

OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.
SERVICIOS LEGALES & PROFESIONALES

WORLD TRADE CENTER - TORRE C
CALLE 100 No. 8A-55 Piso 10
BOGOTÁ, COLOMBIA
TELÉFONO: +57-1 638-6200
FAX: +57-1 638-6201

www.olarteraisbeck

Radicación : 02083307 00000002

Folios: 104

Fecha (AMD): 2003-10-14 15:12:55

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SEÑORES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref.: Expediente No.02083307

Solicitud de Patente de Invención

Título: "NUEVOS DERIVADOS DE
PIPERAZINA"

Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC.

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO MEDIANTE FIJACIÓN EN LISTA DE FECHA

15 DE AGOSTO DE 2003, OFICIO No. 06583

(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, según consta en el poder adjunto, me permito dar respuesta al auto emanado por ese Despacho, dentro del término legal previsto en el artículo 39 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En respuesta a la primera observación del Examinador, me permito aportar la traducción de las reivindicaciones de la presente solicitud tal como fueron modificadas según la facultad prevista en el artículo 19 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT por su sigla en inglés).

OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.

6/2 281
286
285

2. En respuesta a la segunda observación del Examinador, me permito aportar junto al presente memorial, la traducción de la totalidad del Examen Preliminar Internacional, según lo previsto en el Art. 36.2.b del PCT, en concordancia con el Art. 39 de la Decisión 486.

Aprovecho la presente oportunidad, para poner en conocimiento del Despacho mi cambio de oficinas, por lo que de ahora en adelante, recibiré notificaciones en la Calle 100 No. 8A-55 Torre C, Piso 10, World Trade Center, o en la secretaría de ese Despacho.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexos: Poder
Traducción de modificaciones bajo Art. 19 PCT
Traducción Examen Preliminar

DILIGENCIA DE RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Ante el Notario Once del Circulo de Santafe de Bogotá, compareció CARLOS R. OLARTE
Quien exhibió la C.C. No. 79.782.747
expedida en T.P. 74.295
y declaró que la firma y huella que aparecen en el presente memorial son suyas y que el contenido del mismo es cierto.
Memorial dirigido a _____
Santafe de Bogotá, D.C. 28 AGO 2008
Firma del Declarante [Firma] HUELLA [Huella]
Autorizó la anterior Diligencia [Firma]
NOTARIA ONCE DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, D.C.
MANVARRO DE BAUTISTA
NOTARIA ONCE

**APOSTILLA EN PODER DE REPRESENTACIÓN DE
PFIZER PRODUCTS INC.**

Bilingüe inglés- español otorgado en Nueva York, Estados Unidos el 14 de julio de 2003 y firmado por J. Trevor Lumb, Vicepresidente de Pfizer Products Inc.

CERTIFICACION NOTARIAL

Bilingüe inglés- español, el 14 de julio de 2003 el suscrito notario Kenneth Greenwood certifica que J. Trevor Lumb ejercía funciones de Vicepresidente de la Compañía Pfizer Products Inc., con sede en Groton, Connecticut, Estados Unidos.

Firma del notario

Sello notarial: certificado, verificado y autenticado en la Localidad de Egham en Surrey, 14 julio, 2003 por el Notario Kenneth Greenwood-Horne Engall & Freeman
Sello Notario Público en alto relieve rojo.

APOSTILLA

REINO UNIDO DE GRAN BRETAÑA E IRLANDA DEL NORTE

1. País :Reino Unido de Gran Bretaña e Irlanda del Norte
Este documento Público
2. ha sido firmado por K. Greenwood
3. ejerce funciones de Notario Público
4. Lleva el sello de dicho Notario Público

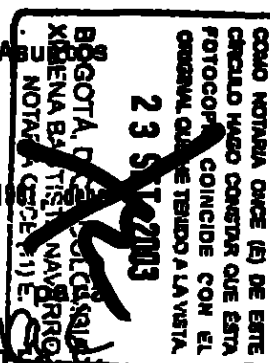
CERTIFICADO

5. En Londres 6. El 17 de julio de 2003
7. Por el Secretario de Estado Principal de su Majestad para Asuntos exteriores y de la mancomunidad
8. No. G210435
9. Sello del Secretario de Estado Principal de su Majestad para Asuntos exteriores y de la mancomunidad
10. Firma de R. Bawden - Por Secretario de Estado

Si el documento se usa en un país que no es parte de la convención de la Haya del 5 de octubre 1961 presentarse en sección consular de la misión que representa al país.

Es traducción fiel del inglés, con copia
confrontación. Bogotá 25 de julio-2003.

archivo
Marlen Neira Castro
MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987



OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.
LEGAL & PROFESSIONAL SERVICES

WORLD TRADE CENTER - TORRE C
CALLE 100 NO. 8A-55 PISO 10
BOGOTA, COLOMBIA
TELEPHONE: +57-1 638-6200
FAX: +57-1 638-6201

www.olarteraisbeck.com

6/4
283
288
287

Power of Attorney

The undersigned,

domiciled in

Eastern Point Road, Groton, Connecticut 06340 USA

by means of these presents hereby grants to **Carlos R. Olarte, J. Ian Ralsbeck and Ana María Frieri** full and sufficient Power of Attorney to file, prosecute, obtain, defend and enforce any and all of the company's Patents, Utility Models and Industrial Designs in the Republic of Colombia, to which end it empowers them to take all steps necessary before any administrative or judicial authority of any class for the objects stated, to file petitions, appeals, replies and oppositions, pay taxes and annuities, request testimonies, receive documents and securities, abandon applications and collect refunds. Sufficient power is hereby granted to receive notifications on behalf of the Company, to confer powers on those who are to represent the company judicially and extrajudicially, to answer in court in the matter of all claims and demands that may be presented in connection with the objects stated, giving them likewise power to substitute these presents and revoke such substitutions.

El suscrito,

Pfizer Products Inc.

domiciliado en

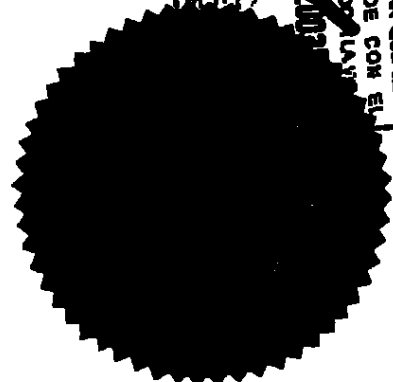
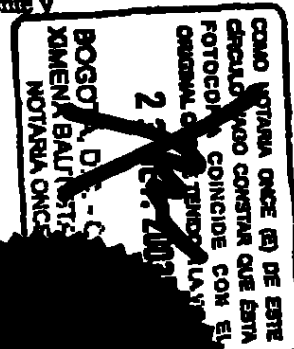
Eastern Point Road, Groton, Connecticut 06340 USA

por medio del presente otorga a **Carlos R. Olarte, J. Ian Ralsbeck y Ana María Frieri** poder especial, amplio y suficientes para presentar, tramitar, obtener, defender y hacer respetar todas y cualquiera de Patentes, Modelos de Utilidad y Diseños Industriales de la compañía en la República de Colombia, a cuyo efecto los faculta para dar todos los pasos necesarios ante cualquier autoridad administrativa o judicial de cualquier jerarquía para cumplir con lo encomendado, elevar solicitudes, apelaciones, respuestas y oposiciones, pagar impuestos y anualidades, solicitar testimonios, recibir documentos y valores, desistir y percibir. Se concede poder bastante para recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar poderes a quienes vayan a representar a la compañía judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a todas las reclamaciones o demandas que por motivo de lo encomendado se presentaren, dándoles asimismo facultad para sustituir el presente y revocar dichas sustituciones.

Signature/Firma:

Date/Fecha: July 14, 2003

City/Country/Ciudad,País: New York, USA



OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK & FRIERI, LTDA.
LEGAL & PROFESSIONAL SERVICES

WORLD TRADE CENTER - TORRE C
CALLE 100 No. 8A-55 Piso 10
BOGOTA, COLOMBIA
TELEPHONE: +57-1 638-6200
FAX: +57-1 638-6201

www.olarteraisbeck.com

6/5
284
289
288

Notarial Certification

Certificación Notarial

On this date,
July 14, 2003

The undersigned Notary Public certifies:

1. That *J. Trevor Lumb*

of legal age and domiciled in

NEW YORK, USA
signed the foregoing document.

2. That the grantor has executed the foregoing document as Vice President of Pfizer Products Inc.

3. That Pfizer Products Inc., having its principal place of business located in Groton, Connecticut, U.S.A. is duly incorporated, is currently in existence, and that the purposes for which the Power of Attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.

4. That the grantor has the authority to execute the Power of Attorney and that his/her representation is legal.

5. The foundation for my certifications contained in points 2, 3 and 4 was the exhibition of the following authentic document(s):

En esta fecha,

el Notario Público suscrito certifica:

1. Que

J. Trevor Lumb

mayor de edad y domiciliado

New York

suscribió el documento que antecede.

2. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de

4. Que

con sede principal ubicada en

está legalmente constituida, que tiene existencia legal vigente y que los propósitos para los cuales se otorga el poder se encuentra dentro de los que comprenden su objeto social.

4. Que el otorgante tiene la representación para suscribir el poder, y que ésta es legítima.

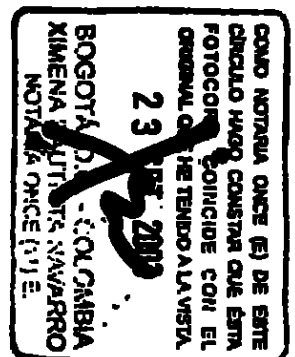
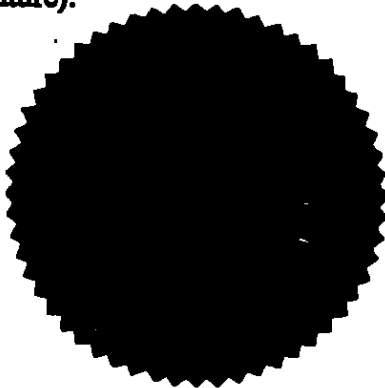
5. El fundamento de mis certificaciones contenidas en los puntos 2, 3 y 4 fue la exhibición de los (del) siguiente(s) documento(s) auténtico(s):

NOTARY PUBLIC (Signature):

EXECUTION
Certified Verified and Authenticated
In The Town Of Exham In Surrey

This *14* Day Of *July* 2003

KENNETH GREENWOOD
NOTARY PUBLIC
HONORABLE ENGALL AND FREEMAN



APOSTILLE

(Hague Convention of 5 October 1961 / Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

1. Country: United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays: Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

This public document / Le présent acte public

2. Has been signed by K Greenwood
a été signé par
3. Acting in the capacity of Notary Public
agissant en qualité de
4. Bears the seal/stamp of The Said Notary Public
est revêtu du sceau/timbre de

Certified/Attesté

5. at London/Londres
6. the/le 17 July 2003
7. by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal de Sa Majesté aux Affaires Etrangères et du Commonwealth.

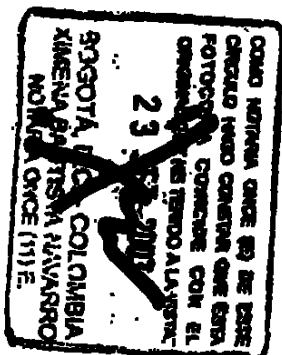
8. Number/sous No **G210435**

9. Stamp:
timbre:
10. Signature: R. Newden



For the Secretary of State / Pour le Secrétaire d'Etat

If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961,
it should be presented to the consular section of the mission representing that country.



6/8
285 298
284

EN EL BUREAU INTERNACIONAL
ENVIADO VIA FEDERAL EXPRESS

EN RE APLICACIÓN DE :
SOLICITUD INTERNACIONAL No.:
FECHA DE PRESENTACION INTERNACIONAL:
FECHA DE REIVINDICACION DE PRIORIDAD:

Pfizer Productos Inc. Et Al.
PCT/IB01/00375
Marzo 14 2001
Estados Unidos Serial No.
60/193,789 presentada el 31
de Marzo de 2000
NUEVOS DERIVADOS DE
PIPERAZINA
PC10770A/IXN

PARA:

Nuestra Ref:

WIPO
34 Chemin des Colombettes
1211 Geneva 20
Suiza

CORRECCION BAJO EL ARTICULO 19

Señor:

Según las estipulaciones del Artículo 19 del tratado de cooperación de patente, el aplicante(s) mediante la presente propone las siguientes páginas de reemplazo 65 a 77 por las páginas originalmente enviadas 65 a 80 de la solicitud internacional anteriormente identificada. Las páginas de reemplazo contienen las reivindicaciones 1 a 13 que ahora reemplazan las reivindicaciones originales 1 a 7. Subsecuentemente como resultado de la corrección las reivindicaciones y el resumen fueron movidos a diferentes páginas, las páginas de reemplazo para todas las páginas con las reivindicaciones y el resumen han sido enviadas.

Las páginas de reemplazo contienen las reivindicaciones 1 a 13 dirigidas a los compuestos de fórmula I (al igual que composiciones farmaceuticas y método de reivindicaciones de tratamiento usando dicho compuestos de fórmula I) lo cual reemplaza las reivindicaciones originales 1 a 7 dirigidas a un método de preparacion de compuestos de fórmula I. Las reivindicaciones dirigidas al método de preparacion de compuestos de fórmula I fueron inadvertidamente enviados a cambio de las reivindicaciones dirigidas a los compuestos mismos. El soporte de esta corrección puede ser encontrado en la especificación original enviada, reivindicaciones, y resumen de la aplicación presente, incluyendo, por ejemplo, las siguientes secciones de la especificación identificadas para cada una de las reivindicaciones citadas: reivindicacion 1-página 2, línea 11 a página 9, línea 26; reivindicacion 2-página 9 líneas 27-28; reivindicacion 3-página 9, líneas 29 a 33; reivindicacion 4-página 9, líneas 36-37 y página 10, líneas 5-6; reivindicacion 5-página 9, líneas 34-35, y página 10 , líneas 1-4; reivindicacion 6-página 10, líneas

286 615
281
240

9-26; reivindicacion 7-pagina 10, lineas 27-28; reivindicacion 8-pagina 10, linea 29 a pagina 13 , linea 3; reivindicacion 9-pagina 13, lineas 34-37; reivindicacion 10-pagina 15, linea 26 a pagina 16, linea 18; reivindicacion 11-pagina 16, lineas 19-24; reivindicacion 12-pagina 16, linea 25 a pagina 17, linea 11; y reivindicacion 13-pagina 17, lineas 12-16.

El informe de la búsqueda internacional de esta solicitud emitida en Mayo 15 del 2002, así esta correccion es oportunamente archivada.

