



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13



Industria y Comercio  
**SUPERINTENDENCIA**



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

54. TITULO \_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL \_\_\_\_\_

71. SOLICITANTE \_\_\_\_\_

DOMICILIO \_\_\_\_\_

74. APODERADO \_\_\_\_\_

22. BOGOTA, D. C., \_\_\_\_\_



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

**DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**  
**CONVERSIÓN, DIVISIÓN Y FUSIÓN DE SOLICITUDES**

**1. Identificación del Trámite**☐

Conversión

☒

División

☐

Fusión

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Registro de Diseño Industrial

☐

Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

**2. Datos del solicitante**Persona Natural ☐Persona Jurídica ☒**TETRAPHASE PHARMACEUTICALS, INC.**

Nombre o denominación / Nombre o razón social

Nombre del representante legal

Tipo de empresa

Micro ☐Pequeña ☐Mediana ☐Otra ☐

Documento de identificación:

☐

C.C.

☐

C.E.

☐

NIT

☐

Otro

Número

|                                   |                                                               |                   |  |
|-----------------------------------|---------------------------------------------------------------|-------------------|--|
| Nacionalidad/País de constitución | Domicilio Titular                                             |                   |  |
| Estados Unidos de América         | 480 Arsenal Street, Suite 110, Watertown, Massachusetts 02472 |                   |  |
| Dirección electrónica             | No. Fax                                                       | Número telefónico |  |
|                                   |                                                               |                   |  |

☒

Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

**3. Datos del apoderado:****RUBIO CAMACHO HUMBERTO****17'192.062****50.007 C.S.J.**

Apellidos y Nombre

Documento de identificación

Tarjeta profesional

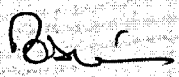
|                                      |                |                     |
|--------------------------------------|----------------|---------------------|
| Dirección y domicilio                |                | Ciudad              |
| <b>Carrera 7 # 74-64 Oficina 506</b> |                | <b>Bogotá, D.C.</b> |
| Dirección electrónica                | No. Fax        | Número telefónico   |
| <b><u>mail@rubiolawyers.com</u></b>  | <b>3131647</b> | <b>3132408</b>      |

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sirvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

|                                                             |                                                                        |                                                             |
|-------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------|
| 4. Datos del trámite                                        |                                                                        |                                                             |
| CONVERSION                                                  | DIVISION                                                               | FUSION                                                      |
| Expediente _____<br>_____<br>_____<br>De: _____<br>A: _____ | Expediente <u>11-027711</u><br>_____<br>_____<br>De: _____<br>A: _____ | Expediente _____<br>_____<br>_____<br>De: _____<br>A: _____ |

|                            |            |        |            |
|----------------------------|------------|--------|------------|
| 5. Comprobante de Pago No. | 14-0087062 | Fecha: | 13/08/2014 |
|                            | 14-0087063 |        | 13/08/2014 |

|                                                                                                                     |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6. Anexos                                                                                                           |
| <input checked="" type="checkbox"/> Comprobante de pago de la tasa. de presentación y Excedente de Reivindicaciones |
| <input type="checkbox"/> Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación                           |
| <input type="checkbox"/> Número de documento que ordena la comisión o fusión o división                             |
| <input checked="" type="checkbox"/> Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud         |
| <input type="checkbox"/> Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético                                    |

|                                                                                     |                               |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|
| 7. Firma                                                                            |                               |
|  | <b>HUMBERTO RUBIO CAMACHO</b> |
| Firma                                                                               | Nombre y apellidos            |
| <b>17'192.062</b>                                                                   | <b>50.007 C.S.J.</b>          |
| C.C                                                                                 | Tarjeta Profesional           |

## SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

3



## RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0087062

Bogotá D.C., Agosto 13 de 2014 - 11:42:35

RECIBIDO DE : HUMBERTO RUBIO &amp; CIA

NI 8.300.002.283

## \*\*\* Soporte del Pago \*\*\*

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR. PAGO     |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|--------------|
| CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 644076532 | 13/08/2014 | 2.072.000.00 |

