

723
220

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 04039911 00000002 Folios: 20
Fecha (AMD): 2004-06-08 16:36:23
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLETOS
Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de
Invencción Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS DE
QUINOLINA TERAPEUTICOS CON PROPIEDADES
ANTAGONISTAS DE 5-HT".-Clase C07D 215/42.-
Expediente número 04-039.911.-

1. Me refiero a mi Solicitud de Patente de 30 de Abril de 2004.
2. Me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante realizar leves modificaciones en las siguientes reivindicaciones del capítulo reivindicatorio originalmente presentado, como se explica a continuación:
 - En las reivindicaciones 2 a 11, se corrigieron algunos errores cometidos al momento de su redacción. Así, las nuevas reivindicaciones 2 a 11 hacen referencia a **compuestos** no a composiciones como se indicó de manera errónea en las reivindicaciones inicialmente presentadas.

El sustento para esta modificación se encuentra a lo largo de la descripción y en la reivindicación independiente número 1, a la que hacen referencia las reivindicaciones 2 a 11, en la cual aparece que se reivindica un **compuesto** y no una composición, tal y como claramente lo muestra la fórmula (I), allí revelada.

- En la reivindicación 39, se corrigieron los errores cometidos al momento de su elaboración. Es así como la nueva reivindicación 39 debe leerse como sigue: "El **compuesto** como se reivindica en la reivindicación 38, en donde R¹⁰ es clano, metoxilo, etoxilo, flúor, cloro, bromo o hldroxilo".
- En la reivindicación 43, se corrigieron algunos errores tipográficos, cometidos al momento de su traducción. Es así como en la nueva reivindicación 43 debe leerse de la siguiente forma: "El uso de cualquiera de los compuestos de las reivindicaciones 1-40 en la preparación de un medicamento para el tratamiento de depresión, ansiedad generalizada, trastornos en la alimentación, demencia, trastorno de pánico, trastornos del sueño, trastornos gastrointestinales, trastornos motores, trastornos endocrinos, vasoespasmo y disfunción sexual".

En relación con las anteriores modificaciones, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que las mismas **no amplían** de manera alguna el alcance de la presente Invención, toda vez que solamente obedecen a la enmienda de los errores que se presentaron en la redacción y traducción del texto de la presente solicitud de patente.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibo número 04-30,542 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas;
- (b) Formulario de correcciones y modificaciones; y

(c) Copia de las páginas 175 a 189 de las reivindicaciones que reemplazan aquellas presentadas originalmente, en las cuales se han realizado las modificaciones expuestas anteriormente.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. 10.784
Código 231

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una Solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: **ASTRAZENECA AB, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Suecia.**

Dirección: **S-151 85 Södertälje, Suecia.**

Teléfono: **3 264270** Fax: **6 069701**

E-mail: **jllcco@lloredacamacho.com**

Domicilio: **Södertälje, Suecia**

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **JOSE ANTONIO LLOREDA**

Dirección: **Calle 72 No. 5-83 5º Piso**

Teléfono: **3 264270** Fax: **6 069701**

E-mail: **jllcco@lloredacamacho.com**

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número 17.159.681 TP 10.784

④

Número de expediente:

04-039.911

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada: leves modificaciones a las reivindicaciones 2 a 11, 39 y 43.

⑥

Comprobante de pago No: 04-30.542

Fecha: Abril 19 de 2004

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE: JOSE ANTONIO LLOREDA

FIRMA: 

C.C. 17.159.681 TP 10.784

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

226

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 30,542
FECHA : ABRIL 19 DE 2004

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	21916890	19/04/2004	1,208,200.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEÑAS COMERCIALES	87,000.00
		TOTAL :	87,000.00

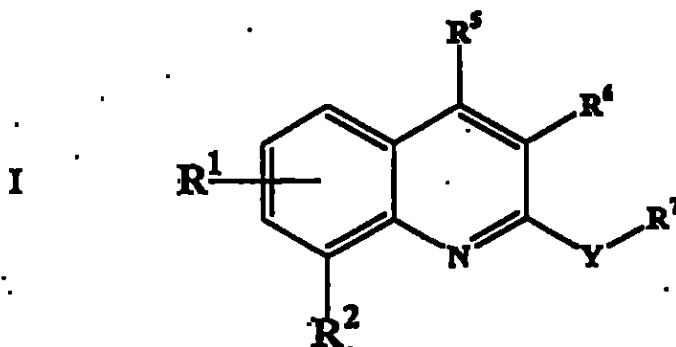
SOM: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula (I):