Enviado respetuosamente,

Fecha _____

Grover F. Fuller Jr
Abogado del aplicante
Reg. No. 31,760

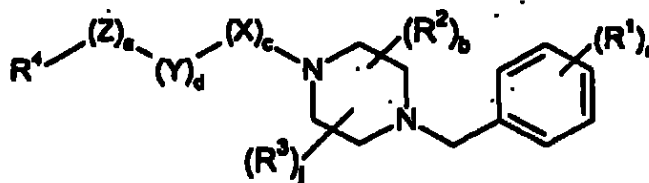
Pfizer Inc.
150 Est 42nd Street
Mail Stop 150/5/49
Nueva York, NY 10017-5755
(212) 573-1390

PC10770A

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula

5



una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; en la que

a es 1, 2, 3, 4 ó 5;

b es 0, 1, 2, 3 ó 4;

c es 0 ó 1;

d es 1, 2, 3, 4 ó 5;

e es 0 ó 1;

j es 1, 2, 3 ó 4;

X es C(O), C(S) o CH_2

Y es CH_2 , o si e es 0, Y es CHR^8 siendo R^8 hidrogeno, arilo (C_6-C_{10}) o NR^9R^{10} ;

Z es oxigeno, NR^9 o $CR^{11}R^{12}$;

cada R' esta seleccionado independientemente de hidrógeno, hidroxí, hidroxisulfonilo, halo, alquilo (C_1-C_6), mercapto, mercaptoalquilo (C_1-C_6), alquiltio (C_1-C_6), alquilsulfinilo (C_1-C_6), alquilsulfonilo (C_1-C_6),

579
288
293
249

alquiltio (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆); alquilsulfinil (C₁-C₆)
alquilo(C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀), haloalquilo(C₁-C₆),
trifluorometilo, formilo, formilalquilo(C₁-C₆), nitro,
nitroso, ciano, aril(C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi(C₁-
C₆), trifluorometoxi, cicloalquilo (C₃-C₇),
cicloalquilo(C₃-C₇)alquilo(C₁-C₆), hidroxicicloalquil (C₃-
C₇) alquilo (C₁-C₆), cicloalquilamino(C₃-C₇),
cicloalquilamino (C₃-C₇) alquilo(C₁-C₆),
((cicloalquil(C₃-C₇)) (alquil(C₁-C₆))amino,
(cicloalquil (C₃-C₇) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquilo(C₁-C₆),
cianoalquilo(C₁-C₆), alquenilo(C₂-C₇), alquinilo(C₂-C₇),
arilo(C₆-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
alquenilo(C₂-C₆), hidroxí alquilo(C₁-C₆), hidroxiaril C₆-
C₁₀)alquilo(C₁-C₆), hidroxialquiltio(C₁-C₆) alquilo(C₁-
C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆), hidroxialquinilo (C₂-C₆)
,alcoxi (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) arilo (C₆-
C₁₀) alquilo (C₁-C₆), ariloxi (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
arilo(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), amino,
alquilamino (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂amino, arilamino(C₆-
C₁₀), aril(C₆-C₁₀) alquilamino (C₁-C₆), aminoalquilo(C₁-C₆),
alquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), (alquilo(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆),hidroxialquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-
C₆), arilamino(C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆), arilo(C₆-C₁₀),

289 292 294

alquilamino(C₁- C₆)alquilo(C₁-C₆), alquilcarbonilamino
(C₁-C₆), (alquilcarbonil (C₁-C₆))(alquil(C₁-C₆))amino,
alquilcarbonilamino (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
(alquilcarbonil (C₁-C₆)) (alquil (C₁-C₆))aminoalquilo(C₁-
C₆), alcoxycarbonilamino (C₁-C₆), (alcoxycarbonil (C₁-C₆))
alquilamino (C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-
C₆), (alcoxi(C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
aminoalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcoxi(C₁-C₆) carbonilo,
aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)carbonila, alquil (C₁-
C₆)carbonilo, alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆),
aril(C₆-C₁₀)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)carbonilalquilo(C₁-C₆),
aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)carbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil
(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxialquilo(C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-
C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-10
C₆)carboniloxialquilo(C₁-C₆), aminocarbonilo, alquil(C₁-
C₆)aminocarb.onhlo, (alquil(C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril
(C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), amidino, guanidino, ureido,
alquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ ureido,

ureidoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-C₆),
 (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquilo (C₁-C₆),
 heterocicloalquilo (C₂-C₉) heteroarilo (C₂-C₉),
 heterocicloalquil (C₂-C₉) alquilo (C₁-C₆) y heteroaril (C₂-
 C₉) alquilo (C₁-C₆);
 cada R² y R³ se selecciona independientemente de oxo,
 halo, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-
 C₈) alquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₈) aminoalquilo (C₁-C₆),
 cicloalquil (C₃-C₈) alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
 haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆),
 arilo (C₆-C₁₀), aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
 alqueno (C₂-C₆), H-C (O) -, H-C (O) -- alquilo (C₁-C₆),
 hidroxialquilo (C₁-C₆), hidroxialqueno (C₂-C₆),
 hidroxialquino (C₂-C₆), hidroxiaril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
 hidroxicicloalquil (C₃-C₈) alquilo (C₁-C₆), tioalquilo (C₁-C₆)
 cianoalquilo (C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆)
 carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) aril (C₆-
 C₁₀) alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), ariloxi
 (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆)
 alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) tioalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
 C₆) sulfinilalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilalquilo
 (C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-C₆) tioalquilo (C₁-C₆),
 aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-
 C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)

291
6/2
24
248

aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), azidoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquil (C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)carbonilo, alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcoxi (C₁-C₅)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) aminocarbonilo, carboxialquilo (C₁-C₆), alóxi (C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)sulfonilo, heterocicloalquilo(C₂-C₉), heteroarilo(C₂-C₉),

292 ^{6/13}
293
296

heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-C₉)
alquilo (C₁-C₆) a R'⁴R¹⁵N-alquilo (C₁-C₆), siendo cada uno
de R¹⁴ y R¹⁵, independientemente, alquilo(C₁-C₆) a
alquil(C₁-C₆)carbonilo;

es (R⁵)f(R⁶)gario(C₆-C₁₀) , (R⁵)₁(R⁶)gcicloalquilo(C₃-C₁₀)
(R⁵)f(R⁷)heteroarilo(C₂-C₉) a (R⁵)f(R⁷)

heterocicloalquilo(C₂-C₉), 20 siendo f 1, 2, 3 0 4; y
siendo g y h independientemente 0, 1, 2 0 3;

R⁵ es de uno a tres grupos seleccionados

independientemente de heterocicloalquil (C₂-C₉) carbonilo,
heteroaril(C₂-C₉)carbonilo, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo,
alquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonila, (alquil
(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo, haloalquil(C₁-
C₆) aminocarbonilo, aminosulfonilalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilalquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
carbonilamino, cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)carbonilamino, .
(alquil (C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
aminocarbonilalquil (C₁-C₆)carbonilamino, heteroaril (C₂-
C₉)alquil(C₁-C₆)carbonilamino, heterocicloalquil(C₂-

293
294
295
296

C₉)alquil (C₁-C₆)carbonilamino, aminosulfonilálquil (C₁-C₆)carbonilamino, hidroxialquil (C₁-C₆)ureido, aminoalquil (C₁-C₆)ureido, alquil(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)ureido, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil(C₁-C₆)ureido, heteroaril(C₂-C₉) alquil(C₁-C₆)ureido, aminosulfonilalquil (C₁-C₆)ureido, aminocarbonilalquil (C₁-C₆)ureido, alquil(C₁-C₆)aminocarbonilalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂aminocarbonilalquil(C₁-C₆)ureido, acetilaminoalquil(C₁-C₆)ureido, (acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, acetilaminoalquil(C₁-C₆) sulfanilamino, (acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂cianoguanidinoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino, aminocarbonilalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino,

294 ~~6/5~~
24
~~28~~

aminosulfonilamino, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilamino,
(alquil (C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminocarbonilalquil
(C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,
heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilamino, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidino, alquil (C₁-
C₆)cianoguanidino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidino,
heterocicloalquil (C₂-C₉) cianoguanidino, heteroaril (C₂-
C₉)cianoguanidino, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-
C₆)cianoguanidino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
cianoguanidino, aminoalquil (C₁-C₆) cianoguanidino, alquil
(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil(C₁-
C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) cianoguanidino.,
aminocarbonilalquil (C₁-C₆)cianoguanidino, alquil (C₁-
C₆)aminocarbonilalquil (C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil
(C₁-C₆))₂aminocarbonilalquil(C₁-C₆) cianoguanidino,
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) amino, alquil (C₁-
C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)amino, alcoxi(C₁-C₆)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) amino, aminosulfonilalquil
(C₁-C₆)amino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)amiflo,
acetilaminoalquil(C₁-C₆)amino, (acetil) (alquil(C₁-C₆))
aminoalquil (C₁-C₆) amino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil
(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), cianoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),

295 16/16/ 296

acetilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo(C₁-C₆)
(acetil) (alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-
C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi(C₂-C₉)
carbonilaminoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),
heteroariloxi(C₂-C₉)carbonilaminoalquil(C₁-
C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil
(C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), alquil
(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),
ureidoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)
ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆)
aminocarboniloxialquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆) arninocarbonilalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-C₆),
aminosulfonilalquil(C₁-C₆)carbonilarninoalquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquiloxi(C₂-C₉)carbonilarninoalquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquil(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆)cianoguanidinoalquil(C₁-
C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-C₆)cianoalquil(C₁-

296 6177
381
307

C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminoalquil (C₁-5
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquilo (C₁-C₆)
(alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminocarbonilalquil
(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilamino-
alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) / alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-
C₆) / heterocicloalquiloxi (C₂- C₉) carbonilaminoalquil
(C₁ -C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteroariloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteracicloalquil (C₂-
C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil-
aminoalquilo (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo
(C₁-C₆) cianaguanidinoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆),
aminoalquil (C₁-C₆) sulfanilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil

297 ^{6/18}
302
201

(C₁-C₆)₂aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆),
acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo(C₁-
C₆), (acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil(C₁-C₆)
sulfonilaminalquilo(C₁-C₆), ureidoalquil(C₁-
C₆)sulfanilaminaalquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilarninoalquilo(C₁-C₆),
(alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilaminaalquilo(C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), cianoguanidinoalquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆) / alquil(C₁-C₆)
(cianoguanidino) alquil(C₁-C₆)sulfonilamino-
alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂(cianoguanidino)alquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquil(C₁-
C₆)sulfanilaminoalquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbonilamino-alquil(C₁-C₆)sulfonilaminaalquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)carbonilaminoalquil(C₁-
C₆)sulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), heteroariloxi(C₂-
C₉)carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-
C₆), aminosulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminosulfonil-aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminosulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), cianoguanidino-
alquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) (cianaguanidino)alquilo(C₁-
C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ (cianoguanidino)alquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆)

298

303

302

hete'rocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) -
alquilo (C₁-C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino)
amino, heteroaril (C₂-C₉) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆),
heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) (cianaguanidina)
alquilo (C₁-C₆) , aminoalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
alquilo (C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆)
(cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-C₆))₂
aminoalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquilo (C₁-
C₆) / aminocarbonilalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
alquilo (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆)
(cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-C₆))₂ -
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) ,
aminosulfonilo, alquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, (alquil (C₁-
C₆))₂ aminosulfonilo, heterocicloalquil (C₂-C₉) sulfonilo,
aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonila, (alquil (C₁-
C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, heteroaril (C₂-
C₉) aminosulfonila, hidroxialquil (C₁-C₆) aminosulfonilo,
alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminosulfonilo,
ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alcoxi (C₁-
C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonila,

299 ~~300~~
303

heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminosulfonilo, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) aminosulfonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆)
aminosulfonilo, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
aminosulfonilo, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-
C₆) aminosulfonilo, heterocicloalquil (C₂-C₉) aminosulfonilo,
R⁶ es de uno a tres grupos seleccionados
independientemente de hidrógeno, hidroxilo,
hidroxisulfonilo, halo, alquilo (C₁-C₆), mercapto,
mercaptoalquilo (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
sulfinilo, alquil (C₁-C₆) sulfonilo, aril (C₆-C₁₀)
sulfonilo, alquil (C₁-C₆) tioalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁-
C₆) sulfinilalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁-C₆)
sulfonilalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), hidroxialcoxi (C₁-
C₆), ariloxi (C₆-C₁₀), haloalquilo (C₁-C₆), trifluoroalquilo
(C₁-C₆), formilo, formilalquilo (C₁-C₆), nitro, nitroso,
ciano, aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆),
trifluoroalcoxi (C₁-C₆), aminoalcoxi (C₁-C₆), cicloalquilo
(C₃-C₁₀), cicloalquil (C₃-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
hidroxicicloalquil (C₃-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) / cicloalquil (C₃-
C₁₀) amino, cicloalquil (C₃-C₁₀) aminoalquilo (C₁-C₆),
cianoalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆),
arilo (C₆-C₁₀), aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) ~ aril (C₆-C₁₀)
alqueno (C₂-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), (hidroxilo) aril (C₆-

300 42
305
304

C₁₀)alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆)amino)aril(C₆-C₁₀)
alquilo(C₁-C₆), hidroxialquil(C₁-C₆)tioalquilo(C₁-C₆),
hidroxialquenilo(C₂-C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆),
hidroxialquinilo(C₂-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆)
,alcaxi(C₁-C₆)aril(C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆), ariloxialquila(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), amino,
alquil(C₁-C₆)amino, (alquil(C₁-C₆))₂amino, aril(C₆-C₁₀)
amino, aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)amino, aminoalquil(C₁-
C₆)amino, heterocicloalquil(C₂-C₉)amino, heteroaril
(C₂-C₉)amino, cicloalquil(C₃-C₁₀)(alquil(C₁-C₆))amino,
alquil(C₁-C₆)carbonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilamino,
alquenil(C₂-C₆)carbonilamino, cicloalquil(C₃-
C₁₀)carbonilamino, aril(C₆-C₁₀)carbonilamino,
heterocicloalquil(C₂-C₉)carbonilamino, halbalquil(C₁-
C₆)carbonilamino, alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-C₆)carbonilamino,
alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquil(C₁-C₆)carbonilamino, (alquil
(C₁-C₆)carbonil)(alquil(C₁-C₆))amino,
(alcoxi(C₁-C₆)carbonil)(alquil(C₁-C₆))amino, alquil(C₁-C₆)
sulfonilamino, aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂aminoalquilo(C₁-C₆),
hidroxialquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀)carbonilaminaalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-