## \*\*\* Conceptos Pagados \*\*\*

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                                                     | Vr. UNIDITARIO | Vr. CONCEPTO |
|-------|-------------------------|--------------------------------------------------------------|----------------|--------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 2205 DIVISIONAL SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN CONT. DERE | 464.000.00     | 464.000.00   |
|       |                         |                                                              |                | \$464.000.00 |

SON: \*\*CUATROCIENTOS SESENTA Y CUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\*\*

Responsable: \_\_\_\_\_

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO4



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

DIVISIONAL

COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pls 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Agosto 13 de 2014 - 11:42:36

3

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**NIT : 800.176.089-2**

- / -



**Industria y Comercio**  
SUPERINTENDENCIA

**RECIBO DE CAJA**

**No. 14 - 0087063**

Bogotá D.C., Agosto 13 de 2014 - 11:42:35

RECIBIDO DE : HUMBERTO RUBIO & CIA

NI 8.300.002.283

\*\*\* Soporte del Pago \*\*\*

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR PAGO      |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|--------------|
| CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 644076532 | 13/08/2014 | 2.072.000.00 |

\*\*\* Conceptos Pagados \*\*\*

| CANT.          | RENTISTICO  | CONCEPTO                                                        | Vr.UNDITARIO | Vr.CONCEPTO         |
|----------------|-------------|-----------------------------------------------------------------|--------------|---------------------|
| 10 50005-01-01 | SOLICITUDES | 1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA<br>ADICIONAL A LAS 10 INIC | 31.000.00    | 310.000.00          |
|                |             |                                                                 |              | <b>\$310.000.00</b> |

**SON: \*\*TRESCIENTOSDIEZ MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\***

Responsable: \_\_\_\_\_

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. \_\_\_\_\_

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**No. 14-176831- -00000-0000**

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**No. 11-027711- -00021-0000**

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

**EXCEDENTE DE REIVINDICACION**

**COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7**

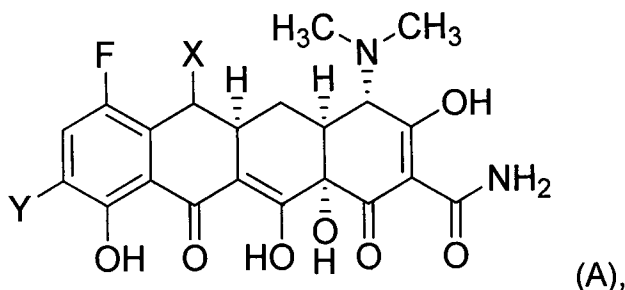
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: [www.sic.gov.co](http://www.sic.gov.co) e-mail: [info@sic.gov.co](mailto:info@sic.gov.co) Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Agosto 13 de 2014 - 11:42:36

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la Fórmula Estructural (A):



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde:

X se selecciona entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), carbociclilo, arilo y heteroarilo;

Y se selecciona entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), carbociclilo, -alquilen ( $C_1-C_4$ )- $N(R^A)(R^B)$ , -alquilen ( $C_1-C_4$ )- $N(R^F)-C(O)-[C(R^D)(R^E)]_{0-4}-N(R^A)(R^B)$ , - $CH=N-OR^A$ , - $N(R^A)(R^B)$ , - $N(R^F)-C(O)-[C(R^D)(R^E)]_{1-4}-N(R^A)(R^B)$ , - $N(R^F)-C(O)-N(R^A)(R^B)$ , - $N(R^F)-C(O)$ -alquilo ( $C_1-C_6$ ), - $N(R^F)-C(O)$ -heterociclilo, - $N(R^F)-C(O)$ -heteroarilo, - $N(R^F)-C(O)$ -carbociclilo, - $N(R^F)-C(O)$ -arilo, - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen ( $C_1-C_4$ )- $N(R^A)(R^B)$ , - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen ( $C_1-C_4$ )-carbociclilo, y - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen ( $C_1-C_4$ )-arilo donde:

