



No. 10-035482- -00004-0000

Fecha: 2010-07-14 16:55:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Evt: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 19

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2010/000020

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: IRM LLC

Dirección: Hurts Holme, 12 Trot Road, New Hamilton, HM 11 Bermudas

Nacionalidad o Domicilio: Bermudas

Lugar de Constitución: Bermudas

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: Diagonal 34 No. 5-28, Bogotá

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
10-035.482

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se han modificado las Reivindicaciones 9 y 10, en donde se establece que el método es exclusivamente in vitro. Se elimina la Reivindicación 11.

6

Comprobante de pago No. 10-55.894

Fecha 8 de julio de 2010

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa y Capítulo Reivindicatorio.

☐

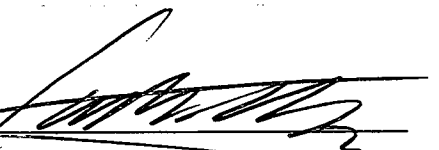
Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: 

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

2 538

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035482- -00004-0000

Fecha: 2010-07-14 16:55:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 19

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 55,894
FECHA : JULIO 8 DE 2010

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CLARTE RAISBEK	DEVOLUCION TASA			880	08/07/2010	1,002,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEÑAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

100: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

3 539

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 55,898
 FECHA : JULIO 8 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035482- -00004-0000

Fecha: 2010-07-14 16:55:12 Dep: 2020 DIR NUEVASCH
 Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
 Act: 329 CTOINFORMACION Folios: 19

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	DEVOLUCION TASA			880	08/07/2010	1,002,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	52,000.00
99		OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	52,000.00
		TOTAL :	\$ 52,000.00

: CINCUENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

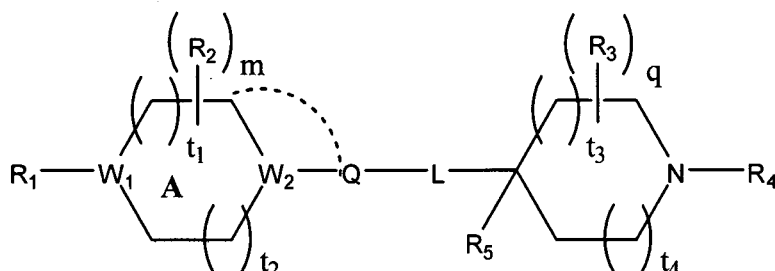
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

540

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto de la Fórmula I:



en la cual:

Q es un radical bivalente o trivalente seleccionado entre arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₁₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₈ y heterocicloalquilo C₃₋₈; donde dicho arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo de Q está optativamente sustituido con hasta 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con halo, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ sustituido con halo, -C(O)R₂₀ y -C(O)OR₂₀; donde R₂₀ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆; y que optativamente conecta a un carbono adyacente a W₂ a través de una CR₃₁, O, S o NR₃₁ con un carbono de Q (indicado por la línea de puntos) para formar un anillo de 5 miembros fusionado a los anillos A y Q; donde R₃₁ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆;

W₁ y W₂ son independientemente seleccionados entre CR₂₁ y N; donde R₂₁ es seleccionado entre hidrógeno, ciano, alquilo C₁₋₆ y -C(O)OR₂₅; donde R₂₅ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆; el anillo A puede tener hasta 2 carbonos del anillo sustituidos con un grupo seleccionado entre -C(O)-, -C(S)- y -C(=NOR₃₀)- y puede estar parcialmente insaturado con hasta 2 enlaces dobles, donde R₃₀ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆;

L es seleccionado entre alquilenos C₁₋₆, alquenilenos C₂₋₆, -(CH₂)_nO-, -OC(O)(CH₂)_n-, -C(O)O(CH₂)_n-, -NR₂₆(CH₂)_n- y -O(CH₂)_n-; donde R₂₆ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆ y n es seleccionado entre 0, 1, 2, 3, 4 y 5; donde cualquier alquilo de L puede estar optativamente sustituido con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con halo, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ sustituido con halo, -C(O)R₂₂ y -C(O)OR₂₂; donde R₂₂ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆;

m es seleccionado entre 0, 1, 2, 3 y 4;

q es seleccionado entre 0, 1, 2, 3 y 4;

cada uno de t₁, t₂, t₃ y t₄ es independientemente seleccionado entre 0, 1 y 2;