301

6/22
306

205

C_6) carbonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6) ,
 cicloalquil(C_3-C_{10}) (alquil(C_1-C_6)) aminaalquilo(C_1-C_6) ,
 alcoxi(C_1-C_6) carbonilaminoalquilo(C_1-C_6) , alcoxi(C_1-C_6)
 carbonilalquil(C_1-C_6) carbonilaminoalquilo(C_1-C_6) ,
 (alcoxi(C_1-C_6) carbonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6) ,
 alquil(C_1-C_6) sulfonilaminoalquilo(C_1-C_6) , (alquil(C_1-C_6) sulfonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6) , aril(C_6-C_{10}) sulfonilaminoalquilo(C_1-C_6) , (aril(C_6-C_{10}) sulfonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6) ,
 heterocicloalquil(C_2-C_9) aminoalquilo(C_1-C_6) , heteroaril(C_2-C_9) aminoalquilo(C_1-C_6) , alcoxi(C_1-C_6) carbonilo , aril(C_6-C_{10}) alcaxi(C_1-C_6) carbonila , alquil(C_1-C_6) carbonilo ,
 aril(C_6-C_{10}) carbonilo , aril(C_6-C_{10}) alquil(C_1-C_6) carbonila ,
 hidroxialcoxi(C_1-C_6) carbonilo , alcoxi(C_1-C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6) , aril(C_6-C_{10}) alcaxi(C_1-C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6) , alcoxi(C_1-C_6) alquil(C_1-C_6) carbonilaxialquilo(C_1-C_6) , (alquil(C_1-C_6))₂ aminocarbonilaxialquilo(C_1-C_6) , alquil(C_1-C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6) , aril(C_6-C_{10}) carbonilalquilo(C_1-C_6) , aril(C_6-C_{10}) alquil(C_1-C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6) ,
 aminocarbonilo , alquil(C_1-C_6) aminocarbonilo , (alquil(C_1-C_6))₂ aminocarbonilo , aril(C_6-C_{10}) aminocarbonilo , aril(C_6-C_{10}) alquil(C_1-C_6) aminocarbonilo , (aminocarbonilalquil(C_1-C_6)) aminocarbonilo , alquil(C_1-C_6) aminocarbonilalquil(C_1-C_6)

5/23
302 287
256

C₆)aminocarbonilo, alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquil(C₁-
C₆)aminocarbonila, (aminoalquil(C₁-C₆))aminocarbonilo,
hidroxialquil (C₁-C₆)aminocarbonilo,
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), amidino, hidroxiamidino,
guanidino, ureido, alquil (C₁-C₆)ureido, aril (C₆-
C₁₀)ureido, (aril(C₆-C₁₀))₂ureido, aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-
C₆)ureida, haloalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))
(aril(C₆-C₁₀))ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ ureido, haloalquil(C₁-
C₆)carbonilureido, ureidoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquila(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀) ureidoalquilo (C₁-C₆), (aril(C₆-
C₁₀))₂ureidoalquilo(C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
ureidoalquila(C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo(C₁-
C₆), (haloalquil(C₁-C₆)) (alquil(C₁-C₆))ureidoalquilo(C₁-
C₆), (alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquil(C₁-
C₆))ureidoalquilo(C₁-C₆), glicinamido, alquil(C₁-C₆)
glicinamido, aminocarbonilglicinamido, alcoxi(C₁-C₆)
alquil (C₁-C₆)carbonilglicinamida, (aminocarbon-il)
(alquil (C₁-5 C₆))glicinamido, (alcoxi(C₁-
C₆)carbonilalquil(C₆-C₁₀) carbonil) (alquil(C₁-

6/24
303
~~307~~

C_6)glicinamido, (alcoxi(C_1-C_6)carbonilaminoalquil (C_1-C_6)carbonil)glicinamido, aril (C_6-C_{10})
 carbonilglicinamido, (aril (C_6-C_{10})carbonil) (alquil (C_1-C_6)) glicinamido, (aril (C_6-C_{10})alquil (C_1-C_6)aminocarbonil) -10 glicinamido, aril(C_6-C_{10})alquil(C_1-C_6)aminocarbonil) ((alquil(C_1-C_6))glicinamido, aril(C_6-C_{10})aminocarbonilglicinamido, (aril(C_6-C_{10})aminocarbonil) (alquil(C_1-C_6))glicinamido,
 glicinamidoalquilo(C_1-C_6), alaninamido, alquil(C_1-C_6)alaninamido, alaninamidoalquilo(C_1-C_6), heteroarilo(C_2-C_9), heterocicloalquilo (C_2-C_9), heteroaril (C_2-C_9) alquilo (C_1-C_6) y heterocicloalquil (C_2-C_9) alquilo (C_1-C_6);
 R^7 es de uno a tres grupos seleccionados
 independientemente de hidrógeno, hidroxilo, halo,
 alquilo(C_1-C_6) , alquil (C_1-C_6) sulfonilo, aril (C_6-C_{10}) sulfonilo, alcoxi (C_1-C_6), hidroxialcoxi(C_1-C_6), haloalquilo(C_1-C_6), formilo, nitro, ciano, haloalcoxi(C_1-C_6), alquenilo(C_2-C_6), alquínilo(C_2-C_6), arilo(C_6-C_{10}) / aril(C_6-C_{10})alquilo(C_1-C_6), amino, alquil(C_1-C_6) amino, (alquil (C_1-C_6))₂amino, aril (C_6-C_{10})amino, aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6)amino, alquil (C_1-C_6) carbonilamino, alcoxi (C_1-C_6) carbonilamino, alquenil(C_2-C_6)carbonilamino, cicloalquilcarbonilamino, aril(C_6-C_{10})carbonilamino, haloalquil(C_1-C_6)carbonilamino, alcoxi(C_1-C_6)alquil(C_1-

304

6/25
304
28

C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbanilalquil (C₁-C₆)
carbonilamino, (alquil (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
amino, (alcoxi (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆)) amino,
alquil (C₁-C₆) sulfonilarnino, aminoalquilo (C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
carbonilaminaalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-10 C₆) carbonil)
(alquil (C₁-C₆)) aminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilo,
aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆) carbonilo, alquil (C₁-
C₆) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-
C₆) carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo,
(alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), guanidino, ureido,
alquil (C₁-C₆) ureido, ureidoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
ureidoalquilo (C₁-C₆) y glicinamida; cada uno de R⁹ y se
selecciona independientemente del grupo compuesto par
hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₀), aril (C₆-
C₁₀) alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) carbanila, alquil (C₁-
C₆) carbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-

305 6/26
304

C₆) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilalquilo (C₁-C₆), aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilo y. alcoxi (C₁-C₆) carbonilo; y cada una de R¹ y R¹² se selecciona independientemente del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₀) aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆), hidroxilo, alcoxi (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), amino, alquil (C₁-C₆) amino, (alquil (C₁-C₆))₂ amino, . alquil (C₁-C₆) carbonilamino, cicloalquil (C₃-C₈) carbonilamino, cicloalquil (C₃-C₈) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbanilamino, alquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aril (C₆-C₁₀) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) carbonilamina, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, (aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆)) amino, alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₈) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbanilaminoalquilo (C₁-C₆), heterociclaalquil (C₂-C₉) carbonilaminaalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteroaril (C₂-C₉) carbanilaminoalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) sulfonilamino, 20 alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminocarbanilamino, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilamina, haloalquil (C₁-C₆)

306 627
310

aminocarbonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilamino,
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆) ., alquil(C₁-C₆)
aminocarbanilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆) , haloalquil(C₁- C₆)
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆)/aminoalquilo(C₁-C₆) ,
alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆), carbaxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbanilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) y
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquilo(C₁-C₆) .

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R¹ es hidrogeno, halo, ciano, nitro,
trifluorometilo, trifluorometoxi, alquilo C₁-C₆,
hidraxi o alquilcarboniloxi(C₁-C₆) .

3. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde cada uno de R² y R³ están seleccionados cada uno
independientemente de alquilo(C₁-C₆), ciclaalquilo(C₃-C₈),
aminoalquilo(C₁-C₆), aminocicloalquilo(C₃-C₈), alquil(C₁-
C₆)aminaalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminocicloalquilo (C₃-
C₈), hidroxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)
carbonilaminoalquil(C₁-C₆), ureidoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-
C₉)alquilo(C₁-C₆) o heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆) .

307 6/20
32
371

4. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 2; Y es etileno y e es 0.

5. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1 ó 2; Y es CH₂ ó etileno; e es 1; y Z es oxígeno o NR⁹, en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo C₁-C₆.

6. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1; Y es CHR⁸ en donde R⁸ es NR⁹R¹⁰, R⁹ y R¹⁰ es cada uno independientemente hidrogeno, alquilo(C₁-C₆) ó alquilcarbonilo(C₁-C₆); e es 1; y Z se selecciona del grupo formado por oxígeno; CR¹¹R¹² en donde R¹¹ y R¹² son hidrógeno, y NR⁹ en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo(C₁-C₆).

7. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde R⁴ es (R⁵)_f(R⁶)_g arilo(C₆-C₁₀) ó (R⁵)_f(R⁷)_h heteroarilo(C₂-C₉), en donde f, g y h son independientemente 1 ó 2.

8. Un compuesto según la reivindicación 1, en

6/29
3/5
3/2

308

donde R⁵ se selecciona del grupo formado por heterocicloalquilcarbonilo (C₂-C₉), heteroarilcarbonilo (C₂-C₉), heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbanilo, heteracicloalquilo (C₂-C₉) alquilaminocarbanilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilamino alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, ureidoalquil (C₁-C₆) aminocarbanilo, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂ uridoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminosulfonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilamino, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminoalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) ureido, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) ureido, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, acetilaminoalquil (C₁-C₆) ureido, (acetil)

6/30

3/4

309

3/5

(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)ureido, aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, acetilaminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (acetil)(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminocarbonilalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminosulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminosulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, heterocicloalquiloxi(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilominoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) aminoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquil

310

6/31
3/5
~~2/7~~

(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil(C₁-
C₆), alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroariloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-
C₆), heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),heteroaril(C₂-C₉)
alquil(C₁-C₆)aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
ureidoalquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆), (alquil(C₁-
C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆),
cianoguanidinoal quil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆),
aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆),alquil (C₁-C₆)
aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆) (alquil(C₁-
C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆) ,
acetilaminoalquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆),
(acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil(C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil(C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)ureidoalquil (C₁-
C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-

311

6/32
316
215

C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) alquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
(cianoguanidino) alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), aminosulfonilaminoalquil (C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆) aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
(alquil (C₁-C₆))₂ aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) sulfonilo, aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, heteroaril (C₂-C₉) aminosulfonil,
ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil
(C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroariloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,

6/33
312
~~312~~
~~316~~

aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroaril
(C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heterocicloalquil (C₂-
C₉) aminosulfonil, haloalquil (C₁-C₆) aminocarbonil,
hidroxialquil (C₁-C₆) ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,
alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆)
hidroxialquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-
C₆))₂ aminosulfonil, hidroxialquil (C₁-C₆) aminosulfonil y
alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil.

9. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente halo,
halo(alquil C₁-C₆), alquil (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆),
trifluorometil, trifluorometoxi, hidroxil, aminocarbonil,
ciano, ureido, alquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alcoxi (C₁-C₆)
carbonilamino o glicinamino.

10. Una composición farmacéutica para tratar o
prevenir un trastorno o afección seleccionado de
enfermedades auto inmunes, artritis reumatoide, diabetes
de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad
inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis,

313

8/34
~~28~~
~~319~~

esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas, osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en adultos, síndrome del distrés respiratorio en la infancia, lesión. por reperfusión isquémica, glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis atópica, inflamación asociada con infección, inflamación viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes, aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de un receptor común), y enfermedades granulomatosas, sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como consecuencia de la reducción de la infiltración celular; tratar enfermedades y/o insuficiencia cardíaca congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar efisema pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2, VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las secuelas asociadas con una infección, cuando dicha infección induce la producción de citacinas inflamatorias

6/35
~~3/4~~
~~3/4~~

3/4

perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

11. Una composición farmacéutica para el tratamiento o prevención de un trastorno ó afección que puede tratarse o prevenirse mediante la inhibición de la unión de quimiocinas al receptor CCR1 en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

12. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección seleccionado de enfermedades

6/36/
32
315

autoinmunes, artritis reumatoide, diabetes de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis, esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas, osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en adultos, síndrome del distrés respiratorio en la infancia, lesión. por reperfusión isquémica, glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis atópica, inflamación asociada con infección, inflamación viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes, aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de un receptor común), y enfermedades granulomatosas, sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como consecuencia de la reducción de la infiltración celular; tratar enfermedades y/o insuficiencia cardíaca congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar efisema pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2, VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del

6/37
321
300

316

Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las secuelas asociadas con una infección, cuando dicha infección induce la producción de citocinas inflamatorias perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.

13. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección que se puede tratar o prevenir antagonizando el receptor CCR1 en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.

6/38
3228
317

EN LA OFICINA EUROPEA DE PATENTES

ENVIADO VIA FEDERAL EXPRESS

**EN RE APLICACIÓN DE :
SOLICITUD INTERNACIONAL No.:
FECHA DE PRESENTACION INTERNACIONAL:
FECHA DE REIVINDICACION DE PRIORIDAD:**

**Pfizer Productos Inc. Et Al.
PCT/IB01/00376
Marzo 14 2001
Estados Unidos Serial No.
60/193,789 presentada el 31
de Marzo de 2000
NUEVOS DERIVADOS DE
PIPERAZINA
PC10770A/IXN**

PARA:

Nuestra Ref:

**Oficina Europea de Patente
Patentlaan 2
Postbus 58 18
NL-2280 HV Rijswijk
Holanda**

CORRECCION BAJO EL ARTICULO 34

Señor:

Según las estipulaciones del Artículo 34 del Tratado de Cooperación de Patente, el solicitante(s) mediante la presente propone las páginas de reemplazo adjuntas 65 a 77 por las páginas originalmente enviadas 65 a 80 de la aplicación internacional anteriormente identificada. Las páginas de reemplazo contienen las reivindicaciones 1 a 13 que ahora reemplazan las reivindicaciones originales 1 a 7. subsecuentemente como resultado de la correccion las reivindicaciones y el resumen fueron movidos a diferentes páginas, las páginas de reemplazo para todas las páginas con las reivindicaciones y el resumen han sido enviadas.