al menos uno de X e Y no es hidrógeno;

cada  $R^A$  y  $R^B$  se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), -O-alquilo ( $C_1-C_7$ ), -alquilen ( $C_0-C_6$ )-carbociclilo, -alquilen ( $C_0-C_6$ )-arilo, -alquilen ( $C_0-C_6$ )-heterociclilo, -alquilen ( $C_0-C_6$ )-heteroarilo, -alquilen ( $C_1-C_6$ )-O-carbociclilo, -alquilen ( $C_1-C_6$ )-O-arilo, -alquilen ( $C_1-C_6$ )-O-heterociclilo, -alquilen ( $C_1-C_6$ )-O-heteroarilo, - $S(O)_m$ -alquilo ( $C_1-C_6$ ), -alquilen ( $C_0-C_4$ )- $S(O)_m$ -carbociclilo, -alquilen ( $C_0-C_4$ )- $S(O)_m$ -arilo, -alquilen ( $C_0-C_4$ )- $S(O)_m$ -heterociclilo y -alquilen ( $C_0-C_4$ )- $S(O)_m$ -heteroarilo; o

$R^A$  y  $R^B$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclilo o heteroarilo, donde el heterociclo o heteroarilo comprende opcionalmente de 1 a 4 heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, S y O;

cada  $R^D$  y cada  $R^E$  se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_6$ ), carbociclilo, arilo, heterociclilo, heteroarilo, o un resto de cadena lateral de aminoácidos naturales, o

$R^D$  y  $R^E$  tomados junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclilo de 3-7 miembros, o un heterociclilo de 4-7 miembros, donde el heterociclilo formado por  $R^D$  y  $R^E$  comprende opcionalmente de uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente

entre N, S y O;

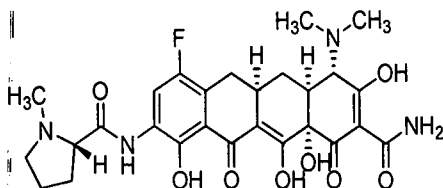
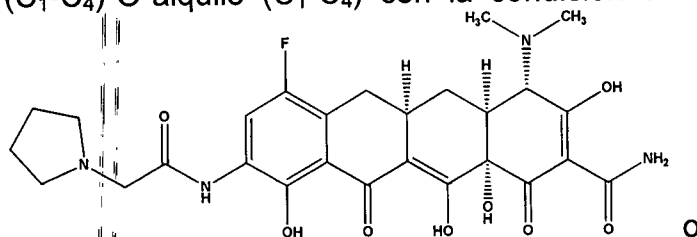
$R^F$  se selecciona entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), carbociclilo, arilo y heteroarilo; y

$m$  es 1 o 2, donde:

5 cada carbociclilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-OH$ ,  $=O$ ,  $-O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-alquil$  ( $C_1-C_4$ )- $O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-alquilo$  ( $C_1-C_4$ ) halo-sustituido,  $-O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ) halo-sustituido,  $-C(O)$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-C(O)$ -(alquilo ( $C_1-C_4$ ) fluoro-sustituido),  $-S(O)_m$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-N(R^G)(R^G)$ , y  $CN$ ;

10 cada alquilo del grupo representado por  $R^A$ ,  $R^B$ ,  $R^D$  y  $R^E$  está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-OH$ ,  $-O$ -alquilo ( $C_1-C_7$ ),  $-alquil$  ( $C_1-C_4$ )- $O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ),  $-alquilo$  ( $C_1-C_4$ ) fluoro-sustituido,  $-S(O)_m$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ), y  $-N(R^G)(R^G)$ , donde