541
S

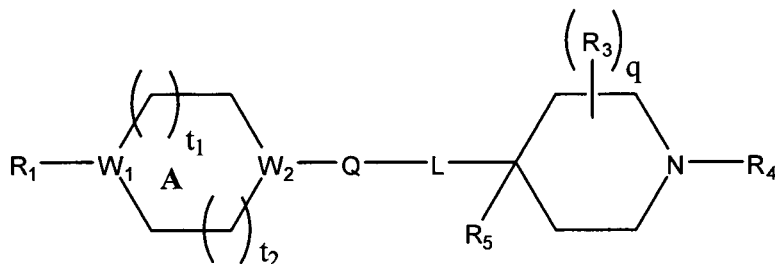
R_1 es seleccionado entre $-X_1S(O)_{0-2}X_2R_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2OR_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2C(O)R_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2C(O)OR_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2OC(O)R_{6a}$ y $-X_1S(O)_{0-2}NR_{6a}R_{6b}$; donde X_1 es seleccionado entre un enlace, O, $NR_{7a}R_{7b}$ y alquileo C_{1-4} ; X_2 es seleccionado entre un enlace y alquileo C_{1-4} ; R_{6a} es seleccionado entre hidrógeno, halo, alquilo C_{1-6} , alquienilo C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{1-10} , heterocicloalquilo C_{3-8} y cicloalquilo C_{3-8} ; donde dichos arilo, heteroarilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo de R_{6a} está optativamente sustituido con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre hidroxilo, halo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alquilo C_{1-6} sustituido con ciano, alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo y aril C_{6-10} alcoxi C_{1-4} ; R_{6b} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ; y R_{7a} y R_{7b} son independientemente seleccionados entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

R_2 y R_3 son independientemente seleccionados entre hidrógeno, halo, hidroxilo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo, $-C(O)R_{23}$, y $-C(O)OR_{23}$; donde R_{23} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

R_4 es seleccionado entre R_8 y $-C(O)OR_8$; donde R_8 es seleccionado entre alquilo C_{1-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{1-10} , cicloalquilo C_{3-8} y heterocicloalquilo C_{3-8} ; donde dicho arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo de R_8 está optativamente sustituido con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-12} , heterocicloalquilo C_{3-8} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alcoxi C_{1-6} y alcoxi C_{1-6} sustituido con halo;

R_5 es seleccionado entre hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alcoxi C_{1-6} y alcoxi C_{1-6} sustituido con halo, o las sales aceptables para uso farmacéutico del mismo.

2. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 de la Fórmula Ia:



en la cual

Q es un radical bivalente o trivalente seleccionado entre arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{1-10} , cicloalquilo C_{3-8} y heterocicloalquilo C_{3-8} ; donde dicho arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo de Q está optativamente sustituido con hasta 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo,

6542

alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo, $-C(O)R_{20}$ y $-C(O)OR_{20}$; donde R_{20} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ; y que optativamente conecta un carbono adyacente a W_2 a través de un CR_{31} u O con un carbono de Q para formar un anillo de 5 miembros fusionado a los anillos A y Q (tal como los anillos fusionados de los ejemplos V1-V5, expuestos más adelante); donde R_{31} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

W_1 y W_2 son independientemente seleccionados entre CR_{21} y N, donde R_{21} es seleccionado entre hidrógeno, ciano, alquilo C_{1-6} y $-C(O)OR_{25}$; donde R_{25} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ; el anillo A puede tener hasta 2 carbonos del anillo sustituidos con un grupo seleccionado entre $-C(O)-$, $-C(S)-$ y $-C(=NOR_{30})-$ y puede estar parcialmente insaturado con hasta 2 enlaces dobles, donde R_{30} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

L es seleccionado entre alquilenos C_{1-6} , alquilenos C_{2-6} , $-(CH_2)_nO-$, $-NR_{26}CH_2)_n-$, $-OC(O)(CH_2)_n-$, $-C(O)O(CH_2)_n-$ y $-O(CH_2)_n-$; donde R_{26} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ; donde n es seleccionado entre 0, 1, 2, 3, 4 y 5; donde cualquier alquilo de L puede estar optativamente sustituido con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo, $-C(O)R_{22}$ y $-C(O)OR_{22}$; donde R_{22} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

cada uno de t_1 y t_2 es independientemente seleccionado entre 0, 1 y 2;

q es seleccionado entre 0, 1, 2, 3 y 4;