Las páginas de reemplazo contienen las reivindicaciones 1 a 13 dirigidas a los compuestos de formula I (al igual que composiciones farmaceuticas y método de reivindicaciones de tratamiento usando dicho compuestos de formula I) lo cual reemplaza las reivindicaciones originales 1 a 7 dirigidas a un método de preparacion de compuestos de formula I. Las reivindicaciones dirigidas al método de preparación de compuestos de formula I fueron inadvertidamente enviados a cambio de las reivindicaciones dirigidas a los compuestos mismos. El soporte de esta correccion puede se encontrado en la especificacion original enviada, reivindicaciones, y resumen de la aplicación presente, incluyendo, por ejemplo, las siguientes secciones de la especificacion identificadas para cada una de las

6/39
323
~~322~~

318

reivindicaciones citadas: reivindicacion 1-pagina 2, linea 11 a pagina 9, linea 28; reivindicacion 2-pagina 9 lineas 27-28; reivindicacion 3-pagina 9, lineas 29 a 33; reivindicacion 4-pagina 9, lineas 36-37 y pagina 10, lineas 5-6; reivindicacion 5-pagina 9, lineas 34-35, y pagina 10, lineas 1-4; reivindicacion 6-pagina 10, lineas 9-26; reivindicacion 7-pagina 10, lineas 27-28; reivindicacion 8-pagina 10, linea 29 a pagina 13, linea 3; reivindicacion 9-pagina 13, lineas 34-37; reivindicacion 10-pagina 15, linea 26 a pagina 16, linea 18; reivindicacion 11-pagina 16, lineas 19-24; reivindicacion 12-pagina 16, linea 25 a pagina 17, linea 11; y reivindicacion 13-pagina 17, lineas 12-16.

Enviado respetuosamente,

Fecha _____

Grover F. Fuller Jr
Abogado del solicitante
Reg. No. 31,760

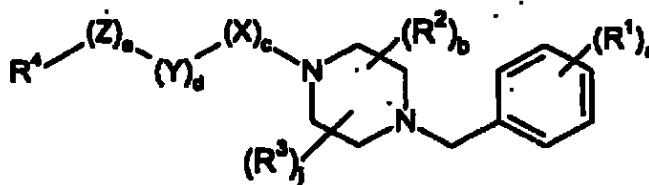
Pfizer Inc.
150 East 42nd Street
Mail Stop 150/5/49
Nueva York, NY 10017-5755
(212) 573-1390

PC10770A

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula

5



una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; en la que

a es 1, 2, 3, 4 ó 5;

b es 0, 1, 2, 3 ó 4;

c es 0 ó 1;

d es 1, 2, 3, 4 ó 5;

e es 0 ó 1;

j es 1, 2, 3 ó 4;

X es C(O), C(S) o CH₂

Y es CH₂, o si e es 0, Y es CHR⁸ siendo R⁸ hidrogeno, arilo (C₆-C₁₀) o NR⁹R¹⁰;

Z es oxigeno, NR⁹ o CR¹¹R¹²;

cada R' esta seleccionado independientemente de hidrógeno, hidroxí, hidroxisulfonilo, halo, alquilo(C₁-C₆), mercapto, mercaptoalquilo(C₁-C₆), alquiltio(C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆),

6/4/1
320
325
324

alquiltio (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆); alquilsulfinil (C₁-C₆)
alquilo(C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀), haloalquilo(C₁-C₆),
trifluorometilo, formilo, formilalquilo(C₁-C₆), nitro,
nitroso, ciano, aril(C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi(C₁-
C₆), trifluorometoxi, cicloalquilo (C₃-C₇),
cicloalquilo(C₃-C₇)alquilo(C₁-C₆), hidroxicicloalquil (C₃-
C₇) alquilo (C₁-C₆), cicloalquilamino(C₃-C₇),
cicloalquilamino (C₃-C₇) alquilo(C₁-C₆),
((cicloalquil(C₃-C₇)) (alquil(C₁-C₆))amino,
(cicloalquil (C₃-C₇) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquilo(C₁-C₆),
cianoalquilo(C₁-C₆), alquenilo(C₂-C₇), alquinilo(C₂-C₇),
arilo(C₆-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
alquenilo(C₂-C₆), hidroxí alquilo(C₁-C₆), hidroxiaril C₆-
C₁₀)alquilo(C₁-C₆), hidroxialquiltio(C₁-C₆) alquilo(C₁-
C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆), hidroxialquinilo (C₂-C₆)
,alcoxi (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) arilo (C₆-
C₁₀) alquilo (C₁-C₆), ariloxi (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
arilo(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), amino,
alquilamino (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂amino, arilamino(C₆-
C₁₀), aril(C₆-C₁₀) alquilamino (C₁-C₆), aminoalquilo(C₁-C₆),
alquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), (alquilo(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆),hidroxialquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-
C₆), arilamino(C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆), arilo(C₆-C₁₀),

321

6/42
320
325

alquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), alquilcarbonilamino
(C₁-C₆), (alquilcarbonil (C₁-C₆))(alquil(C₁-C₆))amino,
alquilcarbonilamino (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
(alquilcarbonil (C₁-C₆))(alquil (C₁-C₆))aminoalquilo(C₁-
C₆), alcoxycarbonilamino (C₁-C₆), (alcoxycarbonil (C₁-C₆))
alquilamino (C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-
C₆), (alcoxi(C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
aminoalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcoxi(C₁-C₆) carbonilo,
aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)carbonila, alquil (C₁-
C₆)carbonilo, alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆),
aril(C₆-C₁₀)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)carbonilalquilo(C₁-C₆),
aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)carbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil
(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxialquilo(C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-
C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-10
C₆)carboniloxialquilo(C₁-C₆), aminocarbonilo, alquil(C₁-
C₆)aminocarb.onhlo, (alquil(C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril
(C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), amidino, guanidino, ureido,
alquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ ureido,

ureidoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆),
 (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquilo(C₁-C₆),
 heterocicloalquilo(C₂-C₉) heteroarilo(C₂-C₉),
 heterocicloalquil (C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆) y heteroaril (C₂-
 C₉) alquilo (C₁-C₆);
 cada R² y R³ se selecciona independientemente de oxo,
 halo, alquilo(C₁-C₆), cicloalquilo(C₃-C₈), cicloalquil(C₃-
 C₈)alquilo(C₁-C₆), cicloalquil(C₃-C₈)aminoalquilo(C₁-C₆)
 cicloalquil(C₃-C₈)alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),
 haloalquilo(C₁-C₆), alqueno(C₂-C₆), alquinilo(C₂-C₆),
 arilo (C₆-C₁₀) , aril (C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)
 alqueno (C₂-C₆) , H-C (0) -, H-C (0) --alquilo (C₁-C₆),
 hidroxialquilo(C₁-C₆), hidroxialqueno(C₂-C₆),
 hidroxialquino(C₂-C₆), hidroxiaril (C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆),
 hidroxicicloalquil(C₃-C₈)alquilo(C₁-C₆), tioalquilo(C₁-C₆)
 cianoalquilo(C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆)
 carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)aril(C₆-
 C₁₀)alquilo(C₁-C₆) , alcoxi(C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆) , ariloxi
 (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)
 alquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)tioalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
 C₆)sulfinilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) sulfonilalquilo
 (C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-C₆) tioalquilo(C₁-C₆),
 aminoalquilo (C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-
 C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)

6/44
323
~~323~~

323

aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), azidoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquil (C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)carbonilo, alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcoxi (C₁-C₅)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) aminocarbonilo, carboxialquilo (C₁-C₆), alóxi (C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆) aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)sulfonilo, heterocicloalquilo(C₂-C₉), heteroarilo(C₂-C₉),

324

6/45
~~821~~
~~228~~

heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-C₉)
 alquilo (C₁-C₆) a R'⁴R¹⁵N-alquilo (C₁-C₆), siendo cada uno
 de R¹⁴ y R¹⁵, independientemente, alquilo(C₁-C₆) a
 alquil(C₁-C₆)carbonilo;
 es (R⁵)f(R⁶)gario(C₆-C₁₀) , (R⁵)₁(R⁶)gcicloalquilo(C₃-C₁₀)
 (R⁵)f(R⁷)heteroarilo(C₂-C₉) a (R⁵)f(R⁷)
 heterocicloalquilo(C₂-C₉), 20 siendo f 1, 2, 3 0 4; y
 siendo g y h independientemente 0, 1, 2 0 3;
 R⁵ es de uno a tres grupos seleccionados
 independientemente de heterocicloalquil (C₂-C₉) carbonilo,
 heteroaril(C₂-C₉)carbonilo, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
 aminocarbonilo, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
 aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
 aminocarbonilo, ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo,
 alquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonila, (alquil
 (C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo, haloalquil(C₁-
 C₆) aminocarbonilo, aminosulfonilalquil (C₁-C₆)
 aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilalquil(C₁-C₆)
 aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
 carbonilamino, cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
 alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)carbonilamino, .
 (alquil (C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
 aminocarbonilalquil (C₁-C₆)carbonilamino, heteroaril (C₂-
 C₉)alquil(C₁-C₆)carbonilamino, heterocicloalquil(C₂-

6/46
35
32A

325

C₉)alquil (C₁-C₆)carbonilamino, aminosulfonilálquil (C₁-C₆)carbonilamino, hidroxialquil (C₁-C₆)ureido, aminoalquil (C₁-C₆)ureido, alquil(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)ureido, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil(C₁-C₆)ureido, heteroaril(C₂-C₉) alquil(C₁-C₆)ureido, aminosulfonilalquil (C₁-C₆)ureido, aminocarbonilalquil (C₁-C₆)ureido, alquil(C₁-C₆)aminocarbonilalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂aminocarbonilalquil(C₁-C₆)ureido, acetilaminoalquil(C₁-C₆)ureido, (acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, acetilaminoalquil(C₁-C₆) sulfanilamino, (acetil) (alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminocarbonilalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino,

6/47
351
330

326

aminosulfonilamino, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilamino,
(alquil (C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminacarbonilalquil
(C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,
heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilamino, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidino, alquil (C₁-
C₆)cianoguanidino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidino,
heterocicloalquil (C₂-C₉) cianoguanidino, heteroaril (C₂-
C₉)cianoguanidino, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-
C₆)cianoguanidino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
cianoguanidino, aminoalquil (C₁-C₆) cianoguanidino, alquil
(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil(C₁-
C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) cianoguanidino.,
aminocarbanilalquil (C₁-C₆)cianoguanidino, alquil (C₁-
C₆)aminocarbonilalquil (C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil
(C₁-C₆))₂aminocarbonilalquil(C₁-C₆) cianoguanidino,
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) amino, alquil (C₁-
C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)amino, alcoxi(C₁-C₆)
carboniláminoalquil (C₁-C₆) amino, aminosulfonilalquil
(C₁-C₆)amino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)amiflo,
acetilaminoalquil(C₁-C₆)amino, (acetil) (alquil(C₁-C₆))
aminoalquil (C₁-C₆) amino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil
(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), cianoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),

6/48
332
335

327

acetilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆)
(acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-
C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil
(C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), alquil
(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆)
aminocarboniloxialquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
aminosulfonilalquil (C₁-C₆) carbonilarninoalquilo (C₁-C₆),
heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilarninoalquilo (C₁-C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-
C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) cianoalquil (C₁-

6/49

338

305

338

C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminoalquil (C₁-5
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquilo (C₁-C₆)
(alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminocarbonilalquil
(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilamino-
alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) / alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-
C₆) / heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteroariloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heterocicloalquil (C₂-
C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil-
aminoalquilo (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo
(C₁-C₆) cianaguanidinoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆),
aminoalquil (C₁-C₆) sulfanilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil

329

6/50
234
555

(C₁-C₆)₂aminoalquil (C₁-C₆)sulfonila.minoalquilo(C₁-C₆),
 acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquila(C₁-
 C₆), (acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)
 sulfonilaminalquila (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-
 C₆)sulfanilaminaalquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-
 C₆)ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilarninoalquilo(C₁-C₆),
 (alquil (C₁-C₆))₂ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminaalquila (C₁-
 C₆), alquil (C₁-C₆)sulfonilaminoalquil (C₁-C₆)
 sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), cianoguanidinoalquil (C₁-
 C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆) / alquil (C₁-C₆)
 (cianoguanidino) alquil (C₁-C₆)sulfonilamino-
 alquilo(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂(cianoguanidino)alquil (C₁-
 C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquil (C₁-
 C₆)sulfanilaminoalquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
 carbonilamino-alquil (C₁-C₆)sulfonilaminaalquilo(C₁-C₆),
 heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-
 C₆)sulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), heteroariloxi (C₂-
 C₉)carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-
 C₆), aminosulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
 aminosulfonil-aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
 aminosulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), cianoguanidino-
 alquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) (cianaguanidino)alquilo(C₁-
 C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ (cianoguanidino)alquilo(C₁--C₆),
 heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆)

hete'rocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)-
 alquilo (C₁-C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino)
 amino, heteroaril (C₂-C₉) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆),
 heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) (cianaguanidina)
 alquilo (C₁-C₆) , aminoalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
 alquilo (C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆)
 (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-C₆))₂
 aminoalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquilo (C₁-
 C₆) / aminocarbonilalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
 alquilo (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆)
 (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-C₆))₂-
 aminocarbonilalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆) ,
 aminosulfonilo, alquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, (alquil (C₁-
 C₆))₂ aminosulfonilo, heterocicloalquil (C₂-C₉) sulfonilo,
 aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
 C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonila, (alquil (C₁-
 C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, heteroaril (C₂-
 C₉) aminosulfonila, hidroxialquil (C₁-C₆) aminosulfonilo,
 alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminosulfonilo,
 ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
 C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, (alquil (C₁-
 C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alquil (C₁-
 C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonilo, alcoxi (C₁-
 C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonila,

heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
 aminosulfonilo, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
 (C₁-C₆) aminosulfonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆)
 aminosulfonilo, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
 aminosulfonilo, heteroaril (C₂-C₉)alquil (C₁-
 C₆) aminosulfonilo, heterocicloalquil (C₂-C₉) aminosulfonilo,
 R⁶ es de uno a tres grupos seleccionados
 independientemente de hidrógeno, hidróxido,
 hidroxisulfonilo, halo, alquilo (C₁-C₆), mercapto,
 mercaptoalquilo (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆)
 sulfinilo, alquil (C₁-C₆) sulfonilo, aril (C₆-C₁₀)
 sulfonilo, alquil (C₁-C₆) tioalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁-
 C₆) sulfinilalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁-C₆)
 sulfonilalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), hidroxialcoxi (C₁-
 C₆), ariloxi (C₆-C₁₀), haloalquilo (C₁-C₆), trifluoroalquilo
 (C₁-C₆), formilo, formilalquilo (C₁-C₆), nitro, nitroso,
 ciano, aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆),
 trifluoroalcoxi (C₁-C₆), aminoalcoxi (C₁-C₆) , cicloalquilo
 (C₃-C₁₀), cicloalquil (C₃-C₁₀)alquilo (C₁-C₆),
 hidroxicicloalquil (C₃-C₁₀)alquilo (C₁-C₆) / cicloalquil (C₃-
 C₁₀) amino, cicloalquil (C₃-C₁₀) aminoalquilo (C₁-C₆),
 cianoalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆),
 arilo (C₆-C₁₀) , aril (C₆-C₁₀)alquilo (C₁-C₆) ~ aril (C₆-C₁₀)
 alqueno (C₂-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), (hidróxido)aril (C₆-

