

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-063884- -00012-0000

Fecha: 2013-05-14 16:55:23 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 15

Re: Expediente No. 11-063.884

Solicitud de patente de invención titulada: "MODULADORES DE ARIL METIL
BENZOQUINAZOLINONA ALOSTÉRICOS POSITIVOS DEL RECEPTOR M1"

Solicitante: MERCK SHARP & DOHME CORP.

Nuestra Ref.: P2011/000098

RESPUESTA AL OFICIO No. 23259, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 451
DE FECHA 26 DE DICIEMBRE DE 2012
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

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 solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, y haciendo uso de la suspensión de términos provista en la Resolución 79218 del 20 de diciembre de 2012, mediante la cual se suspendieron los términos en 2 días, el 24 y 31 de diciembre de 2012, y haciendo uso de la suspensión de términos provista en la Resolución 5540 del 23 de febrero de 2013, mediante la cual se suspendieron los términos en 2 días, el 26 y 27 de marzo de 2013, en los siguientes términos

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad el Capítulo Reivindicatorio Modificado voluntariamente el 12 de septiembre de 2011.

Así entonces, el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto contiene los siguientes cambios:

- se eliminaron las Reivindicaciones 2 a 4;
- en la Reivindicación 1 se limitó el significado de Q, X, Y y Z de acuerdo con las antiguas Reivindicaciones 2, 3 y 4, y se limitaron los radicales R^1 , R^2 y R^3 ;
- en la nueva Reivindicación 2 (antigua Reivindicación 5), se limitó el número de átomos de carbono de uno a cuatro en los grupos metoxialquilo y alquilo;
- en la nueva Reivindicación 3 (antigua Reivindicación 6), se eliminaron los grupos arilo y heteroarilo de R^1 ;
- en la nueva Reivindicación 4 (antigua Reivindicación 7), se limitó el número de átomos de carbono de tres a seis del grupo cicloalquilo de R^2 ;
- en la nueva Reivindicación 5 (antigua Reivindicación 8), se eliminó el grupo arilo y se limitó el número de átomos de carbono de uno a cuatro en el grupo alquilo de R^2 ;
- en la nueva Reivindicación 9 (antigua Reivindicación 12), se limitó el significado de R^2 ,



R^1 , R^3 y Z, a (1S, 2S), Cl, CH_3 y N, respectivamente;

- en las nuevas Reivindicaciones 10 y 12 (antiguas Reivindicaciones 13 y 15), se aclaró que el significado de R^2 y R^3 se define en la Reivindicación 1, se limitó el significado del grupo heteroarilo en R^7 , se limitó el número de átomos de carbono de uno a cuatro en los grupos metoxialquilo y alquilo, y se eliminaron los grupos alquenilo C_{2-6} , $S(=O)_nR^4$ y $NR^{5A}R^{5B}$;
- en las nuevas Reivindicaciones 11 y 13 (antiguas Reivindicaciones 14 y 16), se limitó el significado de R^2 y R^7 ;
- en la nueva Reivindicación 18 (antigua Reivindicación 21), se limitó el significado de R^2 y Q^7 ;
- se introdujeron las nuevas Reivindicaciones 20 a 24 que reclaman específicamente los compuestos de los Ejemplos 1, 2, 9, 13 y 15.

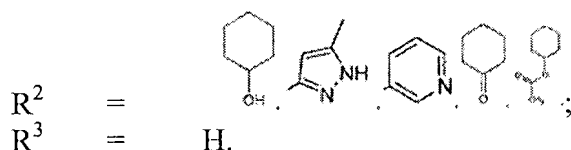
Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial, por el contrario, éstas corresponden a una franca limitación de la materia inicialmente reclamada.

2. a- La Examinadora señala que las Reivindicaciones 1, 13, 15, 17 y 18 son excesivamente amplias comprendiendo compuestos que van más allá de lo sustentado en el

Capítulo Descriptivo, y porque comprende términos indefinidos tales como “arilo”, “heteroarilo” y “heterocíclico”.

La Examinadora indica que el Capítulo Descriptivo sólo provee soporte para compuestos donde:

X y Q = CH;
Y = N o CH;
Z = N o CH;
R¹ = O-CH₃, pirazol, -CN, -SO₂CH₃, halógeno, alquiloC₁₋₄
opcionalmente sustituido con hidroxí;



La Examinadora sugiere limitar la materia reclamada a una generalización razonable de acuerdo con los compuestos probados o sintetizados.