R_1 es seleccionado entre $-X_1S(O)_{0-2}X_2R_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2OR_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2C(O)R_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2C(O)OR_{6a}$, $-X_1S(O)_{0-2}X_2OC(O)R_{6a}$ y $-X_1S(O)_{0-2}NR_{6a}R_{6b}$; donde X_1 es seleccionado entre un enlace, O, $NR_{7a}R_{7b}$ y alquilenos C_{1-4} ; X_2 es seleccionado entre un enlace y alquilenos C_{1-4} ; R_{6a} es seleccionado entre hidrógeno, halo, alquilo C_{1-6} , alquilenos C_{2-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{1-10} , heterocicloalquilo C_{3-8} y cicloalquilo C_{3-8} ; donde dichos arilo, heteroarilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo de R_{6a} están optativamente sustituidos con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre hidroxilo, halo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alquilo C_{1-6} sustituido con ciano, alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo y aril- C_{6-10} alcoxi C_{1-4} ; R_{6b} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ; y R_{7a} y R_{7b} son independientemente seleccionados entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

R_3 es seleccionado entre hidrógeno, halo, hidroxilo, alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} sustituido con halo, alquilo C_{1-6} sustituido con hidroxilo, alcoxi C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} sustituido con halo, $-C(O)R_{23}$, y $-C(O)OR_{23}$; donde R_{23} es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C_{1-6} ;

R_4 es seleccionado entre R_8 y $-C(O)OR_8$; donde R_8 es seleccionado entre alquilo C_{1-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo C_{1-10} , cicloalquilo C_{3-8} y heterocicloalquilo C_{3-8} ; donde dichos arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo de R_8 están optativamente sustituidos con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C_{1-6} , cicloalquilo

7543

C₃₋₁₂, heterocicloalquilo C₃₋₈, alquilo C₁₋₆ sustituido con halo, alquilo C₁₋₆ sustituido con hidroxilo, alcoxi C₁₋₆, y alcoxi C₁₋₆ sustituido con halo;

R₅ es seleccionado entre hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con halo, alquilo C₁₋₆ sustituido con hidroxilo, alcoxi C₁₋₆ y alcoxi C₁₋₆ sustituido con halo.

3. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 2 en el cual Q es un radical bivalente o trivalente seleccionado entre fenilo, piridinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 1,2,4-oxadiazolilo, y tiazolilo; donde dichos fenilo, piridinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo y tiazolilo de Q están optativamente sustituidos con hasta 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ sustituido con halo, -C(O)OR₂₀ y -C(O)R₂₀; donde R₂₀ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆; y que optativamente conectan un átomo de carbono adyacente a W₂ a través de un CR₃₁ u O con un carbono de Q para formar un anillo de 5 miembros fusionado a los anillos A y Q; donde R₃₁ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆.

4. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 3 en el cual: W₁ y W₂ son independientemente seleccionados entre CR₂₁ y N; donde R₂₁ es seleccionado entre hidrógeno, ciano, , alquilo C₁₋₆ y -C(O)OR₂₅; donde R₂₅ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆; el anillo A puede contener una sustitución de un carbono del anillo con un grupo seleccionado entre -C(O)-, -C(S)- y -C(=NOR₃₀)- y puede estar parcialmente insaturado con un doble enlace; donde R₃₀ es seleccionado entre hidrógeno y alquilo C₁₋₆; y L es seleccionado entre -O(CH₂)₀₋₄-, -(CH=CH)-, -OC(O)-, -NH(CH₂)₀₋₄-, -NCH₃(CH₂)₀₋₄- y -(CH₂)₁₋₄-.

5. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 4 en el cual: R₁ es seleccionado entre -X₁S(O)₀₋₂X₂R_{6a}, -X₁S(O)₀₋₂X₂OR_{6a}, -X₁S(O)₀₋₂X₂C(O)OR_{6a}, -X₁S(O)₀₋₂X₂OC(O)R_{6a} y -X₁S(O)₀₋₂NR_{6a}R_{6b}; donde X₁ es seleccionado entre un enlace y O; X₂ es seleccionado entre un enlace y alquilenilo C₁₋₄; R_{6a} es seleccionado entre hidrógeno, halo, ciano, metilo, etilo, propilo, isopropilo, etenilo, piridinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolino, isoxazolilo, tetrazolilo, fenilo y imidazolilo; donde dichos piperidinilo, piridinilo, pirrolidinilo, morfolino, isoxazolilo, tetrazolilo, fenilo o imidazolilo de R_{6a} están optativamente sustituidos con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre hidroxilo, halo, alquilo C₁₋₆ y benzoxi; y R_{6b} es seleccionado entre hidrógeno, metilo y etilo

6. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 5 en el cual: R₄ es seleccionado entre R₈ y -C(O)OR₈; donde R₈ es seleccionado entre isopropilo, ciclopropilo, t-butilo, 1,2,4-oxadiazolilo, pirimidinilo, piridinilo, piridazinilo, tetrahidro-2H-pirano, tetrahidrofuranilo, oxetanilo, 2H-tetrazolilo y tiazolilo; donde dicho ciclopropilo, 1,2,4-

544
8

oxadiazolilo, pirimidinilo, piridinilo, piridazinilo, tetrahydro-2H-piranilo, tetrahydrofuranilo, oxetanilo, 2H-tetrazolilo o tiazolilo de R₈ está optativamente sustituido con 1 a 3 radicales independientemente seleccionados entre halo, trifluorometilo, isopropilo, t-butilo, metilo, etilo y ciclopropilo optativamente sustituido con metilo; y R₅ es seleccionado entre hidrógeno y metoxi.

7. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 seleccionado entre los siguientes:

1-metilciclopropil-4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-((4-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(2-(4-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)fenoxi)etil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(3-(4-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)fenoxi)propil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(4-(4-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)fenoxi)butil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, terc-Butil 4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, Isopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, terc-Butil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 3-Ciclopropil-5-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 5-Ciclopropil-3-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 2-(4-(Metilsulfonil)piperazin-1-il)-5-((1-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)pirazina, 5-Isopropil-3-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, Tetrahydro-2H-piran-4-il 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, (S)-Tetrahydrofuran-3-il 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, (R)-Tetrahydrofuran-3-il 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 2-Isopropil-5-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)tiazol, 2-((1-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)piperidin-4-il)metoxi)-5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazina, Oxetan-3-il 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, Isopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, Isopropil 4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridazin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, Isopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirimidin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, (E)-isopropil 4-(2-(6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-il)vinil)piperidin-1-carboxilato, Isopropil 4-(2-(6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-il)etil)piperidin-1-carboxilato, (E)-Isopropil 4-(2-(2-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirimidin-5-il)vinil)piperidin-1-carboxilato, 5-Etil-2-(4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, 1-(Metilsulfonil)-4-(5-((1-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)piperidin-4-

9 545

il)metoxi)piridin-2-il)piperazina, 5-Etil-2-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, 2-((1-(5-Metilpiridin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazina, 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 5-Etil-2-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, 3-Isopropil-5-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 3-Isopropil-5-(4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 1-Metilciclopropil 4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 5-Isopropil-3-(4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 2-((1-(5-Fluoropiridin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazina, 3-Isopropil-5-(4-((6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, terc-Butil 4-((5-(4-(metilsulfonil)-1,4-diazepan-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, terc-Butil 4-((5-(4-(metilsulfonil)-1,4-diazepan-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, terc-butil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperidin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)piperidin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, terc-Butil 4-(2-(3-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)-1,2,4-oxadiazol-5-il)etil)piperidin-1-carboxilato, terc-Butil 4-(3-(3-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)-1,2,4-oxadiazol-5-il)propil)piperidin-1-carboxilato, 5-(3-(1-(5-etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)propil)-3-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, Isopropil 4-(3-(3-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)-1,2,4-oxadiazol-5-il)propil)piperidin-1-carboxilato, 3-Isopropil-5-(4-(2-(5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)tiazol-2-il)etil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, Isopropil 4-((4-(1-metansulfonil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(2-(4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)etil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(3-(4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)propil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(4-(4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)butil)piperidin-1-carboxilato, 1-metilciclopropil 4-((4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 5-isopropil-3-(4-((4-(1-(metilsulfonil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, Isopropil 4-((4-(1-metansulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(2-(4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)etil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(3-(4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)propil)piperidin-1-carboxilato, isopropil 4-(4-(4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)butil)piperidin-1-carboxilato, 1-Metilciclopropil 4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-5-(trifluorometil)piridina, 5-