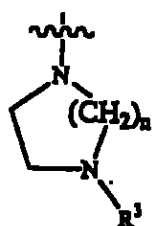


en donde

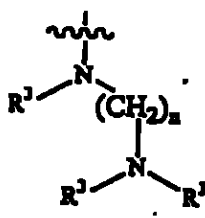
R^1 está en cada posición, representado independientemente por hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, metoxilo, tiometoxilo, -NHA, -NA₂, -NHC(=O)A, aminocarbonilo, -C(=O)NHA, -C(=O)NA₂, halógeno, hidroxilo, -OA, ciano o arilo;

A es alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido o alquinilo opcionalmente sustituido;

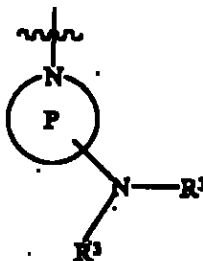
R^2 está representado por (i), (ii), (iii), o (iv) a continuación:



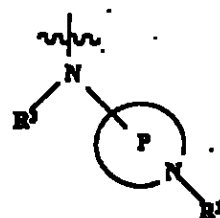
(i)



(ii)



(iii)



(iv)

R^3 es -H, alquilo C₁₋₈ opcionalmente sustituido, alquenilo C₂₋₈ opcionalmente sustituido, alquinilo C₂₋₈ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₈ opcionalmente sustituido o AOH;

n es 2, 3 o 4;

P es un anillo heterocíclico;

R⁴ es -H o alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido;

R⁵ es -H, -OR⁴, -NR⁴₂ o -SR⁴;

R⁶ es -H o metilo;

Y es -C(=O)NH-, -C(=O)NA-, -C(=O)N(A)-, -NHC(=O)-, -C(=S)NH-, -CH₂NH-,
-C(=O)CH₂-, -CH₂C(=O)-, -C(=O)-piperazina-, -C(=O)R⁶-, -N(A)C(=O)-,
-C(=S)N(A)-, -CH₂N(A), -N(A)CH₂- o un heterocíclico de 5 miembros.

R⁷ es un anillo aromático monocíclico o bicíclico o un heterociclo, opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados de R⁸-R⁹ y R¹⁰; donde R⁷ está conectado a Y por cualquiera de, un enlace sencillo o por una fusión de anillo;

R⁸ es -CH₂-, -C(=O)-, -SO₂-, -SO₂NH-, -C(=O)NH-, -O-, -S-, -S(=O)-, un heterocíclico de cinco miembros conectado a R⁷ por una fusión de anillo o un enlace sencillo como unión;

R⁹ es morfolina opcionalmente sustituida con al menos un sustituyente seleccionado de A, tiomorfolina, piperazin-R¹¹, arilo opcionalmente sustituido, heterocíclico opcionalmente sustituido, o -C(=O)CA;

R¹⁰ es alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, hidroxilo, arilo, ciano, halógeno, -C(=O)NH₂-, metiltio, -NHA, -NA₂,
-NHC(=O)A, -C(=O)NHA, -C(=O)NA₂, o OA;

R¹¹ es -H, alquilo, AOH, -SO₂A, -SO₂NH₂, -SO₂NHA, -SO₂NA₂, -SO₂NHAR⁹,
-C(=O)R⁹, -alquiloR⁹, C(=O)A, C(=O)NH₂, C(=O)NHA, C(=O)NA₂, o -C(=O)OA.