Finalmente, la Examinadora señala que en la Reivindicación 1, el término “E” no es claro, y que la Reivindicación 21 en la cual se reclama un compuesto de Fórmula (V), debería depender de la Reivindicación 1.

b- i) En primer lugar, llamo respetuosamente la atención de la Examinadora sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto que presenta las limitaciones y modificaciones explicadas en el punto 1 del presente memorial, y de manera más específica corresponden a:

- la limitación del significado de Q, X, Y y Z, así ahora, Q es C, X e Y son cada uno CH y Z es N, o X, Y y Z son cada uno CH, y Q es C, o X y Z son cada uno CH, Q es C y Y es N. Esta modificación encuentra sustento en las Reivindicaciones originales 2 a 4;
- la limitación del significado de R¹, definiendo el grupo heteroarilo con tan solo cinco átomos cíclicos seleccionados a partir de C o N, al menos uno de los cuales es N; limitando el número de átomos del grupo metoxialquilo y alquilo, eliminando los términos arilo, alquenciloC₂₋₆, S(=O)_n-R₄, -NR^{5A}R^{5B}, y la condición “siempre y cuando Q es N entonces R¹ está ausente”;
- la limitación del significado de R², eliminando el término arilo, limitando el grupo heteroarilo a seis átomos cíclicos seleccionados a partir de C o N

al menos uno de los cuales es N, y el número de átomos de carbono del grupo cicloalquilo y alquilo;

- la limitación del significado de R^3 , así ahora, R^3 solamente significa hidrógeno y alquilo C_{1-4} ;
- en la nueva Reivindicación 2 (antigua Reivindicación 5), se limitó el número de átomos de carbono de uno a cuatro en los grupos metoxialquilo y alquilo de R^1 ;
- en la nueva Reivindicación 3 (antigua Reivindicación 6), se eliminaron los grupos arilo y heteroarilo de R^1 ;
- en la nueva Reivindicación 4 (antigua Reivindicación 7), se limitó el número de átomos de carbono de tres a seis en el grupo cicloalquilo de R^2 ;
- en la nueva Reivindicación 5 (antigua Reivindicación 8), se eliminó el grupo arilo y se limitó el número de átomos de carbono de uno a cuatro en el grupo alquilo de R^2 ;
- en la nueva Reivindicación 9 (antigua Reivindicación 12), se limitó el



significado de R^2 , R^1 , R^3 y Z, a (1S, 2S), Cl, CH_3 y N, respectivamente;

- en las nuevas Reivindicaciones 10 y 12 (antiguas Reivindicaciones 13 y 15), se aclaró que el significado de R^2 y R^3 se define en la Reivindicación 1, el significado de R^7 es hidrógeno, un grupo heteroarilo que tiene cinco átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos seleccionados de C o N donde por lo menos uno de los cuales es N, halógeno, -CN, -O-alquilo C_{1-4} , -alquilo C_{1-4} ;
- en las nuevas Reivindicaciones 11 y 13 (antiguas Reivindicaciones 14 y 16), se limitó el significado de R^2 y R^7 ;
- en la nueva Reivindicación 18 (antigua Reivindicación 21), se limitó el significado de R^2 y Q' ; y
- por último, se introdujeron las nuevas Reivindicaciones 20 a 24 que reclaman específicamente los compuestos de los Ejemplos 1, 2, 9, 13 y 15.

Ahora bien, en cuanto a que la Reivindicación 18 (antigua Reivindicación 21) debería ser dependiente de la Reivindicación 1, me permito señalar que, de acuerdo con el INSTRUCTIVO EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD,

la solicitud puede contener más de una reivindicación independiente.¹ Además, las Reivindicaciones 1 y 18 del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto tienen unidad de invención, por lo cual considero que la presencia de estas Reivindicaciones independientes, no afecta el requisito de claridad.

ii) Ahora bien, me permito resaltar que un inventor está en su derecho de reclamar protección para la totalidad de un concepto inventivo desarrollado, sin importar la amplitud de éste, siempre y cuando se conserve el principio de unidad de invención y no haya arte previo que afecte su patentabilidad, como en el presente caso. Es decir, una reivindicación puede ser tan amplia como se requiera para así poder enmarcar la totalidad del concepto inventivo desarrollado y no solamente las modalidades preferidas o específicamente ejemplificadas en la solicitud.