15 cada  $R^G$  es hidrógeno o alquilo ( $C_1-C_4$ ), donde cada alquilo del grupo representado por  $R^G$  está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo entre  $-alquilo$  ( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), halo,  $-OH$ ,  $-O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ), y alquil ( $C_1-C_4$ )- $O$ -alquilo ( $C_1-C_4$ ) con la condición de que el compuesto no sea



2. Un compuesto de la reivindicación 1, donde

25  $X$  se selecciona entre hidrógeno, metilo, etilo y fenilo; e  $Y$  se selecciona entre hidrógeno,  $-(alquilo\ C_1-C_4)$ ,  $-alquilen\ (C_1-C_4)-N(R^A)(R^B)$ ,  $-alquilen\ (C_1-C_4)-NH-C(O)-[CH_2]_{0-1}-N(R^A)(R^B)$ ,  $-N(R^A)(R^B)$ ,  $-NH-C(O)$ -carbociclilo,  $-NH-C(O)$ -arilo,  $-NH-C(O)$ -heterociclilo,  $-NH-C(O)$ -heteroarilo,  $-NH-C(O)-N(R^A)(R^A)$ ,  $-N(R^F)-C(O)-CH_2-N(R^A)(R^B)$ ,  $-NH-C(O)-C(R^D)(R^E)-N(R^A)(R^B)$  y  $-NH-S(O)_m$ -alquilen ( $C_1-C_4$ )- $N(R^A)(R^B)$ ;

30 cada  $R^A$  se selecciona independientemente entre hidrógeno y metilo;  $R^B$  se selecciona entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ),  $-alquilen\ (C_0-C_6)$ -

carbociclilo, -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-arilo, -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>6</sub>)-heteroarilo, -S(O)<sub>m</sub>-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-carbociclilo, -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-arilo, -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-heterociclo y -alquilen (C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-heteroarilo; o

5        R<sup>A</sup> y R<sup>B</sup>, cuando están unidos a un átomo de nitrógeno común, se toman junto con el átomo de nitrógeno para formar un heterociclo, donde el heterociclo está opcionalmente sustituido con =O y -N(R<sup>G</sup>)(R<sup>G</sup>);

      R<sup>D'</sup> y R<sup>E</sup> se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>); y

10        m es 1 o 2;

      cada carbociclilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) halo-sustituido, -O-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y -N(R<sup>G</sup>)(R<sup>G</sup>);

15        cada parte alquilo del grupo representado por Y o R<sup>B</sup> está opcional e independientemente sustituida con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, -OH, y -N(R<sup>G</sup>)(R<sup>G</sup>), donde

      R<sup>G</sup> es hidrógeno o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y donde cada alquilo del grupo representado por R<sup>G</sup> está opcional e independientemente sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>).

20

3.        Un compuesto de la reivindicación 1, donde

      X se selecciona entre hidrógeno y metilo; e

      Y se selecciona entre -N(R<sup>A</sup>)(R<sup>B</sup>), -N(H)-C(O)-carbociclilo, -N(H)-

25        C(O)-arilo, -N(H)-C(O)-heterociclo, y -N(H)-C(O)-heteroarilo;

donde:

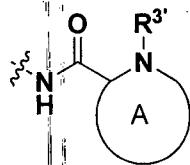
      R<sup>A</sup> es hidrógeno; y

      R<sup>B</sup> se selecciona entre alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y -S(O)<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>; o

      R<sup>A</sup> y R<sup>B</sup> se toman juntos para formar un anillo heterocíclico de 4-7 miembros; donde cada carbociclilo, arilo, heteroarilo, o heterociclo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre -CH<sub>3</sub>, fluoro, y -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>.