332

226

C_{10})alquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6)amino)aril(C_6-C_{10})
 alquilo(C_1-C_6), hidroxialquil(C_1-C_6)tioalquilo(C_1-C_6),
 hidroxialquenilo(C_2-C_6), hidroxialquenilo(C_2-C_6),
 hidroxialquinilo(C_2-C_6), alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6)
 ,alcaxi(C_1-C_6)aril(C_6-C_{10})alquilo(C_1-C_6), ariloxialquila(C_1-
 C_6), aril(C_6-C_{10})alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1- C_6), amino,
 alquil(C_1-C_6)amino, (alquil(C_1-C_6))₂amino, aril(C_6-C_{10})
 amino, aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6) amino, aminoalquil (C_1-
 C_6) amino, heterocicloalquil (C_2-C_9) amino, heteroaril
 (C_2-C_9)amino, cicloalquil(C_3-C_{10}) (alquil(C_1-C_6))amino,
 alquil(C_1-C_6) carbonilamino, alcoxi (C_1-C_6) carbonilamino,
 alquenil (C_2-C_6)carbonilamino, cicloalquil (C_3-
 C_{10})carbonilamino, aril (C_6-C_{10}) carbonilamino,
 heterocicloalquil (C_2-C_9)carbonilamino, halbalquil(C_1-
 C_6)carbonilamino, alcoxi(C_1-C_6)alquil(C_1-C_6)carbonilamino,
 alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquil(C_1-C_6)carbonilamino, (alquil
 (C_1-C_6)carbonil) (alquil (C_1-C_6))amino,
 (alcoxi(C_1-C_6)carbonil) (alquil(C_1-C_6))amino, alquil(C_1-C_6)
 sulfonilamino, aminoalquilo (C_1-C_6) , alquil (C_1-
 C_6)aminoalquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6))₂aminoalquilo(C_1-C_6),
 hidroxialquil(C_1-C_6)aminoalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10})
 aminoalquilo (C_1-C_6), aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6)
 aminoalquilo (C_1-C_6), alquil(C_1-C_6)carbonhlaminoalquilo(C_1-
 C_6), aril(C_6-C_{10})carbonilaminaalquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-

333

~~337~~

C_6) carbonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6) ,
 cicloalquil(C_3-C_{10}) (alquil(C_1-C_6)) aminaalquilo(C_1-C_6),
 alcoxi(C_1-C_6) carbonilaminoalquilo(C_1-C_6), alcoxi(C_1-C_6)
 carbonilalquil(C_1-C_6) carbonilaminoalquilo(C_1-C_6),
 (alcoxi(C_1-C_6) carbonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6),
 alquil(C_1-C_6) sulfonilaminoalquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6)
 C_6) sulfonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10})
 C_{10}) sulfonilaminoalquilo(C_1-C_6), (aril(C_6-C_{10})
 sulfonil) (alquil(C_1-C_6)) aminoalquilo(C_1-C_6),
 heterocicloalquil(C_2-C_9) aminoalquilo(C_1-C_6), heteroaril(C_2-C_9)
 aminoalquilo(C_1-C_6), alcoxi(C_1-C_6) carbonilo, aril(C_6-C_{10})
 alcaxi(C_1-C_6) carbonila, alquil(C_1-C_6) carbonilo,
 aril(C_6-C_{10}) carbonilo, aril(C_6-C_{10}) alquil(C_1-C_6) carbonila,
 hidroxialcoxi(C_1-C_6) carbonilo, alcoxi(C_1-C_6)
 carbonilalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10}) alcoxi(C_1-C_6)
 C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6), alcoxi(C_1-C_6) alquil(C_1-C_6)
 C_6) carbonilaxialquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6))₂
 aminocarbonilaxialquilo(C_1-C_6), alquil(C_1-C_6)
 carbonilalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10}) carbonilalquilo(C_1-C_6),
 aril(C_6-C_{10}) alquil(C_1-C_6) carbonilalquilo(C_1-C_6),
 aminocarbonilo, alquil(C_1-C_6) aminocarbonilo, (alquil(C_1-C_6))₂
 aminocarbonilo, aril(C_6-C_{10}) aminocarbonilo, aril(C_6-C_{10})
 alquil(C_1-C_6) aminocarbonilo, (aminocarbonilalquil(C_1-C_6))
 C_6) aminocarbonilo, alquil(C_1-C_6) aminocarbonilalquil(C_1-C_6)

334

~~338~~

C_6)aminocarbonilo, alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquil(C_1-C_6)aminocarbonilo, (aminoalquil(C_1-C_6))aminocarbonilo, hidroxialquil (C_1-C_6)aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo(C_1-C_6), alquil (C_1-C_6) aminocarbonilalquilo (C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6))₂ aminocarbonilalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10}) aminocarbonilalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10})alquil(C_1-C_6) aminocarbonilalquilo (C_1-C_6), amidino, hidroxiamidino, guanidino, ureido, alquil (C_1-C_6)ureido, aril (C_6-C_{10})ureido, (aril(C_6-C_{10}))₂ureido, aril(C_6-C_{10})alquil(C_1-C_6)ureida, haloalquil(C_1-C_6)ureido, (alquil(C_1-C_6)) (aril(C_6-C_{10}))ureido, (alquil(C_1-C_6))₂ ureido, haloalquil(C_1-C_6)carbonilureido, ureidoalquilo(C_1-C_6), alquil(C_1-C_6)ureidoalquilo(C_1-C_6), (alquil(C_1-C_6))₂ureidoalquilo(C_1-C_6), aril(C_6-C_{10}) ureidoalquilo (C_1-C_6), (aril(C_6-C_{10}))₂ureidoalquilo(C_1-C_6), aril (C_6-C_{10})alquil(C_1-C_6) ureidoalquilo(C_1-C_6), haloalquil (C_1-C_6) ureidoalquilo(C_1-C_6), (haloalquil(C_1-C_6)) (alquil(C_1-C_6))ureidoalquilo(C_1-C_6), (alcoxi(C_1-C_6) carbonilalquil(C_1-C_6))ureidoalquilo(C_1-C_6), glicinamido,alquil(C_1-C_6) glicinamido, aminocarbonilglicinamido, alcoxi(C_1-C_6) alquil (C_1-C_6)carbonilglicinamida, (aminocarbon-il) (alquil ($C_1-5 C_6$))glicinamido, (alcoxi(C_1-C_6)carbonilalquil(C_6-C_{10}) carbonil) (alquil(C_1-

6/56
335
~~239~~

C₆) glicinamido, (alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) carbonil) glicinamido, aril (C₆-C₁₀) carbonilglicinamido, (aril (C₆-C₁₀) carbonil) (alquil (C₁-C₆) glicinamido, (aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil) -10 glicinamido, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil) ((alquil (C₁-C₆) glicinamido, aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilglicinamido, (aril (C₆-C₁₀) aminocarbonil) (alquil (C₁-C₆) glicinamido, glicinamidoalquilo (C₁-C₆), alaninamido, alquil (C₁-C₆) alaninamido, alaninamidoalquilo (C₁-C₆), heteroarilo (C₂-C₉), heterocicloalquilo (C₂-C₉), heteroaril (C₂-C₉) alquilo (C₁-C₆) y heterocicloalquil (C₂-C₉) alquilo (C₁-C₆); R⁷ es de uno a tres grupos seleccionados independientemente de hidrógeno, hidróxido, halo, alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilo, aril (C₆-C₁₀) sulfonilo, alcoxi (C₁-C₆), hidroxialcoxi (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), formilo, nitro, ciano, haloalcoxi (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), arilo (C₆-C₁₀) / aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆), amino, alquil (C₁-C₆) amino, (alquil (C₁-C₆))₂ amino, aril (C₆-C₁₀) amino, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) amino, alquil (C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilamino, alqueno (C₂-C₆) carbonilamino, cicloalquilcarbonilamino, aril (C₆-C₁₀) carbonilamino, haloalquil (C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-

336 6/57
340

C₆)carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆)carbanilalquil (C₁-C₆)
carbonilamino, (alquil (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
amino, (alcoxi (C₁-C₆)carbonil) (alquil (C₁-C₆))amino,
alquil (C₁-C₆)sulfonilarnino, aminoalquilo (C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆)aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
carbonilaminaalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-10 C₆) carbonil)
(alquil (C₁-C₆))aminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilo,
aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆)carbonilo, alquil (C₁-
C₆)carbonilo, aril (C₆-C₁₀)carbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil (C₁-
C₆)carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆)aminocarbonilo,
(alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), guanidino, ureido,
alquil (C₁-C₆)ureido, ureidoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
ureidoalquilo (C₁-C₆) y glicinamida; cada uno de R⁹ y se
selecciona independientemente del grupo compuesto par
hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₀), aril (C₆-
C₁₀)alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)carbanila, alquil (C₁-
C₆)carbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alquil (C₁-

C_6) carbonilo, aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6) carbonilalquilo (C_1-C_6), aminocarbonilo, alquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, ($\text{alquil}(C_1-C_6)$)₂ aminocarbonilo y. alcoxi (C_1-C_6) carbonilo; y cada una de $R^{1'}$ y R^{12} se selecciona independientemente del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), arilo (C_6-C_{10}) aril (C_6-C_{10}) alquilo (C_1-C_6), hidroxilo, alcoxi (C_1-C_6), hidroxialquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6), amino, alquil (C_1-C_6) amino, ($\text{alquil}(C_1-C_6)$)₂ amino, . alquil (C_1-C_6) carbonilamino, cicloalquil (C_3-C_6) carbonilamino, cicloalquil (C_3-C_6) alquil (C_1-C_6) carbonilamino, alcoxi (C_1-C_6) carbanilamino, alquil (C_1-C_6) sulfonilamino, aril (C_6-C_{10}) carbonilamino, alcoxi (C_1-C_6) carbonilalquil (C_1-C_6) carbonilamina, aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6) carbonilamino, (aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6) carbonil) ($\text{alquil}(C_1-C_6)$) amino, alquil (C_1-C_6) carbonilaminoalquilo (C_1-C_6), cicloalquil (C_3-C_3) carbonilaminoalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6) carbanilaminoalquilo (C_1-C_6), heterociclaalquil (C_2-C_9) carbonilaminaalquilo (C_1-C_6), aril (C_6-C_{10}) alquil (C_1-C_6) carbonilaminoalquilo (C_1-C_6), heteroaril (C_2-C_9) carbanilaminoalquilo (C_1-C_6), aril (C_6-C_{10}) sulfonilamino, 20 alquil (C_1-C_6) sulfonilaminoalquilo (C_1-C_6), aminocarbanilamino, alquil (C_1-C_6) aminocarbonilamina, haloalquil (C_1-C_6)

6/59

338

347

aminocarbonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilamino,
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆) ., alquil(C₁-C₆)
aminocarbanilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆) , haloalquil(C₁- C₆)
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆)/aminoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆), carbaxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbanilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) y
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquilo(C₁-C₆) .

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R¹ es hidrogeno, halo, ciano, nitro,
trifluorometilo, trifluorometoxi, alquilo C₁-C₆,
hidraxi o alquilcarboniloxi(C₁-C₆) . .

3. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde cada uno de R² y R³ están seleccionados cada uno
independientemente de alquilo(C₁-C₆), ciclaalquilo(C₃-C₈),
aminoalquilo(C₁-C₆), aminocicloalquilo(C₃-C₈), alquil(C₁-
C₆)aminaalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminocicloalquilo (C₃-
C₈), hidroxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)
carbonilaminoalquil(C₁-C₆), ureidoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-
C₉)alquilo(C₁-C₆) o heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆) .

6/60
339
~~344~~
~~343~~

4. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 2; Y es etileno y e es 0.

5. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1 ó 2; Y es CH₂ ó etileno; e es 1; y Z es oxígeno o NR⁹, en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo C₁-C₆.

6. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1; Y es CHR⁸ en donde R⁸ es NR⁹R¹⁰, R⁹ y R¹⁰ es cada uno independientemente hidrogeno, alquilo(C₁-C₆) ó alquilcarbonilo(C₁-C₆); e es 1; y Z se selecciona del grupo formado por oxígeno; CR¹¹R¹² en donde R¹¹ y R¹² son hidrógeno, y NR⁹ en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo(C₁-C₆).

7. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde R⁴ es (R⁵)_f(R⁶)_g arilo(C₆-C₁₀) ó (R⁵)_f(R⁷)_h heteroarilo(C₂-C₉), en donde f, g y h son independientemente 1 ó 2.

8. Un compuesto según la reivindicación 1, en

340 6/6/ 349

donde R⁵ se selecciona del grupo formado por heterocicloalquilcarbonilo (C₂-C₉), heteroarilcarbonilo (C₂-C₉), heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbanilo, heteracicloalquilo (C₂-C₉) alquilaminocarbanilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilamino alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, ureidoalquil (C₁-C₆) aminocarbanilo, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂ uridoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminosulfonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilamino, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminoalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) ureido, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) ureido, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, acetilaminoalquil (C₁-C₆) ureido, (acetil)

6/82
341 345

(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)ureido, aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, acetilaminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (acetil)(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminocarbonilalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminosulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminosulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, heterocicloalquiloxi(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilominoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) aminoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquil

(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-
C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroariloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-
C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroaril (C₂-C₉)
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆),
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆),
aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) (alquil (C₁-
C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
(acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-
C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-

C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ (cianoguanidino) alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), aminocarbonilalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfanilaminoalquil (C₁-C₆), aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) sulfonilo, aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroaril (C₂-C₉) aminosulfonil, ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,

aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroaril
(C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heterocicloalquil (C₂-
C₉) aminosulfonil, haloalquil (C₁-C₆) aminocarbonil,
hidroxialquil (C₁-C₆) ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,
alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆)
hidroxialquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-
C₆))₂aminosulfonil, hidroxialquil (C₁-C₆) aminosulfonil y
alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil.

9. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente halo,
halo(alquil C₁-C₆), alquil (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆),
trifluorometil, trifluorometoxi, hidroxil, aminocarbonil,
ciano, ureido, alquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alcoxi (C₁-C₆)
carbonilamino o glicinamino.