10-546

isopropil-3-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 3-cloro-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-5-(trifluorometil)piridina, 5-cloro-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)piridina, 3-cloro-6-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)piridazina, 5-bromo-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, 5-etil-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, 5-fluoro-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)piridina, 3-isopropil-5-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-1,2,4-oxadiazol, 3-terc-butil-6-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)piridazina, 5-fluoro-2-(4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)pirimidina, Isopropil 4-(2-(3-(1-metansulfonil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi)etil)piperidin-1-carboxilato, 1-Metilciclopropil 4-metoxi-4-((5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 1-metilciclopropil 4-((6-formil-5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 1-Metilciclopropil 4-((6-cloro-5-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(3-metoxi-3-oxopropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato, ácido 3-(4-(5-((1-(1-metilciclopropoxi)carbonil)-piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)piperazin-1-ilsulfonil)propanoico, ácido 3-(4-(5-((1-(1-metilciclopropoxi)carbonil)piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)piperazin-1-ilsulfonil)propanoico, ácido 3-(4-(5-((1-(1-metilciclopropoxi)carbonil)piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)piperazin-1-ilsulfonil)propanoico, ácido 3-(4-(5-((1-(1-metilciclopropoxi)carbonil)piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)piperazin-1-ilsulfonil)propanoico, ácido 3-(4-(5-((1-(1-metilciclopropoxi)carbonil)piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)piperazin-1-ilsulfonil)propanoico; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-cianopropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-(1H-tetrazol-5-il)propilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(vinilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(2-(piperidin-1-il)etilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(2-morfolinoetilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(2-(dimetilamino)etilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butil 4-((5-(4-(3-cloropropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butil 4-((5-(4-(3-acetoxipropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-

11 547

aminopropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((5-(4-(2-etoxietilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-
1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-(pirrolidin-1-il)propilsulfonil)piperazin-1-
il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-(2-metil-1H-
imidazol-1-il)propilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((5-(4-(3-(dimetilamino)propilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(propilsulfonil)piperazin-1-
il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-
(etilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil
4-((5-(4-(isopropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((5-(4-(isobutilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(sec-butilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((5-(4-(3-acetoxi-2,2-
dimetilpropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((5-(4-(3-hidroxi-2,2-dimetilpropilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(2-(piridin-3-
il)etilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
Metilciclopropil 4-((5-(4-(2-(piridin-4-il)etilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-sulfamoil)piperazin-1-
il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-Butil 4-((5-(4-
(morfolinosulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((6-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((6-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((6-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-
il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((6-(4-
(etilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil
4-((6-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((6-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-fluoro-6-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-Butil 4-((5-(4-(metilsulfonil)-2-oxopiperazin-1-
il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(metilsulfonil)-
2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-
(2-oxo-4-(propilsulfonil)piperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
Metilciclopropil 4-((5-(4-(isopropilsulfonil)-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-
iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((5-(4-(isopropilsulfonil)-2-
oxopiperazin-1-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-((6-(2-
oxo-4-(propilsulfonil)piperazin-1-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-((6-(4-(isopropilsulfonil)-2-oxopiperazin-1-il)piridin-3-

12548

iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-(5-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)pirazin-2-il)-4-(metilsulfonil)piperazin-2-ona; 1-(5-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)piridin-2-il)-4-(metilsulfonil)piperazin-2-ona; terc-Butil 4-((2,6-difluoro-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2-metil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((3-metoxi-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2,6-dimetil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2,5-dimetil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2-(metoxycarbonil)-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2-cloro-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((3-metil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2,3-dimetil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((2-fluoro-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; terc-butyl 4-((4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)-2-(trifluorometil)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 2-(4-((2,6-Difluoro-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-il)-5-etilpirimidina; 1-Metilciclopropil 4-((2,6-difluoro-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 3-(4-(4-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-3,5-difluorofenil)piperidin-1-ilsulfonil)propil acetato; 1-Metilciclopropil 4-((4-(1-(3-acetoxipropilsulfonil)piperidin-4-il)-2,6-difluorofenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 3-(4-(4-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-3,5-difluorofenil)piperidin-1-ilsulfonil)propan-1-ol; 1-Metilciclopropil 4-((2,6-difluoro-4-(1-(3-hidroxipropilsulfonil)piperidin-4-il)fenoxi)metil)piperidin-1-carboxilato; Isopropil 4-((5-(1,2,3,6-tetrahidro-1-metansulfonilpiridin-4-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; 1-Metilciclopropil 4-((6-(1,2,3,6-tetrahidro-1-metansulfonilpiridin-4-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-carboxilato; Isopropil 4-(2-(6-(1,2,3,6-tetrahidro-1-metansulfonilpiridin-4-il)piridin-3-iloxi)etil)piperidin-1-carboxilato; 2-(4-((5-(1,2,3,6-Tetrahidro-1-metansulfonilpiridin-4-il)pirazin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-5-etilpirimidina; 2-(4-((6-(1,2,3,6-Tetrahidro-1-metansulfonil-piridin-4-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-il)-5-etilpirimidina; 2-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-5-(1-metansulfonilpiperidin-4-il)pirazina; 2-(4-((6-(1-Metansulfonilpiperidin-4-il)piridin-3-iloxi)metil)piperidin-1-il)-5-etilpirimidina; 3-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)-6-(1-metansulfonilpiperidin-4-il)piridazina, 2-(4-((5-(1-Metansulfonilpiperidin-4-il)piridin-2-iloxi)metil)piperidin-1-il)-5-etilpirimidina; 1-terc-Butil 4-(4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)fenil) piperazin-1,4-dicarboxilato; N-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metil)-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)anilina; N-((1-(5-Etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il)metil)-N-metil-4-(1-(metilsulfonil)piperidin-4-il)anilina; ácido 4-(4-((1-(5-fluoropirimidin-2-il)piperidin-4-il)metoxi)fenil)-1-(metilsulfonil)piperidin-4-carboxílico;