30

4.        Un compuesto de la reivindicación 1, donde

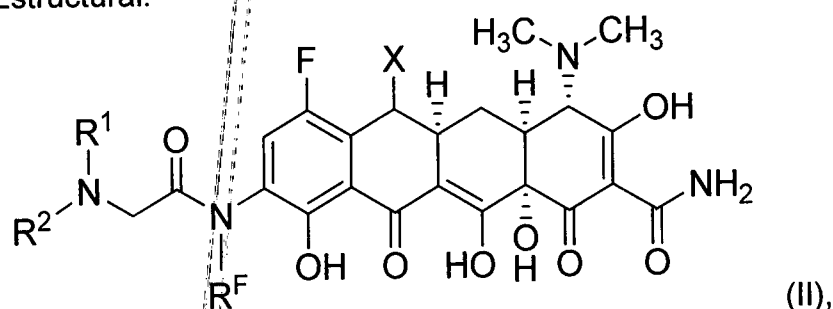


35

Y es        , donde el anillo A representa un heterociclilo de 4-7 miembros; y R<sup>3'</sup> es hidrógeno o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>).

5.        El compuesto de la reivindicación 1, donde el compuesto se representa por

la Fórmula Estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde:

5 cada uno de  $R^1$  y  $R^2$  se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), cicloalquil ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_7$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalcoxi ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), arilo, arilalquilo ( $C_1-C_4$ ), ariloxialquilo ( $C_1-C_4$ ), ariltioalquilo ( $C_1-C_4$ ), arilsufinilalquilo ( $C_1-C_4$ ), arilsulfonilalquilo ( $C_1-C_4$ ), y -O-alquilo ( $C_1-C_7$ ), o

10  $R^1$  y  $R^2$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, O y S; y

15 donde cada resto alquilo, cicloalquilo, alcoxi y cicloalcoxi en los grupos representados por  $R^1$  y  $R^2$  y cada heterociclo representado por  $NR^1R^2$  tomados conjuntamente están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, -OH, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), alquiltio ( $C_1-C_4$ ), alquilsulfinilo ( $C_1-C_4$ ), alquilsulfonilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), y

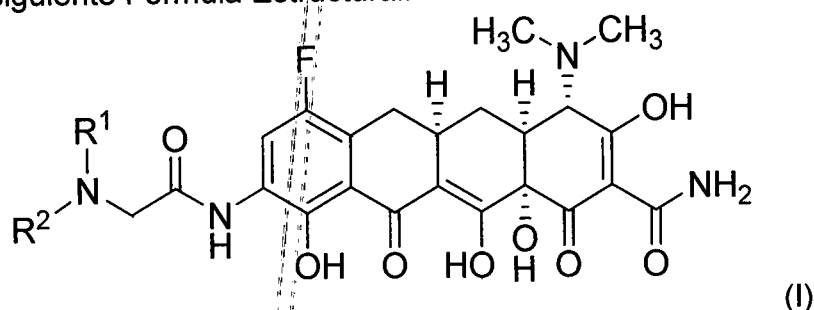
20 - $N(R^3)(R^4)$ ; y cada resto arilo, ariloxi, ariltio, arilsufinilo y arilsulfonilo en los grupos representados por  $R^1$  y  $R^2$  y cada heteroarilo representado por  $NR^1R^2$  tomados conjuntamente están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que

25 consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, -OH, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), -S-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -S(O)-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -S(O)<sub>2</sub>alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), - $N(R^3)(R^4)$ , -CN, haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), y haloalcoxi ( $C_1-C_4$ ), y

30 cada uno de  $R^3$  y  $R^4$  se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en -H y alquilo ( $C_1-C_4$ ), donde el alquilo ( $C_1-C_4$ ) representado por  $R^3$  y  $R^4$  está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, -OH, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), y alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ).