No existe requerimiento legal alguno que determine que los Ejemplos deban ilustrar todos y cada uno de los compuestos que se encuentran dentro del alcance de la invención, ya que lo fundamental es que el Capítulo Descriptivo proporcione la información necesaria para que la persona medianamente versada en la materia pueda reproducir la invención sin tener que acudir a experimentación adicional excesiva. Adicionalmente, en su examen de patentabilidad, la Examinadora no encontró documentos que afecten la patentabilidad de los compuestos reclamados, por lo que no entendería la razón técnica para restringir aún más la materia, que, por lo demás, es clara, concisa y patentable.

En el presente caso, el Capítulo Descriptivo incluye 130 Ejemplos de los compuestos de la invención, los cuales le permiten de manera clara a cualquier persona medianamente versada en la materia reproducir la invención.

Teniendo en cuenta lo anterior, considero respetuosamente que las objeciones han sido superadas en tanto la materia ahora reclamada en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto delimita de manera clara el alcance de la presente invención.

3. Por último, agradezco la opinión favorable de la Examinadora sobre la inexistencia de arte previo que afecte la patentabilidad de la materia reclamada en la presente solicitud de patente.

¹ INSTRUCTIVO EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD. Sección 2.6.4.1.

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

4. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por la Examinadora en su examen de fondo han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de patentabilidad y se proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



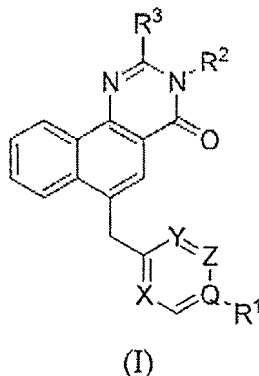
CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Capítulo Reivindicatorio Modificado

2

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto de la Fórmula (I):



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
en donde

Q es C, **X** e **Y** son cada uno CH y **Z** es N, o **X**, **Y** y **Z** son cada uno CH, y **Q** es C, o
X y **Z** son cada uno CH, **Q** es C y **Y** es N,

R¹ se selecciona del grupo que consta de

- (1) hidrógeno,
- (2) un grupo heteroarilo que tiene cinco átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos seleccionados a partir de C o N, al menos uno de los cuales es N,

- (3) halógeno,
- (4) -CN,
- (5) -O-alquiloC₁₋₄,
- (6) -alquiloC₁₋₄,

en donde dicha fracción de heteroarilo y alquilo es opcionalmente sustituida por uno
o más

- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,
- (d) -alquiloC₁₋₆,
- (e) -C(=O)-(O)_m-R⁶,
- (f) -N(R^{5A}R^{5B}),
- (g) -S(=O)_n-R⁸, o
- (h) oxo,

R² se selecciona del grupo que consta de

- (1) hidrógeno,

(2) un grupo heteroarilo que tiene entre cinco y seis átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos seleccionados a partir de C o N, al menos uno de los cuales es N,

(3) -cicloalquiloC₃₋₆,

(4) -alquiloC₁₋₄,

en donde dicha fracción de heteroarilo, alquilo y cicloalquilo es opcionalmente sustituida por uno o más

(a) halógeno,

(b) hidroxilo,

(c) -O-alquiloC₁₋₆,

(d) alquiloC₁₋₆,

(e) -S(=O)_n-R⁸,

(f) -alqueniloC₂₋₆,

(g) -CN,

(h) -C(=O)-(O)_m-R⁶,

(i) -NR^{5A}R^{5B},

(j) oxo,

(k) arilo,

(1) un grupo heteroarilo el cual es un grupo cíclico o policíclico, que tiene entre cinco y doce átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos seleccionados a partir de C, O, N o S, al menos uno de los cuales es O, N o S,

(m) un grupo heterocíclico, el cual es un grupo cíclico o policíclico no aromático que tiene entre cinco y doce átomos cíclicos seleccionados a partir de C, O, N o S, al menos uno de los cuales es O, N o S,

(n) -OC(=O)-R⁶,

en donde la fracción alquilo, alquenilo, arilo, heteroarilo o heterociclilo es opcionalmente sustituida por uno o más