2. El compuesto como se recita en la reivindicación 1, en donde R¹ está en cada posición, representado por hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, metoxilo,

2830
227

tiometoxilo, -NHA, -NA₂, -NHC(=O)A, aminocarbonilo, -C(=O)NHA, -C(=O)NA₂, halógeno, hidroxilo, -OA, ciano o arilo en donde alquilo y cicloalquilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometilo, amino, carboxilo, carboxamido, amidino, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, alcoxilo C₁₋₄, alcanoilo C₁₋₄, alcanoiloxilo C₁₋₄, N-(Alquil C₁₋₄), N(alquil C₁₋₄)₂, alcanoilamino C₁₋₄, (alcanoil C₁₋₄)₂amino, N-(alquil C₁₋₄)carbamoilo, N,N-(C₁₋₄)₂carbamoilo, (alquil C₁₋₄)S, (alquil C₁₋₄)S(=O), (alquil C₁₋₄)SO₂, alcoxicarbonilo (C₁₋₄), N-(alquil C₁₋₄)sulfamoilo, N,N-(alquil C₁₋₄)sulfamoilo, alquilsulfonilamino C₁₋₄ o heterociclilo.

3. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 1-2, en donde A representa un alquilo opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometilo, amino, carboxilo, carboxamido, amidino, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, alcoxilo C₁₋₄, alcanoilo C₁₋₄, alcanoiloxi C₁₋₄, N-(alquil C₁₋₄), N(alquil C₁₋₄)₂, alcanoilamino C₁₋₄, (alcanoil C₁₋₄)₂amino, N-(alquil C₁₋₄)carbamoilo, N,N-(C₁₋₄)₂carbamoilo, (alquil C₁₋₄)S, (alquil C₁₋₄)S(=O), (alquil C₁₋₄)SO₂, alcoxicarbonilo (C₁₋₄), N-(alquil C₁₋₄)sulfamoilo, N,N-(alquil C₁₋₄)sulfamoilo, alquilsulfonilamino C₁₋₄ o heterociclilo.

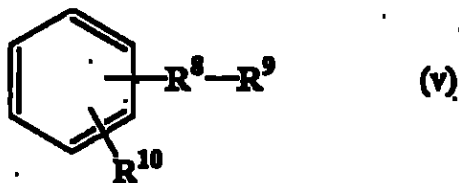
4. El compuesto como se recita en la reivindicación 3, en donde R³ es -H, alquil C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ o AOH, donde el alquilo C₁₋₆, cicloalquilo, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ y A son opcionalmente sustituidos con halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometilo, amino, carboxilo, carboxamido, amidino, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C₁₋

4, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquenilo C₃₋₆, alcoxilo C₁₋₄, alcanilo C₁₋₄, alcaniloxilo C₁₋₄, N-(alquil C₁₋₄), N(alquil C₁₋₄)₂, alcanilamino C₁₋₄, (alcanilo C₁₋₄)₂amino, N-(alquil C₁₋₄)carbamoilo, N,N-(C₁₋₄)₂carbamoilo, (alquil C₁₋₄)S, (alquil C₁₋₄)S(=O), (alquil C₁₋₄)SO₂, alcoxycarbonilo (C₁₋₄), N-(alquil C₁₋₄)sulfamollo, N,N-(alquil C₁₋₄)sulfamoilo, alquilsulfonilamino C₁₋₄ o heterociclilo.

5. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 1-4, en donde R⁷ representa un anillo aromático monocíclico o bicíclico que opcionalmente incorpora al menos un heteroátomo seleccionado de N, O y S.

6. El compuesto como se recita en la reivindicación 5, en donde el anillo aromático que opcionalmente incorpora un heteroátomo, comprende fenilo; 1- y 2-naftilo; 2-, 3- y 4-piridilo; 2- y 3-tienilo; 2- y 3-furilo, quinolilo; isoquinolilo; indolilo; benzotienilo, benzofurilo, 1-, 2- y 3-pirrolilo, imidazolilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-triazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,3,4 oxadiazolilo, benzimidazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo o triazinilo.