35 6. El compuesto de la reivindicación 5, donde el compuesto está representado

por la siguiente Fórmula Estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde

5 cada uno de  $R^1$  y  $R^2$  se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_7$ ), cicloalquil ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_7$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalcoxi ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), arilo, arilalquilo ( $C_1-C_4$ ), ariloxialquilo ( $C_1-C_4$ ), ariltioalquilo ( $C_1-C_4$ ), arilsufinilalquilo ( $C_1-C_4$ ), arilsulfonilalquilo ( $C_1-C_4$ ); o

10  $R^1$  y  $R^2$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, O y S.

15 7. El compuesto de la reivindicación 6, donde  $R^1$  es hidrógeno o un alquilo ( $C_1-C_4$ ).

8. El compuesto de las reivindicaciones 6 o 7, donde  $R^2$  se selecciona entre alquilo ( $C_1-C_7$ ), cicloalquil ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_7$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ),  
20 fenilo, fenilalquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) y haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), donde cada resto alquilo, alcoxi y cicloalquilo en los grupos representados por  $R^2$  está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ) y halo; y cada resto fenilo en los grupos representados por  $R^2$  está opcionalmente sustituido con  
25 uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -CN, haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), y haloalcoxi ( $C_1-C_4$ ).

9. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 6-8, donde  $R^1$  se  
30 selecciona entre hidrógeno, metilo y etilo.

10. El compuesto de la reivindicación 9, donde  $R^2$  se selecciona entre el grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, fenilo, bencilo,  $-(CH_2)_2-O-CH_3$ ,  $-(CH_2)_3-OCH_3$ ,  $-C(CH_3)_3$ ,  $-CH(CH_3)_2$ ,  $-CH_2C(CH_3)_3$ ,  $-CH_2CH(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-CF_3$ ,  $-(CH_2)_2-CH_2F$ , y  $-(CH_2)_nCH_3$ ; n es 0, 1, 2,  
35 3, 4, 5 o 6; y donde el grupo fenilo o bencilo representado por  $R^2$  está

opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), halógeno, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -CN, haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

5

11. El compuesto de la reivindicación 10, donde R<sup>2</sup> se selecciona entre ciclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>3</sub> y -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

10

12. El compuesto de la reivindicación 6, donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre N, O y S; y el heterociclo está  
15 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), halo, -OH, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfínilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y -N(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>); y el heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo  
20 que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), halo, -OH, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)<sub>2</sub>alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), N(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>), -CN, haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

25

13. El compuesto de la reivindicación 12, donde R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo seleccionado entre el grupo que consiste en azetidina, pirrolidina, morfolina, piperidina, octahidrociclopenta[c]pirrol, isoindolina, y azabicyclo[3.1.0]hexano, donde el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
30 halógeno, -OH, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)<sub>2</sub>alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y -N(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>).

35

14. El compuesto de la reivindicación 13, donde el heterociclo está opcionalmente sustituido con halógeno, metoxi, hidroxilo, un grupo metoximetilo o dimetilamino.

40

15. El compuesto de la reivindicación 6, donde:

- a) R<sup>1</sup> es metilo, y R<sup>2</sup> es ciclopropilo;
- b) R<sup>1</sup> es hidrógeno, y R<sup>2</sup> es ciclopropilo;
- c) R<sup>1</sup> es hidrógeno, y R<sup>2</sup> es ciclobutilo;

- 5
- d)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es ciclobutilo;  
 e)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es ciclopropilmetilo;  
 f)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es ciclobutilmetilo;  
 g)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es bencilo;  
 h)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es metoxipropilo;  
 i)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es metoxietilo;  
 j)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es fenilo;  
 k)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es t-butilo;  
 l)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es t-butilo;  
 10 m)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es metilo;  
 n)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es etilo;  
 o)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es propilo;  
 p)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es butilo;  
 q)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es pentilo;  
 15 r)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es hexilo;  
 s)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es heptilo;  
 t)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es metilo;  
 u)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es isopropilo;  
 v)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es 2,2-dimetilpropilo;  
 20 w)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es trifluoroetilo;  
 x)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es 2-metilpropilo;  
 y)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es 3-fluoropropilo;  
 z)  $R^1$  es etilo, y  $R^2$  es etilo;  
 a)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es metilo;  
 25 b)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es hidrógeno;  
 c)  $R^1$  es hidrógeno, y  $R^2$  es ciclopentilo;  
 d)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es ciclopentilo; o  
 e)  $R^1$  es metilo, y  $R^2$  es propilo,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