13549

ácido 2-[(2-{4-[5-({1-[(1-metilciclopropoxi)carbonil]piperidin-4-il}metoxi)pirazin-2-il]-3-oxopiperazin-1-sulfonil}etil)amino]acético; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-carbamimidamidoetan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(3-metil-3-nitrobutane)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-bencilpirrolidin-3-sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il]pirazin-2-il}oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(carbamoilmetan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-carbamoil-1-metiletan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{2-oxo-4-{[2-(pirrolidin-1-il)etan]sulfonil}piperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-(morfolin-4-il)etan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(3-(dimetilamino)propan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-(1,3-dioxo-2,3-dihidro-1H-isoindol-2-il)etan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(dimetilcarbamoil)metan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-(2-metilpropil)pirrolidin-3-sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{2-oxo-4-{[3-(1H-pirazol-1-il)propan]sulfonil}piperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{2-oxo-4-(pirrolidin-3-sulfonil)piperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-amino-2-metilpropan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-metilpirrolidin-3-il)metan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-(azetidin-1-il)etan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{2-oxo-4-{[2-(1H-pirazol-1-il)etan]sulfonil}piperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-metilpirrolidin-3-sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il]pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(1-(dimetilcarbamoil)-1-metiletan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(3-(dimetilamino)-3-metilbutan]sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(2-{2-(terc-butoxi)-2-oxoetil}amino}etan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-(azetidin-3-sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(5-{4-[(3-(3,3-

14550

difluoroazetidin-1-il)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[3-(azetidin-1-il)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{2-oxo-4-[(3S)-pirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3S)-1-metilpirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3R)-1-metilpirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3S)-pirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3R)-pirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-(azetidin-3-sulfonil)piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{2-oxo-4-[(pirrolidin-3-ilmetan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-(1-hidroxi-2-metilpropan-2-sulfonil)piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(2-hidroxietan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(azetidin-3-ilmetan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(1-metilpirrolidin-2-il)metan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{2-oxo-4-[(3R)-pirrolidin-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-(1-metilazetidin-3-sulfonil)piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-(1-metilazetidin-3-sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(1-metilazetidin-3-il)metan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3S,4S)-3,4-dihidroxipirrolidin-1-il]propan} sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(2-[(3S,4S)-3,4-dihidroxipirrolidin-1-il]etan} sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(azetidin-3-ilmetan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{2-oxo-4-[(pirrolidin-2-ilmetan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(3-aminopropan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-{4-[(2-aminoetan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(3-metansulfonamidoazetidin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[2-(dimetilamino)etan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(2-oxo-4-{[3-(pirrolidin-1-