(i) halógeno,

(ii) -alquilo C₁₋₆, o

(iii) -O-alquilo C₁₋₆;

R³ se selecciona del grupo que consta de

(1) hidrógeno,

(2) -alquilo C₁₋₄, y

R⁴, R⁶ y R⁸ son independientemente seleccionados a partir del grupo que consta de

(1) hidrógeno,

(2) -alquiloC₁₋₆, y

(3) -(CH₂)_n-arilo,

en donde dicha fracción alquilo o arilo R⁴, R⁶ o R⁸ alquilo es opcionalmente sustituida por uno o más

6

- (a) halógeno,
- (b) ciano, y
- (c) -O-alquiloC₁₋₆, en donde dicho alquilo es opcionalmente sustituido

por uno o más halógeno;

R^{5A} y R^{5B} son seleccionados a partir del grupo que consta de

- (1) hidrógeno,
- (2) -alquiloC₁₋₆,
- (3) -cicloalquiloC₃₋₆,
- (4) -C(=O)-O-R⁶,
- (5) -S(O)₂-R⁶,

o R^{5A} y R^{5B} están enlazados junto con el nitrógeno al cual ambos están fijados para formar un anillo carbocíclico de 2- 6 miembros, en donde uno o dos de los átomos cíclicos de carbono son opcionalmente reemplazados por un nitrógeno, oxígeno o azufre;

m es 0 o 1; y

n es 0,1 o 2.

2. Un compuesto de la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R¹ se selecciona del grupo que consta de

- (1) halógeno,
- (2) -CN,
- (3) -O-alquiloC₁₋₄, o
- (4) -alquiloC₁₋₄,

en donde dicho alquilo es opcionalmente sustituido por uno o más

- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,
- (d) -alquiloC₁₋₆,
- (e) -C(=O)-(O)_m-R⁶,
- (f) -NR^{5A}R^{5B}, o
- (g) oxo.

3. Un compuesto de la Reivindicación 2, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R¹ se selecciona del grupo que consta de

- (1) heteroarilo, en donde R¹ está opcionalmente sustituido con uno o más
- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,
- (d) -alquiloC₁₋₆, o

(e) $-S(O)_n-R^8$.

4. Un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^2 es -cicloalquiloC₃₋₆, opcionalmente sustituido con uno o más

- (a) hidroxilo,
- (b) -O-alquiloC₁₋₆, u
- (c) oxo.

5. Un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^2 se selecciona del grupo que consta de

- (1) heteroarilo, ó
- (2) -alquiloC₁₋₄, en donde dicho heteroarilo o alquilo es opcionalmente

sustituido por uno o más

- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,
- (d) -alquiloC₁₋₆,
- (e) -CN,
- (f) $-C(=O)-(O)_m-R^6$,
- (g) $-NR^{5A}R^{5B}$,
- (h) oxo,
- (i) arilo, y
- (j) heteroarilo.

6. Un compuesto de la Reivindicación 1 o a sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^3 es hidrógeno.

7. Un compuesto de la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el cual es seleccionado a partir del grupo que consta de

rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona;

3-[(1S,2S)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona;

6-(4-metoxibenzil)-3-(5-metil)-1*H*-pirazol-3-il)benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona;

6-(4-metoxibenzil)-3-piridin-3-ilbenzo[h]quinazolin-4(3H)-ona;

rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{{[6-(1-metil-1*H*-pirazol-4-il)piridina-3-il]metil}benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona;

Q

rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{[6-(1H-pirazol-1-il)piridin-3-il]metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
rac-5-({3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-4-oxo-3,4-dihidrobenzo[*h*]quinazolin-6-il}metil)piridina-2-carbonitrilo;
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{[6-metilsulfonil]piridina-3-il-metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metoxilopiridin-3-il)metil]benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
6-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-3-(2-oxiciclohexil)benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
trans-2-[6-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxobenzo[*h*]quinazolin-3(4*H*-il)ciclohexil]*rac*- acetato;
N-{(1*S*,2*S*)-2-[6-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxobenzo[*h*]quinazolin-3(4*H*-il)ciclohexil}acetamida;
3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-isopropilpiridin-3-il)metilbenzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-{[(6-(1-hidroxi-1-metiletil)piridin-3-il)metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{[6-(hidroximetil)piridina-3-il]metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-[(1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-il)metil]benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metil-1-oxidopiridin-3-il)metil]benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-(piridin-2-ilmetil)benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
6-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-2-metilbenzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