10. Una composición farmacéutica para tratar o
prevenir un trastorno o afección seleccionado de
enfermedades auto inmunes, artritis reumatoide, diabetes
de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad
inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis,

345 6/66
~~349~~

esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas, osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en adultos, síndrome del distrés respiratorio en la infancia, lesión. por reperfusión isquémica, glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis atópica, inflamación asociada con infección, inflamación viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes, aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de un receptor común), y enfermedades granulomatosas, sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como consecuencia de la reducción de la infiltración celular; tratar enfermedades y/o insuficiencia cardíaca congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar efisema pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2, VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las secuelas asociadas con una infección, cuando dicha infección induce la producción de citacinas inflamatorias

6/67
346
350

perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

11. Una composición farmacéutica para el tratamiento o prevención de un trastorno ó afección que puede tratarse o prevenirse mediante la inhibición de la unión de quimiocinas al receptor CCR1 en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

12. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección seleccionado de enfermedades

autoinmunes, artritis reumatoide, diabetes de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis, esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas, osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en adultos, síndrome del distrés respiratorio en la infancia, lesión. por reperfusión isquémica, glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis atópica, inflamación asociada con infección, inflamación viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes, aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de un receptor común), y enfermedades granulomatosas, sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como consecuencia de la reducción de la infiltración celular; tratar enfermedades y/o insuficiencia cardíaca congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar efisema pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2, VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del

6/89

348

352

Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las secuelas asociadas con una infección, cuando dicha infección induce la producción de citocinas inflamatorias perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.

13. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección que se puede tratar o prevenir antagonizando el receptor CCRI en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.

6170
349 351
~~253~~

**TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES
PCT
REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(PCT Artículo 36 y Regla 70)**

Referencia del solicitante o representante: PC10770AIXN
No. de Solicitud Internacional: PCT /IB01/00375
Fecha de presentación internacional: 14/03/2001
Fecha de prioridad: 31/03/2000
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC:
C07D295/185
Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC. et al.

1. El reporte de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Autoridad de Revisión Preliminar Internacional y es transmitido al solicitante según el Artículo 36.

2. Este REPORTE consta de 4 hojas, incluyendo esta cubre hoja.

___ Este reporte también está acompañado de ANEXOS, es decir, hojas de la descripción, reivindicaciones, y/o dibujos los cuales han sido modificados y son la base para este reporte y/o hojas que contengan rectificaciones hechas ante esta Autoridad (ver Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones Administrativas bajo el PCT).

Estos anexos constan de un total de hojas.

3. Este reporte contiene indicaciones con relación a los siguientes ítems:

I. ☒ Base de la opinión

II. ☐ Prioridad

III. ☒ Ninguna opinión con respecto a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial.

IV. ☐ Falta de unidad inventiva

V. ☐ Declaración razonada según artículo 35(2) con respecto a la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citas y explicaciones soportando dicha declaración.

VI ☐ Ciertos documentos citados

VII ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional

VIII ☐ Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional

Fecha de radicación de la demanda: 10/10/2001

Fecha de elaboración de este reporte: 09/07/2002

Nombre y dirección de correspondencia de la Autoridad de Revisión Preliminar Internacional:

6/71

350

~~SSA~~

Oficina de Patentes Europea

D-80298 Munich

Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d

Fax: +49 89 23 99 - 4465

Funcionario Autorizado: Traegler-Goeldel, M.

Tel: +49 89 2399-8278

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL**I. Base del reporte**

1. Con respecto a los elementos de la solicitud internacional (Hojas de reemplazo, entregadas a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento según el Artículo 14, son referidas en este reporte como "presentadas originalmente" y no están anexadas al presente puesto que no contienen enmiendas (Reglas 70.16 y 70.17)):

Descripción, páginas:

1-64 tal como se presentó originalmente

Reivindicaciones, Nos.:

1-13 tal como se recibió el 27/05/2002 con memorando de 23/05/2002

2. Con respecto al idioma, todos los elementos marcados anteriormente estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el idioma en el cual fue presentada la solicitud internacional, a menos que se indique de otra manera bajo este punto.

Estos elementos estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el siguiente idioma: ,el cual es:

- ☐ el idioma de una traducción suministrada con fines de la búsqueda internacional (bajo Regla 23.1(b)).
- ☐ el idioma de la publicación de la solicitud internacional (bajo Regla 48.3 (b)).
- ☐ el idioma de una traducción suministrada con fines del examen preliminar internacional (bajo Regla 55.2 y/o 55.3).

3. Con respecto a cualquier secuencia nucleótida y/o de amino ácidos divulgada en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional fue realizado con base en el listado de secuencias:

- ☐ contenido en la solicitud internacional por escrito.
- ☐ presentado junto con la solicitud internacional en forma electrónica
- ☐ suministrado subsecuentemente a esta Autoridad por escrito
- ☐ suministrado subsecuentemente a esta Autoridad en forma electrónica
- ☐ Ha sido suministrada la declaración donde indica que el listado suministrado de secuencias escrito no va más allá de la divulgación encontrada en la solicitud internacional tal como se presentó
- ☐ Ha sido suministrada la declaración que indica que la información registrada en forma electrónica es idéntica al listado de secuencias escrito.

4. Las enmiendas han resultado en la cancelación de:

- ☐ la descripción, páginas:
- ☐ las reivindicaciones, Nos.:
- ☐ los dibujos, hojas:

5. Este reporte ha sido establecido como si no estuvieran hechas las enmiendas, puesto que se consideró que iban más allá de la divulgación tal como se presentó (Regla 70.2c): (Cualquier hoja de reemplazo que contenga tales enmiendas debe referirse al ítem 1 y estar adjunta a este reporte.)

6. Observaciones adicionales, si es necesario:

III. Ninguna formulación de opinión con respecto a la novedad, nivel inventivo, y aplicación industrial

1. Las preguntas con respecto a si el invento reivindicado parece ser novedoso, tener nivel inventivo (no ser obvio), o ser industrialmente aplicable no han sido examinadas con respecto a:

- ☐ toda la solicitud internacional,
- ☒ reivindicaciones No. 1-13

Puesto que:

— dicha solicitud internacional, o dichas reivindicaciones se relaciona con el siguiente tema el cual no requiere examen preliminar internacional (especifique):

- ☐ la descripción, reivindicaciones, o dibujos (indique elementos en particular a continuación) o tales reivindicaciones Nos., están tan ambiguas que ninguna opinión significativa pudo formularse (especifique):
- ☐ las reivindicaciones, o dichas reivindicaciones Nos., están tan inadecuadamente soportadas por la descripción que ninguna opinión significativa pudo formularse

☒ no se ha establecido ninguna búsqueda internacional para dichas reivindicaciones Nos. 1-13.

2. Un examen preliminar internacional significativo no puede efectuarse debido a que el listado de secuencias nucleótidas y/o aminoácidas no cumple con el estándar suministrado en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas:

- ☐ la forma escrita no ha sido suministrada o no cumple con el estándar
- ☐ la forma electrónica no ha sido suministrada o no cumple con el estándar

6/74

353

~~357~~

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL – HOJA ANEXA

Re: Item V

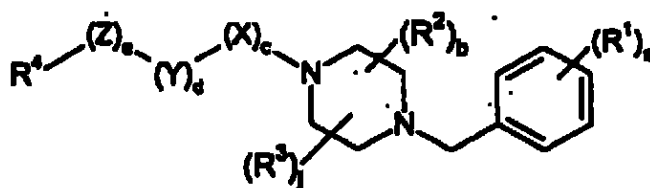
Según lo establecido en la entrada del reporte de búsqueda internacional, una búsqueda internacional se llevó a cabo de las reivindicaciones de método 1-7 tal como se presentaron originalmente, las cuales se relacionan con un método para preparar derivados de piperazina de solamente la fórmula I. Pero las presentes reivindicaciones 1-13, presentadas después de del Reporte de Búsqueda Internacional bajo el Artículo 34 del PCT, se relacionan con un tema totalmente diferente, es decir, aquellos derivados de piperazina de fórmula I *per se*; no han sido buscados. Por lo tanto, un examen preliminar internacional no será realizado con respecto a las reivindicaciones 1-13. Puesto que no hay reivindicaciones restantes que hayan sido buscadas, no se puede efectuar ninguna opinión con respecto a si la presente solicitud cumple con los requisitos establecidos en el Artículo 33 (2) y (3) del PCT.

PC10770A

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula

5



una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; en la que

a es 1, 2, 3, 4 ó 5;

b es 0, 1, 2, 3 ó 4;

c es 0 ó 1;

d es 1, 2, 3, 4 ó 5;

e es 0 ó 1;

j es 1, 2, 3 ó 4;

X es C(O), C(S) o CH₂

Y es CH₂, o si e es 0, Y es CHR⁸ siendo R⁸ hidrogeno, arilo (C₆-C₁₀) o NR⁹R¹⁰;

Z es oxigeno, NR⁹ o CR¹¹R¹²;

cada R' esta seleccionado independientemente de

hidrógeno, hidroxil, hidroxisulfonilo, halo, alquilo(C₁-C₆), mercapto, mercaptoalquilo(C₁-C₆), alquiltio(C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆),

alquiltio (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆); alquilsulfinil (C₁-C₆)
alquilo(C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀), haloalquilo(C₁-C₆),
trifluorometilo, formilo, formilalquilo(C₁-C₆), nitro,
nitroso, ciano, aril(C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi(C₁-
C₆), trifluorometoxi, cicloalquilo (C₃-C₇),
cicloalquilo(C₃-C₇)alquilo(C₁-C₆), hidroxícicloalquil (C₃-
C₇) alquilo (C₁-C₆), cicloalquilamino(C₃-C₇),
cicloalquilamino (C₃-C₇) alquilo(C₁-C₆),
((cicloalquil(C₃-C₇)) (alquil(C₁-C₆))amino,
(cicloalquil (C₃-C₇) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquilo(C₁-C₆),
cianoalquilo(C₁-C₆), alquenilo(C₂-C₇), alquinilo(C₂-C₇),
arilo(C₆-C₁₀), arilo (C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
alquenilo(C₂-C₆), hidroxí alquilo(C₁-C₆), hidroxiaril C₆-
C₁₀)alquilo(C₁-C₆), hidroxialquiltio(C₁-C₆) alquilo(C₁-
C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆), hidroxialquinilo (C₂-C₆)
,alcoxi (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) arilo (C₆-
C₁₀) alquilo (C₁-C₆), ariloxi (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
arilo(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), amino,
alquilamino (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂amino, arilamino(C₆-
C₁₀), aril(C₆-C₁₀) alquilamino (C₁-C₆), aminoalquilo(C₁-C₆),
alquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), (alquilo(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆),hidroxialquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-
C₆), arilamino(C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆), arilo(C₆-C₁₀),

alquilamino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆), alquilcarbonilamino
 (C₁-C₆), (alquilcarbonil (C₁-C₆))(alquil(C₁-C₆))amino,
 alquilcarbonilamino (C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆),
 (alquilcarbonil (C₁-C₆))(alquil (C₁-C₆))aminoalquilo(C₁-
 C₆), alcóxicarbonilamino (C₁-C₆), (alcóxicarbonil (C₁-C₆))
 alquilamino (C₁-C₆), alcóxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-
 C₆), (alcóxi(C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
 aminoalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcóxi(C₁-C₆) carbonilo,
 aril(C₆-C₁₀)alcóxi(C₁-C₆)carbonila, alquil (C₁-
 C₆)carbonilo, alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆),
 aril(C₆-C₁₀)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)carbonilalquilo(C₁-C₆),
 aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)carbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil
 (C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxialquilo(C₁-C₆),
 alcóxi(C₁-C₆) carbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcóxi(C₁-
 C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), alcóxi(C₁-C₆)alquil(C₁-10
 C₆)carboniloxialquilo(C₁-C₆), aminocarbonilo, alquil(C₁-
 C₆)aminocarb.onhlo, (alquil(C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril
 (C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆)
 aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
 C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
 aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)
 aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)
 aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), amidino, guanidino, ureido,
 alquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ ureido,

357 6/78
361

ureidoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆),
(alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquilo(C₂-C₉) heteroarilo(C₂-C₉),
heterocicloalquil (C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆) y heteroaril (C₂-
C₉) alquilo (C₁-C₆);
cada R² y R³ se selecciona independientemente de oxo,
halo, alquilo(C₁-C₆), cicloalquilo(C₃-C₈), cicloalquil(C₃-
C₈)alquilo(C₁-C₆), cicloalquil(C₃-C₈)aminoalquilo(C₁-C₆)
cicloalquil(C₃-C₈)alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),
haloalquilo(C₁-C₆), alquenilo(C₂-C₆), alquinilo(C₂-C₆),
arilo (C₆-C₁₀) , aril (C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)
alquenilo (C₂-C₆) , H-C (0) -, H-C (0) --alquilo (C₁-C₆),
hidroxialquilo(C₁-C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆),
hidroxialquinilo(C₂-C₆),hidroxiaril (C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆),
hidroxicicloalquil(C₃-C₈)alquilo(C₁-C₆), tioalquilo(C₁-C₆)
cianoalquilo(C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)aril(C₆-
C₁₀)alquilo(C₁-C₆) , alcoxi(C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆) , ariloxi
(C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)
alquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)tioalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)sulfinilalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) sulfonilalquilo
(C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-C₆) tioalquilo(C₁-C₆),
aminoalquilo (C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-
C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)

358 6/79
362

aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-
C₆), azidoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-
C₆))₂ aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆)
carbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquilo(C₁-C₆), hidroxialquil
(C₁-C₆) aminoalquilo(C₁-C₆), ariloxi(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
carboniloxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-C₆)
carboniloxialquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquil
(C₁-C₆) carboniloxialquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)carbonilo,
alquil(C₁-C₆)carbonilalquilo(C₁-C₆), carboxi, alcoxi (C₁-
C₆)carbonilo, aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)carbonilo, aril(C₆-
C₁₀)alquil(C₁-C₆) carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilo, aril
(C₆-C₁₀) aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, carboxialquilo (C₁-C₆), alóxi (C₁-C₆)
carbonilalquilo(C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)
carbonilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)sulfonilo,
heterocicloalquilo(C₂-C₉), heteroarilo(C₂-C₉),