15551

il)propan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-({[5-(4-{[3-(morfolin-4-il)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-
2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(3-metiloxetan-3-
il)metan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-({[5-(4-{[3-(acetiloxi)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-
il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(3,3,3-
trifluoropropan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-({[5-[(2E)-2-(hidroxiimino)-4-metansulfonilpiperazin-1-il]pirazin-2-
il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(3-cloropropan)sulfonil]-
2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-
({[5-(4-{[(3-hidroxipropan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-[(4-{[1-(dimetilamino)ciclopropil]metan}sulfonil)-2-
oxopiperazin-1-il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-
[4-({[1-(dimetilamino)ciclopropil]metan}sulfonil)piperazin-1-il]pirazin-2-
il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(3-hidroxi-3-
metilbutane)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-
metilciclopropil 4-({[5-(2-oxo-4-{[(3R)-oxolan-3-sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-
il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(2-oxo-4-{[(3S)-oxolan-3-
sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-
({[5-(4-{[3-(acetiloxi)-3-metilbutan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-
il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[6-[4-({[1-(azetidin-1-
il)ciclopropil]metan}sulfonil)piperazin-1-il]piridin-3-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato;
1-metilciclopropil 4-({[5-[4-({[1-(bencilamino)ciclopropil]metan}sulfonil)piperazin-1-
il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-[4-({[1-
(azetidin-1-il)ciclopropil]metan}sulfonil)piperazin-1-il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(1-hidroxiciclopropil)metan]sulfonil}piperazin-
1-il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[2-(1-
hidroxiciclopropil)etan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-[4-({[2-(1-
(acetiloxi)ciclopropil]etan}sulfonil)piperazin-1-il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-[4-({[1-
(benciloxi)ciclopropil]metan}sulfonil)piperazin-1-il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[(1-aminociclopropil)metan]sulfonil}piperazin-1-
il]pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-({[5-(4-{[2-(1-
hidroxiciclopropil)etan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi}metil)piperidin-1-
carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{2,6-difluoro-4-[3-(N-metilmetansulfonamido)azetidin-1-
il]fenoximetil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[2,6-difluoro-4-(3-
metansulfonamidoazetidin-1-il)fenoximetil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-

16552

{2,6-difluoro-4-[3-(2-metilpropan-1-sulfonamido)azetidin-1-il]fenoximetil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{4-[3-(N,2-dimetilpropan-1-sulfonamido)azetidin-1-il]-2,6-difluorofenoximetil}piperidin-1-carboxilato; 5-etil-2-{4-[(2-metansulfonil-1H,2H,3H,4H-pirazino[1,2-a]indol-8-il}oxi)metil]piperidin-1-il}pirimidina; 11-{[1-(5-etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il]oxi}-5-metansulfonil-8-oxa-5-azatriciclo[7.4.0,0{2,7}]trideca-1(13),2(7),9,11-tetraeno; 11-{[1-(5-etilpirimidin-2-il)piperidin-4-il]metoxi}-5-metansulfonil-8-oxa-5-azatriciclo[7.4.0,0{2,7}]trideca-1(13),2(7),9,11-tetraeno; terc-butil 4-[(2-metansulfonil-1H,2H,3H,4H-pirazino[1,2-a]indol-8-il}oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[(2-metansulfonil-1H,2H,3H,4H-pirazino[1,2-a]indol-8-il}oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; propan-2-il 4-{3-[3-(1-metansulfonilpiperidin-4-il)fenoxi]propil}piperidin-1-carboxilato; propan-2-il 4-{2-[3-(1-metansulfonilpiperidin-4-il)fenoxi]etil}piperidin-1-carboxilato; propan-2-il 4-[3-(1-metansulfonilpiperidin-4-il)fenoximetil]piperidin-1-carboxilato; propan-2-il 4-{3-[3-(1-metansulfonil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)fenoxi]propil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([5-(4-metansulfonil-2-sulfanilidenepiperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil (3S,4S)-3-hidroxi-4-{[(6-{4-[(2-metilpropan)sulfonil]piperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil (3R,4S)-3-hidroxi-4-{[(6-{4-[(2-metilpropan)sulfonil]piperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-hidroxi-4-{[(6-{4-[(2-metilpropan)sulfonil]piperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{[(6-{4-[(2-hidroxi-2-metilpropan)sulfonil]piperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil (3S,4R)-3-metoxi-4-{[(6-{4-[(2-metilpropan)sulfonil]piperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([5-(4-{[3-(3,3-difluoroazetidin-1-il)propan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([5-(4-{[3-(azetidin-1-il)propan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{[(5-{4-[(3-metoxipropan)sulfonil]piperazin-1-il}pirazin-2-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{[(6-{4-[(3-cloropropan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([5-(4-{[2-(azetidin-1-il)etan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([6-(4-{[3-(azetidin-1-il)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)piridin-3-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([5-(4-{[2-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etan]sulfonil}piperazin-1-il)pirazin-2-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-{[(6-{4-[(3-hidroxiopropan)sulfonil]-2-oxopiperazin-1-il}piridin-3-il)oxi]metil}piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-([6-(4-{[3-(azetidin-1-il)propan]sulfonil}-2-oxopiperazin-1-il)piridin-3-il]oxi)metil]piperidin-1-carboxilato; 1-metilciclopropil 4-[2,6-difluoro-4-(4-

17-553

metansulfonil-2-oxopiperazin-1-il)fenoximetil]piperidin-1-carboxilato y 1-metilciclopropil 4-[(5-[4-(oxetan-3-sulfonil)-2-oxopiperazin-1-il]pirazin-2-il}oxi)metil]piperidin-1-carboxilato.

8. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en combinación con un excipiente aceptable para uso farmacéutico.

9. Un método in vitro para modular la actividad de GPR119, que comprende administrar a un sistema una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o sales aceptables para uso farmacéutico o composiciones farmacéuticas del mismo, para modular así dicha actividad de GPR119.

10. El método in vitro de acuerdo con la Reivindicación 9, en el cual el compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 tiene contacto directo con GPR119.

11. Un método para el tratamiento de una enfermedad o trastorno en el cual la modulación de la actividad de GPR119 puede prevenir, inhibir o mejorar la patología y/o sintomatología de la enfermedad o trastorno, que comprende administrar a un sistema o un sujeto que lo necesita una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o sales aceptables para uso farmacéutico o composiciones farmacéuticas del mismo.

12. El método de acuerdo con la Reivindicación 11, en el cual dicha enfermedad o trastorno es seleccionado entre obesidad, diabetes tipo 1, diabetes mellitus tipo 2, hiperlipidemia, diabetes idiopática tipo 1, diabetes autoinmune latente en adultos, diabetes tipo 2 de inicio temprano, diabetes atípica de inicio en la juventud, diabetes del joven de inicio en la madurez, diabetes relacionada con la desnutrición y diabetes gestacional.

13. El método de acuerdo con la Reivindicación 11, dicha enfermedad o trastorno es seleccionado entre enfermedad cardíaca coronaria, accidente cerebrovascular isquémico, restenosis posterior a la angioplastia, enfermedad vascular periférica, claudicación intermitente, infarto de miocardio, dislipidemia, lipemia postprandial trastornos de tolerancia a la glucosa alterada, trastornos de glucosa plasmática en ayunas alterada, acidosis metabólica, cetosis, artritis, osteoporosis, hipertensión, insuficiencia cardíaca congestiva, hipertrofia del ventrículo izquierdo, enfermedad arterial periférica, retinopatía diabética, degeneración macular, cataratas, nefropatía diabética, glomerulosclerosis, insuficiencia renal crónica, neuropatía diabética, síndrome metabólico, síndrome X,

18.554

síndrome premenstrual, enfermedad cardíaca coronaria, angina pectoris, trombosis, aterosclerosis, infarto de miocardio, ataques isquémicos transitorios, accidente cerebrovascular, restenosis vascular, hiperglucemia, hiperinsulinemia, hiperlipidemia, hipertrigliceridemia, resistencia a la insulina, metabolismo de la glucosa alterado, trastornos de tolerancia a la glucosa alterada, trastornos de glucosa plasmática alterada, obesidad, disfunción eréctil, trastornos de la piel y los tejidos conectivos, ulceraciones del pie y colitis ulcerativa, disfunción endotelial y flexibilidad vascular deteriorada.

49555

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 57,721
FECHA : JULIO 14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035482- -00004-0000

Fecha: 2010-07-14 16:55:12 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 19

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	353318350	14/07/2010	26,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL
			TOTAL : \$ 26,000.00

SDN: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
IRM LLC

REFERENCIA	Radicación No.	10 35482
	Solicitud internacional	PCT/US2008/075145
	Fecha inicio fase nacional	20/4/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	12263
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,


JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

10 2 MAR 2011

mcarri

44555

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 57,721
FECHA : JULIO 14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



Nº. 10-035482- -00004-0000

Fecha: 2010-07-14 16:55:12 Dep: 2020 DIR NULVASOR
Tra: 11 PATENTILYII Lve: 378 PASL NACIONAL
Act: 329 CIOINFORMACION Folios: 19

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
2 : RAISBER	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	353318350	14/07/2010	26,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	26,000.00
		TOTAL :	\$ 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
IRM LLC

REFERENCIA	Radicación No.	10 35482
	Solicitud internacional	PCT/US2008/075145
	Fecha inicio fase nacional	20/4/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	12263
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

02 MAR 2011

mcarri