamente R^{26} y R^{27} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, heterocicloalquilo, o heterocicloalquilo sustituido;

Ar es arilo o arilo sustituido; y

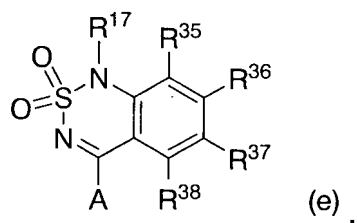
R^a es $-\text{CN}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^b)_2$;

cada R^b es independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, o heteroarilalquilo sustituido;

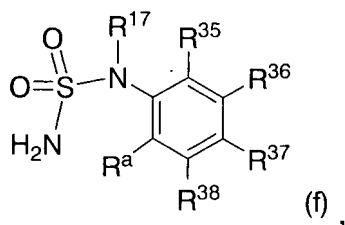
h es 0, 1 o 2; y

R^{31} y R^{32} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido; o alternativamente R^{31} y R^{32} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.

55. Un proceso par preparar un compuesto que tiene una Fórmula estructural (e):



que comprende hacer reaccionar un compuesto que tiene la Fórmula estructural (f)



con una base,

en donde:

A es -NH_2 u -OR^b ;

R^{17} es hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, o arilalquilo sustituido;

R^{35} , R^{36} , R^{37} , y R^{38} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, halo, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido, -CN , -NO_2 , -OR^{41} , $\text{-S(O)}_k\text{R}^{41}$, $\text{-NR}^{41}\text{R}^{42}$, $\text{-CONR}^{41}\text{R}^{42}$, $\text{-CO}_2\text{R}^{41}$, $\text{-SO}_2\text{NR}^{41}\text{R}^{42}$, y $\text{-NR}^{41}\text{SO}_2\text{R}^{42}$; o alternativamente, R^{35} y R^{36} , R^{36} y R^{37} , o R^{37} y R^{38} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, heterocicloalquilo, o heterocicloalquilo sustituido;

R^a es -CN , -C(O)R^b , -C(O)OR^b , $\text{-C(O)N(R}^b)_2$;

cada R^b es independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo, o heteroarilalquilo sustituido; y

R^{41} y R^{42} son independientemente hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, arilo, arilo sustituido, arilalquilo, arilalquilo sustituido, acilo, acilo sustituido, heteroalquilo, heteroalquilo sustituido, heteroarilo, heteroarilo sustituido, heteroarilalquilo o heteroarilalquilo sustituido; o alternatively R^{41} y R^{42} , conjuntamente con los átomos a los cuales ellos están unidos, forman un anillo cicloheteroalquilo o cicloheteroalquilo sustituido.