359

6180
~~262~~ 364

heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-C₉)
alquilo(C₁-C₆) a R'⁴R¹⁵N-alquilo(C₁-C₆), siendo cada uno
de R¹⁴ y R¹⁵, independientemente, alquilo(C₁-C₆) a
alquil(C₁-C₆)carbonilo;
es (R⁵)f(R⁶)gariio(C₆-C₁₀), (R⁵)₁(R⁶)gcicloalquilo(C₃-C₁₀)
(R⁵)f(R⁷)heteroarilo(C₂-C₉) a (R⁵)f(R⁷)
heterocicloalquilo(C₂-C₉), 20 siendo f 1, 2, 3 o 4; y
siendo g y h independientemente 0, 1, 2 o 3;
R⁵ es de uno a tres grupos seleccionados
independientemente de heterocicloalquil(C₂-C₉)carbonilo,
heteroaril(C₂-C₉)carbonilo, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo,
alquil(C₁-C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonila, (alquil
(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilo, haloalquil(C₁-
C₆)aminocarbonilo, aminosulfonilalquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilalquil(C₁-C₆)
aminocarbonilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
carbonilamino, cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino, .
(alquil(C₁-C₆))₂cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)carbonilamino,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)carbonilamino, heteroaril(C₂-
C₉)alquil(C₁-C₆)carbonilamino, heterocicloalquil(C₂-

360 6/8,
264

C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) carbonilamino, hidroxialquil (C₁-C₆) ureido, aminoalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) ureido, heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) ureido, aminosulfonilalquil (C₁-C₆) ureido, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, (alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilalquil (C₁-C₆) ureido, acetilaminoalquil (C₁-C₆) ureido, (acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆) ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, (acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,

361 6/82
265

aminosulfonilamino, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilamino,
(alquil(C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminocarbonilalquil
(C₁-C₆) aminoalquil(C₁-C₆) sulfonilamino,
heterocicloalquiloxi(C₂-C₉) carbonilaminoalquil(C₁-C₆)
sulfonilamino, heteroariloxi(C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidino, alquil(C₁-
C₆)cianoguanidino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidino,
heterocicloalquil(C₂-C₉) cianoguanidino, heteroaril(C₂-
C₉)cianoguanidino, heterocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-
C₆)cianoguanidino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)
cianoguanidino, aminoalquil(C₁-C₆) cianoguanidino, alquil
(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil(C₁-
C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆) cianoguanidino.,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)cianoguanidino, alquil(C₁-
C₆)aminocarbonilalquil(C₁-C₆) cianoguanidino, (alquil
(C₁-C₆))₂aminocarbonilalquil(C₁-C₆) cianoguanidino,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆) amino, alquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)amino, alcoxi(C₁-C₆)
carbonilaminoalquil(C₁-C₆) amino, aminosulfonilalquil
(C₁-C₆)amino, heteroaril(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆)amiflo,
acetilaminoalquil(C₁-C₆)amino, (acetil) (alquil(C₁-C₆))
aminoalquil(C₁-C₆) amino, alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquil
(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), cianoalquil(C₁-C₆)aminoalquilo,
aminocarbonilalquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆),

352 6/83
266

acetilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆)
(acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-
C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil
(C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), alquil
(C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆)
aminocarboniloxialquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆),
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
aminosulfonilalquil (C₁-C₆) carbonilarninoalquilo (C₁-C₆),
heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilarninoalquilo (C₁-C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-
C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) cianoalquil (C₁-

363 6184
~~367~~

C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminoalquil (C₁-5
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquilo (C₁-C₆)
(alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquil (C₁-
C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminocarbonilalquil
(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilamino-
alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆) / alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-
C₆) / heterocicloalquiloxi (C₂- C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteroariloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteracicloalquil (C₂-
C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquilo (C₁-C₆),
heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil-
aminoalquilo (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo
(C₁-C₆) cianaguanidinoalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo (C₁-
C₆), haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆),
aminoalquil (C₁-C₆) sulfanilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil

364 6/85
367

(C₁-C₆)₂aminoalquil (C₁-C₆)sulfonila.minoalquilo(C₁-C₆),
acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquila(C₁-
C₆), (acetil) (alquil(C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminalquila(C₁-C₆), ureidoalquil(C₁-
C₆)sulfanilaminaalquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆)ureidoalquil(C₁-C₆) sulfonilarninoalquilo(C₁-C₆),
(alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆) sulfonilaminaalquila(C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)
sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), cianoguanidinoalquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆) / alquil(C₁-C₆)
(cianoguanidino) alquil(C₁-C₆)sulfonilamino-
alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂(cianoguanidino)alquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquil(C₁-
C₆)sulfanilaminoalquilo(C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbonilamino-alquil(C₁-C₆)sulfonilaminaalquilo(C₁-C₆),
heterocicloalquiloxi(C₂-C₉)carbonilaminoalquil(C₁-
C₆)sulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), heteroariloxi(C₂-
C₉)carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-
C₆), aminosulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminosulfonil-aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminosulfonilamino-alquilo(C₁-C₆), cianoguanidino-
alquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆) (cianaguanidino)alquilo(C₁-
C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ (cianoguanidino)alquilo(C₁--C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino) alquilo (C₁-C₆)

365 6/86
~~369~~

hete'rocicloalquil(C₂-C₉)alquil(C₁-C₆) (cianoguanidino)-
alquilo(C₁-C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) (cianoguanidino)
amino, heteroaril (C₂-C₉) (cianoguanidino)alquilo(C₁-C₆),
heteroaril (C₂-C₉)alquil (C₁-C₆) (cianaguanidina)
alquilo(C₁-C₆) ,aminoalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
alquilo(C₁-C₆) ,alquil (C₁-C₆) aminoalquil(C₁-C₆)
(cianoguanidino)alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminoalquil(C₁-C₆) (cianoguanidino)alquilo (C₁-
C₆)/aminocarbonilalquil (C₁-C₆) (cianoguanidino)
alquilo(C₁-C₆)alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil(C₁-C₆)
(cianoguanidino)alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂-
aminocarbonilalquil(C₁-C₆) (cianoguanidino)alquilo(C₁-C₆),
aminosulfonilo, alquil(C₁-C₆)aminosulfonilo, (alquil(C₁-
C₆))₂aminosulfonilo, heterocicloalquil(C₂-C₉)sulfonilo,
aminoalquil(C₁-C₆)aminosulfonilo, alquil(C₁-
C₆)aminoalquil(C₁-C₆)aminosulfonila, (alquil(C₁-
C₆))₂aminoalquil(C₁-C₆)aminosulfonilo, heteroaril(C₂-
C₉)aminosulfonila, hidroxialquil (C₁-C₆)aminosulfonilo,
alcoxi (C₁-C₆)alquil (C₁-C₆)aminosulfonilo,
ureidoalquil(C₁-C₆)arninosulfonilo, alquil(C₁-
C₆)ureidoalquil(C₁-C₆)aminosulfonilo, (alquil(C₁-
C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)aminasulfonilo, alquil(C₁-
C₆)sulfonilaminoalquil(C₁-C₆)aminosulfonilo, alcoxi(C₁-
C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆)aminosulfonila,

6/87
366
370

heterocicloalquiloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminosulfonilo, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil
(C₁-C₆) aminosulfonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆)
aminosulfonilo, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)
aminosulfonilo, heteroaril (C₂-C₉) alquil (C₁-
C₆) aminosulfonilo, heterocicloalquil (C₂-C₉) aminosulfonilo,
R⁶ es de uno a tres grupos seleccionados
independientemente de hidrógeno, hidróxi,
hidroxisulfonilo, halo, alquilo (C₁-C₆), mercapto,
mercaptoalquilo (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆)
sulfinilo, alquil (C₁-C₆) sulfonilo, aril (C₆-C₁₀)
sulfonilo, alquil (C₁-C₆) tioalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁-
C₆) sulfinilalquilo (C₁-C₆) / alquil (C₁- C₆)
sulfonilalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), hidroxialcoxi (C₁-
C₆), ariloxi (C₆-C₁₀), haloalquilo (C₁-C₆), trifluoroalquilo
(C₁-C₆), formilo, formilalquilo (C₁-C₆), nitro, nitroso,
ciano, aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆),
trifluoroalcoxi (C₁-C₆), aminoalcoxi (C₁-C₆) , cicloalquilo
(C₃-C₁₀), cicloalquil (C₃-C₁₀) alquilo (C₁-C₆),
hidroxicicloalquil (C₃-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) / cicloalquil (C₃-
C₁₀) amino, cicloalquil (C₃-C₁₀) aminoalquilo (C₁-C₆),
cianoalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆),
arilo (C₆-C₁₀) , aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆) ~ aril (C₆-C₁₀)
alqueno (C₂-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), (hidróxi) aril (C₆-

367 6/88
371

C₁₀)alquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆)amino)aril(C₆-C₁₀)
alquilo(C₁-C₆), hidroxialquil(C₁-C₆)tioalquilo(C₁-C₆),
hidroxialquenilo(C₂-C₆), hidroxialquenilo(C₂-C₆),
hidroxialquinilo(C₂-C₆), alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆)
,alcaxi(C₁-C₆)aril(C₆-C₁₀)alquilo(C₁-C₆), ariloxialquila(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁- C₆), amino,
alquil(C₁-C₆)amino, (alquil(C₁-C₆))₂amino, aril(C₆-C₁₀)
amino, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) amino, aminoalquil (C₁-
C₆) amino, heterocicloalquil (C₂-C₉) amino, heteroaril
(C₂-C₉)amino, cicloalquil(C₃-C₁₀) (alquil(C₁-C₆))amino,
alquil(C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilamino,
alquenil (C₂-C₆)carbonilamino, cicloalquil (C₃-
C₁₀)carbonilamino, aril (C₆-C₁₀) carbonilamino,
heterocicloalquil (C₂-C₉)carbonilamino, halbalquil(C₁-
C₆)carbonilamino, alcoxi(C₁-C₆)alquil(C₁-C₆)carbonilamino,
alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquil(C₁-C₆)carbonilamino, (alquil
(C₁-C₆)carbonil) (alquil (C₁-C₆))amino,
(alcoxi(C₁-C₆)carbonil) (alquil(C₁-C₆))amino, alquil(C₁-C₆)
sulfonilamino, aminoalquilo (C₁-C₆) , alquil (C₁-
C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂aminoalquilo(C₁-C₆),
hidroxialquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
aminoalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆)
aminoalquilo (C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)carbonhlaminoalquilo(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀)carbonilaminaalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-

6/89
368
372

C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆) ,
cicloalquil (C₃-C₁₀) (alquil (C₁-C₆) aminaalquilo (C₁-C₆) ,
alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆)
carbonilalquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆) ,
(alcoxi (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-
C₆) , alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-
C₆) sulfonil) (alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-
C₁₀) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆) , (aril (C₆-C₁₀)
sulfonil) (alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆) ,
heterocicloalquil (C₂-C₉) aminoalquilo (C₁-C₆) , heteroaril (C₂-
C₉) aminoalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆) carbonilo , aril (C₆-
C₁₀) alcaxi (C₁-C₆) carbonila , alquil (C₁-C₆) carbonilo ,
aril (C₆-C₁₀) carbonilo , aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonila ,
hidroxialcoxi (C₁-C₆) carbonilo , alcoxi (C₁-C₆)
carbonilalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-
C₆) carbonilalquilo (C₁-C₆) , alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-
C₆) carbonilaxialquilo (C₁-C₆) , (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilaxialquilo (C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆)
carbonilalquilo (C₁-C₆) , aril (C₆-C₁₀) carbonilalquilla (C₁-
C₆) , aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilalquilla (C₁-C₆) ,
aminocarbonilo , alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo , (alquil (C₁-
C₆))₂ aminocarbonilo , aril (C₆-C₁₀) aminocarbonilo , aril (C₆-
C₁₀) alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo , (aminocarbonilalquil (C₁-
C₆)) aminocarbonilo , alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquil (C₁-

6/90
369
374

273

C₆)aminocarbonilo, alcoxi(C₁-C₆)carbonilalquil(C₁-
C₆)aminoca.rbonila, (aminoalquil(C₁-C₆))aminocarbonilo,
hidroxialquil (C₁-C₆)aminocarbonilo,
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo(C₁-C₆), aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), amidino, hidroxiamidino,
guanidino, ureido, alquil (C₁-C₆)ureido, aril (C₆-
C₁₀)ureido, (aril(C₆-C₁₀))₂ureido, aril(C₆-C₁₀)alquil(C₁-
C₆)ureida, haloalquil(C₁-C₆)ureido, (alquil(C₁-C₆))
(aril(C₆-C₁₀))ureido, (alquil(C₁-C₆))₂ ureido, haloalquil(C₁-
C₆)carbonilureido, ureidoalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-
C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquila(C₁-
C₆), aril(C₆-C₁₀) ureidoalquilo (C₁-C₆), (aril(C₆-
C₁₀))₂ureidoalquilo(C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)alquil(C₁-C₆)
ureidoalquila(C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆) ureidoalquilo(C₁-
C₆), (haloalquil(C₁-C₆)) (alquil(C₁-C₆))ureidoalquilo(C₁-
C₆), (alcoxi(C₁-C₆) carbonilalquil(C₁-
C₆))ureidoalquilo(C₁-C₆), glicinamido,alquil(C₁-C₆)
glicinamido, aminocarbonilglicinamido, alcoxi(C₁-C₆)
alquil (C₁-C₆)carbonilglicinamida, (aminocarbon-il)
(alquil (C₁-5 C₆))glicinamido, (alcoxi(C₁-
C₆)carbonilalquil(C₆-C₁₀) carbonil) (alquil(C₁-

6/9/1
370
37A

C₆) glicinamido, (alcoxi(C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) carbonil) glicinamido, aril (C₆-C₁₀) carbonilglicinamido, (aril (C₆-C₁₀) carbonil) (alquil (C₁-C₆) glicinamido, (aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) aminocarbonil) -10 glicinamido, aril(C₆-C₁₀) alquil(C₁-C₆) aminocarbonil) ((alquil(C₁-C₆) glicinamido, aril(C₆-C₁₀) aminocarbonilglicinamido, (aril(C₆-C₁₀) aminocarbonil) (alquil(C₁-C₆) glicinamido, glicinamidoalquilo(C₁-C₆), alaninamido, alquil(C₁-C₆) alaninamido, alaninamidoalquilo(C₁-C₆), heteroarilo(C₂-C₉), heterocicloalquilo (C₂-C₉), heteroaril (C₂-C₉) alquilo (C₁-C₆) y heterocicloalquil (C₂-C₉) alquilo (C₁-C₆); R' es de uno a tres grupos seleccionados independientemente de hidrógeno, hidróxido, halo, alquilo(C₁-C₆) , alquil (C₁-C₆) sulfonilo, aril (C₆-C₁₀) sulfonilo, alcoxi (C₁-C₆), hidroxialcoxi(C₁-C₆), haloalquilo(C₁-C₆), formilo, nitro, ciano, haloalcoxi(C₁-C₆), alquenilo(C₂-C₆), alquinilo(C₂-C₆), arilo(C₆-C₁₀) / aril(C₆-C₁₀) alquilo(C₁-C₆), amino, alquil(C₁-C₆) amino, (alquil (C₁-C₆))₂amino, aril (C₆-C₁₀) amino, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) amino, alquil (C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilamino, alquenil(C₂-C₆) carbonilamino, cicloalquilcarbonilamino, aril(C₆-C₁₀) carbonilamino, haloalquil(C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi(C₁-C₆) alquil(C₁-