8. Un compuesto de la Reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el cual es seleccionado a partir del grupo que consta de

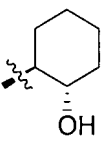
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
6-(4-metoxibenzil)-3-(5-metil)-1*H*-pirazol-3-il)benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
6-(4-metoxibenzil)-3-piridin-3-il-benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;
rac-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{[6-(1-metil-1H-pirazol-4-il)piridina-3-il]metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;

rac-3-[*trans*-2-hidrox ciclohexil]-6-{[6-(1H-pirazol-1-il)piridin-3-il]metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona;

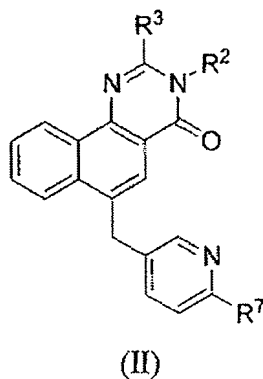
rac-5-({3-[*trans*-2-hidrox ciclohexil]-4-oxo-3,4-dihidrob enzo[*h*]quinazolin-6-il}metil)piridina-2-carbonitrilo;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. Un compuesto de la Reivindicación 1, en donde X e Y son CH, Q es C, y R^1 , R^2 , R^3 , y Z son ilustrados a continuación:

R^2	R^1	R^3	Z
 (1S, 2S)	Cl	CH ₃	N

10. Un compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto de la Fórmula (I) es un compuesto de la Fórmula (II):



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^2 y R^3 son como se definen en la Reivindicación 1, y R^7 se selecciona del grupo que consta de

- (1) hidrógeno,
- (2) Un grupo heteroarilo que tiene cinco átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos seleccionados a partir de C o N por lo menos uno de los cuales es N,
- (3) halógeno,
- (4) -CN,
- (5) -O-alquiloC₁₋₄,
- (6) -alquiloC₁₋₄;

en donde dicha fracción de heteroarilo y alquilo es opcionalmente sustituida por uno

o más

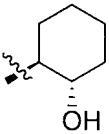
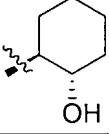
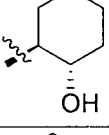
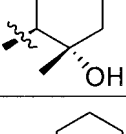
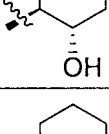
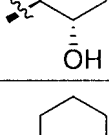
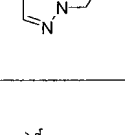
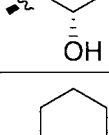
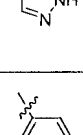
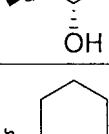
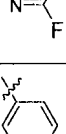
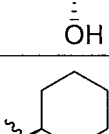
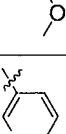
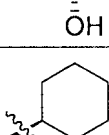
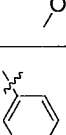
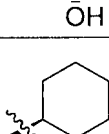
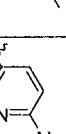
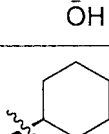
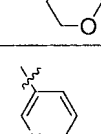
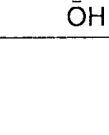
- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,

10

- (d) -alquiloC₁₋₆,
- (e) -C(=O)-(O)_m- R⁶,
- (f) -N(R^{5A}R^{5B}),
- (g) -S(=O)_n- R⁸, y
- (h) oxo.

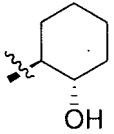
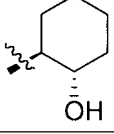
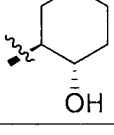
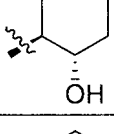
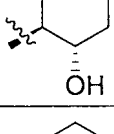
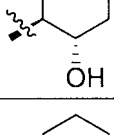
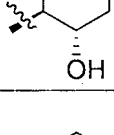
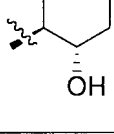
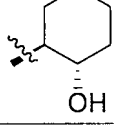
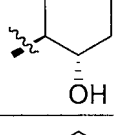
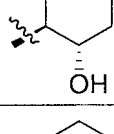
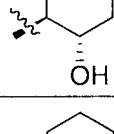
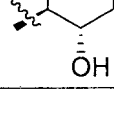
11. Un compuesto de la Reivindicación 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R³ es hidrógeno, y R² y R⁷ se unen como se ilustra a continuación:

Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
Racémica		
(1S, 2S)		
Racémica		
Racémica		Cl
(1S, 2S)		Cl
Racémica		Cl
(1S, 2S)		Cl
Racémica		
(1S, 2S)		
Racémica		

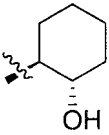
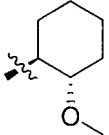
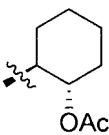
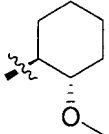
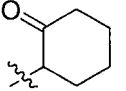
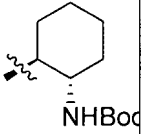
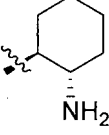
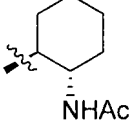
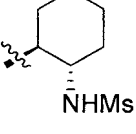
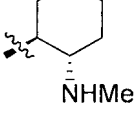
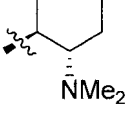
Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
Racémica		N(CH ₃) ₂
Racémica		CH ₃
(1S, 2S)		CH ₃
(1S, 2S)		CH ₃
Racémica		CN
Racémica		
Racémica		
Racémica		
Racémica		
(1S, 2S)		
Racémica		
Racémica		
(1S, 2S)		

1

Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
Racémica		
Racémica		
Racémica		
(1S, 2S)		
Racémica		
Racémica		
Racémica		SCH ₃

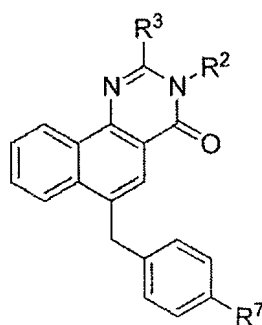
Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
(1S, 2S)		SCH ₃
Racémica		SO ₂ CH ₃
Racémica		CH ₂ =CH-
Racémica		CH ₂ CH ₃
(1S,2S)		CH ₂ CH ₃
(1S, 2S)		CH ₂ OH
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
(1S, 2S)		
Racémica		CHO
Racémica		OCH ₃
(1S, 2S)		OCH ₃

[Handwritten signature]

Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
Racémica		H
Racémica		Cl
Racémica		Cl
(1S, 2S)		CH ₃
Racémica		Cl
(1S, 2S)		Cl
(1S, 2S)		Cl
(1S, 2S)		Cl
(1S, 2S)		Cl
(1S, 2S)		Cl
(1S, 2S)		Cl

Estereoespecificidad	R ²	R ⁷
Racémica		
(1S, 2S)		

12. Un compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto de la Fórmula (I) es un compuesto de la Fórmula (III);



(III)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
en donde

R² y R³ son como se definió en la Reivindicación 1, y R⁷ se selecciona del grupo que consta de

- (1) hidrógeno,
- (2) un grupo heteroarilo que tiene cinco átomos cíclicos, dichos átomos cíclicos se seleccionan a partir de C o N por lo menos uno de los cuales es N,

- (3) halógeno,
- (4) -CN,
- (5) -O-alquiloC₁₋₄,
- (6) -alquiloC₁₋₄,

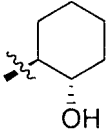
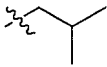
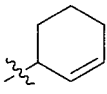
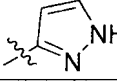
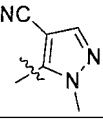
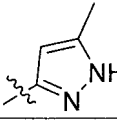
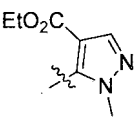
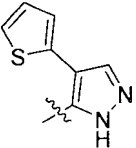
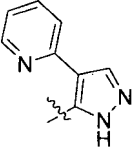
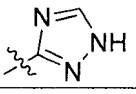
en donde dicha fracción heteroarilo y alquilo es opcionalmente sustituida por uno o más