- 30
16. El compuesto de la reivindicación 6, donde  $R^1$  y  $R^2$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un grupo seleccionado entre:
- 35
- a) azetidin-1-ilo;  
 b) 3-fluoroazetidin-1-ilo;  
 c) 3-metilazetidin-1-ilo;  
 d) 3-metoxiazetidin-1-ilo;  
 f) morfolin-4-ilo;  
 g) 3-fluoropirrolidin-1-ilo;  
 h) 3-hidroxipirrolidin-1-ilo;  
 40 i) 3-N,N-dimetilaminopirrolidin-1-ilo;

- j) 2-metoximetilpirrolidin-1-ilo;
- k) piperidin-1-ilo;
- l) octahidrociclopenta[c]pirrol-2-ilo;
- m) isoindolin-2-ilo; y
- n) 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-ilo,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

17. El compuesto de la reivindicación 6, donde

$R^1$  es hidrógeno o un alquilo ( $C_1-C_4$ ); y

$R^2$  se selecciona entre alquilo ( $C_1-C_7$ ), cicloalquil ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_7$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), fenilo, fenilalquilo ( $C_1-C_4$ ), cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) y haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), donde cada resto alquilo, alcoxi y cicloalquilo en los grupos representados por  $R^2$  está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ) y halo; y cada resto fenilo en los grupos representados por  $R^2$  está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -CN, haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), y haloalcoxi ( $C_1-C_4$ ); o

$R^1$  y  $R^2$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre N, O y S; y el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, -OH, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), alquiltio ( $C_1-C_4$ ), alquilsulfinilo ( $C_1-C_4$ ), alquilsulfonilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), y -N( $R^3$ )( $R^4$ ); y el heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo ( $C_1-C_4$ ), halo, -OH, alcoxi ( $C_1-C_4$ ), -S-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -S(O)-alquilo ( $C_1-C_4$ ), -S(O)<sub>2</sub>alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_4$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), N( $R^3$ )( $R^4$ ), -CN, haloalquilo ( $C_1-C_4$ ), y haloalcoxi ( $C_1-C_4$ ).

18. El compuesto de la reivindicación 5, donde

$R^1$  es hidrógeno, metilo, etilo, metoxi o terc-butoxi;

$R^2$  se selecciona entre alquilo ( $C_1-C_7$ ), cicloalquil ( $C_3-C_6$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), alcoxi ( $C_1-C_7$ )-alquilo ( $C_1-C_4$ ), fenilo, cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), y fluoroalquilo ( $C_1-C_4$ ); o

$R^1$  y  $R^2$  tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo seleccionado entre pirrolidinilo, morfolinilo, azetidinilo,

piperidinilo, octahidrociclopenta[c]pirrolilo, isoindolinilo, indazolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, y tetrazolilo, donde el anillo formado por R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos está opcionalmente sustituido con fluoro, -OH, -OCH<sub>3</sub>, o N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>.

5

19. El compuesto de la reivindicación 6, donde:

R<sup>1</sup> es hidrógeno, metilo, o etilo

R<sup>2</sup> se selecciona entre metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2,2-dimetilpropilo, t-butilo, isobutilo, n-pentilo, cicloalquilo (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilmetilo (C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>), metoxietilo, y 2-fluoroetilo; o

10

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo seleccionado entre azetidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, tetrazolilo, u octahidrociclopenta[c]pirrolilo, y donde el anillo formado por R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos está opcionalmente sustituido con fluoro.

15

20. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable y un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-19 o una sal del mismo.