371 6/92
375

C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbanilalquil (C₁-C₆)
carbonilamino, (alquil (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆))
amino, (alcoxi (C₁-C₆) carbonil) (alquil (C₁-C₆)) amino,
alquil (C₁-C₆) sulfonilarnino, aminoalquilo (C₁-C₆),
alquil (C₁-C₆) aminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ aminoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
carbonilaminaalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-10 C₆) carbonil)
(alquil (C₁-C₆)) aminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilo,
aril (C₆-C₁₀) alcoxi (C₁-C₆) carbonilo, alquil (C₁-
C₆) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-
C₆) carbonilo, aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo,
(alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilo, aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilo, aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) aminocarbonil-alquilo (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀)
aminocarbonilalquilo (C₁-C₆), guanidino, ureido,
alquil (C₁-C₆) ureido, ureidoalquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
ureidoalquilo (C₁-C₆) y glicinamida; cada uno de R⁹ y se
selecciona independientemente del grupo compuesto par
hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₀), aril (C₆-
C₁₀) alquilo (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) carbanila, alquil (C₁-
C₆) carbonilalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-

6/93
372
376

C₆) carbonilo, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilalquilo (C₁-C₆), aminocarbonilo, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilo, (alquil (C₁-C₆))₂ aminocarbonilo y. alcoxi (C₁-C₆) carbonilo; y cada una de R¹ y R¹² se selecciona independientemente del grupo compuesto por hidrógeno, alquilo (C₁-C₆), arilo (C₆-C₁₀) aril (C₆-C₁₀) alquilo (C₁-C₆), hidroxil, alcoxi (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), amino, alquil (C₁-C₆) amino, (alquil (C₁-C₆))₂ amino, . alquil (C₁-C₆) carbonilamino, cicloalquil (C₃-C₉) carbonilamino, cicloalquil (C₃-C₉) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbanilamino, alquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aril (C₆-C₁₀) carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) carbonilamina, aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilamino, (aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonil (alquil (C₁-C₆)) amino, alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), cicloalquil (C₃-C₉) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbanilaminoalquilo (C₁-C₆), heterociclaalquil (C₂-C₉) carbonilaminaalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquilo (C₁-C₆), heteroaril (C₂-C₉) carbanilaminoalquilo (C₁-C₆), aril (C₆-C₁₀) sulfonilamino, 20 alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquilo (C₁-C₆), aminocarbanilamino, alquil (C₁-C₆) aminocarbonilamina, haloalquil (C₁-C₆)

6/94
373
277

aminocarbonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminocarbonilamino,
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆).., alquil(C₁-C₆)
aminocarbanilaminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆) , haloalquil(C₁- C₆)
aminocarbonilaminoalquilo(C₁-C₆)/aminoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)aminoalquilo(C₁-C₆), (alquil(C₁-C₆))₂
aminoalquilo(C₁-C₆), carbaxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)
carbanilalquilo(C₁-C₆), aminocarbonilalquilo (C₁-C₆) y
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilalquilo(C₁-C₆).

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R¹ es hidrogeno, halo, ciano, nitro,
trifluorometilo, trifluorometoxi, alquilo C₁-C₆,
hidraxi o alquilcarboniloxi(C₁-C₆)..

3. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde cada uno de R² y R³ están seleccionados cada uno
independientemente de alquilo(C₁-C₆), ciclaalquilo(C₃-C₈),
aminoalquilo(C₁-C₆), aminocicloalquilo(C₃-C₈), alquil(C₁-
C₆)aminaalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminocicloalquilo (C₃-
C₈), hidroxialquilo(C₁-C₆), alcoxi(C₁-C₆)
carbonilaminoalquil(C₁-C₆), ureidoalquilo(C₁-C₆),
alquil(C₁-C₆)ureidoalquilo(C₁-C₆), heteroaril(C₂-
C₉)alquilo(C₁-C₆) o heterocicloalquil(C₂-C₉)alquilo(C₁-C₆).

16/9/5
374
378

4. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 2; Y es etileno y e es 0.

5. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1 ó 2; Y es CH₂ ó etileno; e es 1; y Z es oxígeno o NR⁹, en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo C₁-C₆.

6. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde c es 1; X es C(O) ó CH₂; d es 1; Y es CHR⁸ en donde R⁸ es NR⁹R¹⁰, R⁹ y R¹⁰ es cada uno independientemente hidrogeno, alquilo(C₁-C₆) ó alquilcarbonilo(C₁-C₆); e es 1; y Z se selecciona del grupo formado por oxígeno; CR¹¹R¹² en donde R¹¹ y R¹² son hidrógeno, y NR⁹ en donde R⁹ es hidrógeno ó alquilo(C₁-C₆).

7. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde R⁴ es (R⁵)_f(R⁶)_g arilo(C₆-C₁₀) ó (R⁵)_f(R⁷)_h heteroarilo(C₂-C₉), en donde f, g y h son independientemente 1 ó 2.

8. Un compuesto según la reivindicación 1, en

6/96
325
~~324~~

donde R^3 se selecciona del grupo formado por heterocicloalquilcarbonilo (C_2-C_9), heteroarilcarbonilo (C_2-C_9), heteroaril (C_2-C_9) alquil (C_1-C_6) aminocarbanilo, heteracicloalquilo (C_2-C_9) alquilaminocarbanilo (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6) sulfonilamino alquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, ureidoalquil (C_1-C_6) aminocarbanilo, alquil (C_1-C_6) ureidoalquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, (alquil (C_1-C_6))₂ uridoalquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, aminosulfonilalquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, alquil (C_1-C_6) aminosulfonilalquil (C_1-C_6) aminocarbonilo, alquil (C_1-C_6) sulfonilaminoalquil (C_1-C_6) carbonilamino, cianoguanidinoalquil (C_1-C_6) carbonilamino, alquil (C_1-C_6) cianoguanidinoalquil (C_1-C_6) carbonilamino, (alquil (C_1-C_6))₂ cianoguanidinoalquil (C_1-C_6) carbonilamino, aminocarbonilalquil (C_1-C_6) carbonilamino, heteroaril (C_2-C_9) alquil (C_1-C_6) carbonilamino, heterocicloalquil (C_2-C_9) alquil (C_1-C_6) carbonilamino, aminosulfonilalquil (C_1-C_6) carbonilamino, aminoalquil (C_1-C_6) ureido, alquil (C_1-C_6) aminoalquil (C_1-C_6) ureido, (alquil (C_1-C_6))₂ aminoalquil (C_1-C_6) ureido, heterocicloalquil (C_2-C_9) alquil (C_1-C_6) ureido, heteroaril (C_2-C_9) alquil (C_1-C_6) ureido, aminosulfonilalquil (C_1-C_6) ureido, aminocarbonilalquil (C_1-C_6) ureido, alquil (C_1-C_6) aminocarbonilalquil (C_1-C_6) ureido, (alquil (C_1-C_6))₂ aminocarbonilalquil (C_1-C_6) ureido, acetilaminoalquil (C_1-C_6) ureido, (acetil)

6/92

376

380

(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)ureido, aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, acetilaminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (acetil)(alquil(C₁-C₆))aminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil (C₁-C₆)ureidoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ureidoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alquil(C₁-C₆)cianoguanidinoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, (alquil(C₁-C₆))₂ cianoguanidinoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminocarbonilalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, alcoxi(C₁-C₆)carbonilaminoalquil(C₁-C₆)sulfonilamino, aminosulfonilamino, alquil (C₁-C₆)aminosulfonilamino, (alquil (C₁-C₆))₂aminosulfonilamino, aminocarbonilalquil (C₁-C₆)aminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, heterocicloalquiloxi(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)sulfonilamino, heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilominoalquil (C₁-C₆) sulfonilamino, aminoalquil (C₁-C₆)aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)aminoalquil(C₁-C₆)aminocarbonilaminoalquil(C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂aminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminocarbanilaminoalquil

377 6/98
381

(C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-
C₆), alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroariloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-
C₆), heterocicloalquil (C₂-C₉) alquil (C₁-C₆)
aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆), heteroaril (C₂-C₉)
alquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-
C₆) ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-
C₆))₂ ureidoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆),
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-C₆),
aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)
aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) (alquil (C₁-
C₆))₂ aminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
acetilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
(acetil) (alquil (C₁-C₆)) aminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), ureidoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆) ureidoalquil (C₁-
C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
ureidoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), alquil (C₁-

6/99
378
378

C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) alquil (C₁-C₆) (cianoguanidino) alquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), (alquil (C₁-C₆))₂
(cianoguanidino) alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
aminocarbonilalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
heteroariloxi (C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆)
sulfonilaminoalquil (C₁-C₆), aminosulfonilaminoalquil (C₁-
C₆), alquil (C₁-C₆) aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
(alquil (C₁-C₆))₂ aminosulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
heterocicloalquil (C₂-C₉) sulfonilo, aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ aminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, heteroaril (C₂-C₉) aminosulfonil,
ureidoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) ureidoalquil
(C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-C₆))₂ ureidoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, alcoxi (C₁-C₆) carbonilaminoalquil (C₁-
C₆) aminosulfonil, heterocicloalquiloxi (C₂-C₉)
carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroariloxi
(C₂-C₉) carbonilaminoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,

6/100
379 389
383

aminocarbonilalquil (C₁-C₆) aminosulfonil,
cianoguanidinoalquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heteroaril
(C₂-C₉) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, heterocicloalquil (C₂-
C₉) aminosulfonil, haloalquil (C₁-C₆) aminocarbonil,
hidroxialquil (C₁-C₆) ureido, haloalquil (C₁-C₆) sulfonilamino,
alcoxi (C₁-C₆) carbonilalquil (C₁-C₆) aminoalquil (C₁-C₆)
hidroxialquil (C₁-C₆) aminocarbonilaminoalquil (C₁-C₆),
haloalquil (C₁-C₆) sulfonilaminoalquil (C₁-C₆),
aminosulfonil, alquil (C₁-C₆) aminosulfonil, (alquil (C₁-
C₆))₂aminosulfonil, hidroxialquil (C₁-C₆) aminosulfonil y
alcoxi (C₁-C₆) alquil (C₁-C₆) aminosulfonil.

9. Un compuesto según la reivindicación 1, en
donde R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente halo,
halo(alquil C₁-C₆), alquil (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆),
trifluorometil, trifluorometoxi, hidroxil, aminocarbonil,
ciano, ureido, alquil (C₁-C₆) sulfonilamino, alcoxi (C₁-C₆)
carbonilamino o glicinamino.

10. Una composición farmacéutica para tratar o
prevenir un trastorno o afección seleccionado de
enfermedades auto inmunes, artritis reumatoide, diabetes
de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad
inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis,

6/10/1
380 385
32A

esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y
vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas,
osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en
adultos, síndrome del distrés respiratorio en la
infancia, lesión. por reperfusión isquémica,
glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva
crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis
atópica, inflamación asociada con infección, inflamación
viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis
crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de
tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes,
aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de
un receptor común), y enfermedades granulomatosas,
sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas
con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de
citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como
consecuencia de la reducción de la infiltración celular;
tratar enfermedades y/o insuficiencia cardíaca
congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar efisema
pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2,
VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del
Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las
secuelas asociadas con una infección, cuando dicha
infección induce la producción de citacinas inflamatorias

6 1102
381 386
585

perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

11. Una composición farmacéutica para el tratamiento o prevención de un trastorno ó afección que puede tratarse o prevenirse mediante la inhibición de la unión de quimiocinas al receptor CCR1 en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

12. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección seleccionado de enfermedades

6/103

382 387

~~386~~

autoinmunes, artritis reumatoide, diabetes de tipo I (de comienzo reciente), lupus, enfermedad inflamatoria del intestino, neuritis óptica, soriasis, esclerosis múltiple, polimialgia reumática, uveitis y vasculitis, afecciones inflamatorias agudas y crónicas, osteoartritis, síndrome del distrés respiratorio en adultos, síndrome del distrés respiratorio en la infancia, lesión. por reperfusión isquémica, glomerulonefritis y enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), afecciones alérgicas, asma y dermatitis atópica, inflamación asociada con infección, inflamación viral, gripe, hepatitis y Guillian-Barre, bronquitis crónica, rechazo crónico o agudo del trasplante de tejidos, células u órganos sólidos, xeno-trasplantes, aterosclerosis, reestenosis, infectividad por VIH (uso de un receptor común), y enfermedades granulomatosas, sarcoidosis, lepra y tuberculosis, y secuelas asociadas con cánceres, meloma múltiple; limitar la producción de citacinas y/o TNF en sitios inflamatorios como consecuencia de la reducción de la infiltración celular; tratar enfermedades y/o insuficiencia cardiaca congestiva, asociadas a TNF e IL-1, y tratar enfisema pulmonar o disnea asociada con enfisema; VIH-1, VIH-2, VIH-3; citomegalovirus (CMV), adenovirus y virus del

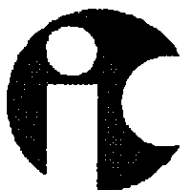
6/104

383 388

387

Herpes (*Herpes zoster* y *Herpes simplex*), para tratar las secuelas asociadas con una infección, cuando dicha infección induce la producción de citocinas inflamatorias perjudiciales y/o TNF, meningitis fungica, lesión tisular de las articulaciones, hiperplasia, formación de pannus y resorción ósea, artritis psoriática, insuficiencia hepática, meningitis bacteriana, síndrome de Kawasaki, infarto de miocardio, insuficiencia hepática aguda, enfermedad de Lyme, choque séptico, cáncer, traumatismos y malaria en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales o profármacos farmacéuticamente aceptables, que es eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.

13. Un procedimiento para tratar o prevenir un trastorno o afección que se puede tratar o prevenir antagonizando el receptor CCR1 en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que necesite dicho tratamiento o prevención una cantidad de un compuesto según la reivindicación 1, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, eficaz en el tratamiento o prevención de dicho trastorno o afección.



384

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Folio 389 **388**

2020
Bogotá DC

Doctor(a)
CARLOS R. OLARTE
Apoderado(a)
PFIZER PRODUCT INC

REFERENCIA:	Radicación No.	02-83307
	Solicitud Internacional	PCT/IB01/00375
	Fecha Inicio fase nacional	31/10/2002
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	279
	Folios	001

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 Unica 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,

19 FEB. 2004

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

202080