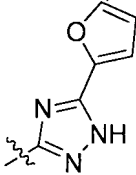
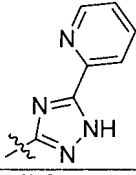
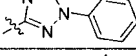
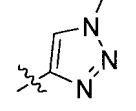
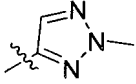
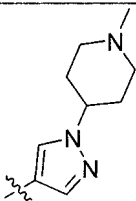
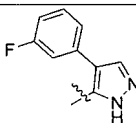
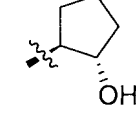
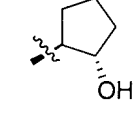
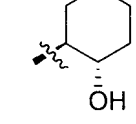
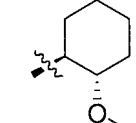
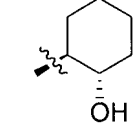
- (a) halógeno,
- (b) hidroxilo,
- (c) -O-alquiloC₁₋₆,
- (d) -alquiloC₁₋₆,
- (e) -C(=O)-(O)_m-R⁶,
- (f) -N(R^{5A}R^{5B}),

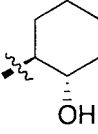
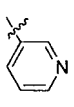
13

- (g) -S(=O)_n-R⁸, y
(h) oxo.

13. Un compuesto de la Reivindicación 12, en donde R³ es hidrógeno, y R² y R⁷ se unen a partir del grupo que consta de

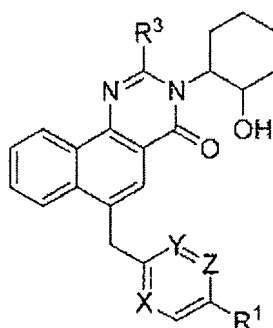
R ²	R ⁷
H	OCH ₃
Me	OCH ₃
 (racémica)	OCH ₃
3-piridilo	OCH ₃
4-piridilo	OCH ₃
	OCH ₃
CH ₂ CH ₂ CN	OCH ₃
CH ₂ CH ₂ OH	OCH ₃
 (racémica)	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃

R ²	R ⁷
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
	OCH ₃
 (racémica)	OCH ₃
 (racémica)	Cl
 (racémica)	Cl
 (racémica)	Cl
 (racémica)	

R^2	R^7
 (racémica)	

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

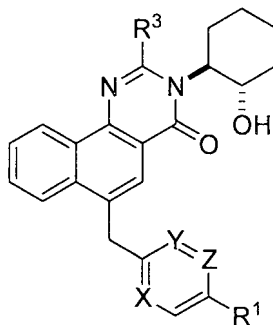
14. Un compuesto de la Reivindicación 1, en donde el compuesto de la Fórmula (I) es un compuesto de la Fórmula (IV):



(IV)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde X, Y, Z, R^1 y R^3 son como se definen en la Reivindicación 1.

15. Un compuesto de la Reivindicación 14, en donde el compuesto de la Fórmula (IV) es un compuesto de (IVA)



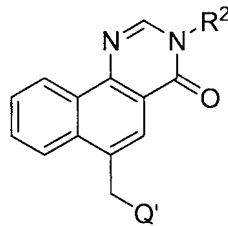
(IVA)

en donde los enlaces entre el nitrógeno de benzoquinazolina y el 1-carbono sobre el anillo ciclohexilo, y el enlace entre el hidroxilo y el 2-carbono sobre el anillo ciclohexilo, son *trans*.

16. Un compuesto de la Reivindicación 14 o 15, en donde X e Y son cada uno CH, y Z es N.

17. Un compuesto de la Reivindicación 14 o 15, en donde X, Y y Z son cada uno CH.

18. Un compuesto de la Fórmula (V),



(V)

en donde R^2 y Q' se unen como abajo:

R^2	Q'
(1S, 2S)	
(1S, 2S)	

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

19. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 y 6 a 15 y 18, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

20. Un compuesto que es rac-3-[trans-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. Un compuesto que es 3-[(1S,2S)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metilpiridin-3-il)metil]benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

22. Un compuesto que es rac-3-[trans-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-metoxipiridin-3-il)metil]benzo[h]quinazolin-4(3H)-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

15

23. Un compuesto que es 3-[(1*S*,2*S*)-2-hidroxiciclohexil]-6-[(6-isopropilpiridin-3-il)metilbenzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

24. Un compuesto que es *rac*-3-[*trans*-2-hidroxiciclohexil]-6-{[6-(hidroximetil)piridina-3-il]metil}benzo[*h*]quinazolin-4(3*H*)-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