7. El compuesto como se recita en la reivindicación 6, en donde R⁷ es representado por la fórmula (V):

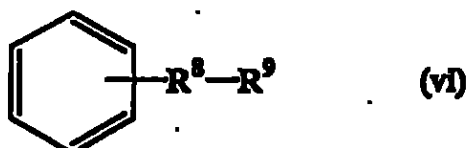


en donde R^7 es opcionalmente sustituido por al menos un sustituyente seleccionado de R^8 - R^9 y R^{10} , en donde R^8 es un enlace sencillo, $-C(=O)-$, $-CH_2-$, $-O-$, $-S-$, $-SO_2-$ ó $-S(=O)-$ como unión o un heterociclo de cinco miembros conectado a R^7 por una fusión de anillo y R^9 es morfolina opcionalmente sustituida con al menos un sustituyentes seleccionado de A, tiomorfolina, un heterociclo de 5 miembros, $-C(=O)A$, un arilo o un heterociclo, en donde el arilo o heterociclo es opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometilo, amino, carboxilo, carboxamido, amidino, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-4} , alquenilo C_{2-4} , alquinilo C_{2-4} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquenilo C_{3-6} , alcoxilo C_{1-4} , alcanoilo C_{1-4} , alcanoiloxilo C_{1-4} , NH -(alquil C_{1-4}), N -(alquil C_{1-4})₂, alcanoilamino C_{1-4} , (alcanoil C_{1-4})₂amino, N -(alquil C_{1-4})carbamoilo, N,N -(C_{1-4})₂carbamoilo, (alquil C_{1-4}) $S-$, (alquil C_{1-4}) $S(=O)-$, (alquil C_{1-4}) SO_2- , alcoxicarbonilo(C_{1-4}), N -(alquil C_{1-4})sulfamoilo, N,N -(alquil C_{1-4})sulfamoilo, alquilsulfonilamino C_{1-4} o heterociclilo.

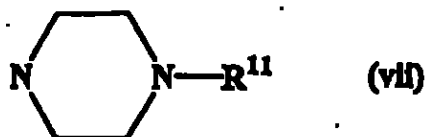
8. El compuesto como se recita en la reivindicación 7, en donde R^{10} es alquilo, hidroxilo, ciano, OA o halógeno.

9. El compuesto como se recita en la reivindicación 8, en donde R^{10} es ciano, hidroxilo, metoxilo, etoxilo o halógeno.

10. El compuesto como se recita en la reivindicación 1, en donde R^7 se representa por la fórmula (vi):



en donde R^8 es un enlace sencillo como unión y R^9 es metoxilo, ciano, un heterociclo de cinco miembros o un compuesto prepresentado por la fórmula (vii):



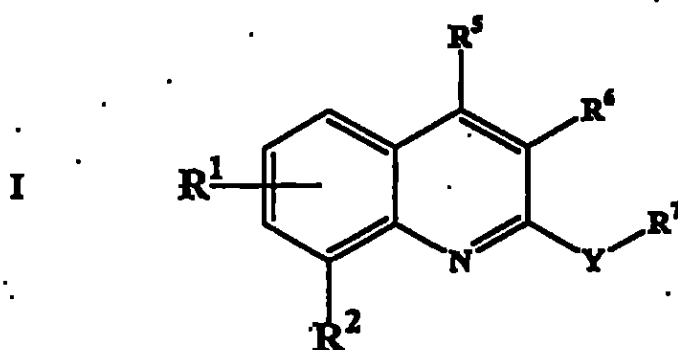
11. El compuesto como se recita en la reivindicación 10, en donde R^{11} es – H, $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $\text{SO}_2\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{SO}_2\text{-t-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NH-ciclohexilo}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-ciclopentilo}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-pirrolidina}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-morfolina}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-t-C}_4\text{H}_{10}$, CH_3OH , $\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_3$ o $\text{C}(=\text{O})\text{OC}_4\text{H}_{10}$.

12. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 1-11, en donde Y representa un anillo heterocíclico de cinco miembro que comprende uno o más heteroátomos seleccionados de S, N y O.

13. El compuesto como se recita en la reivindicación 12, en donde Y es pirrol, tiofeno, furano, imidazol, tiazol, oxazol, pirazol, isotiazol, isoxazol, 1,2,3-triazol, 1,2,3-tiadiazol, 1,2,3-oxadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-triazol, 1,3,4-tiadiazol o 1,3,4-oxadiazol.

14. El compuesto como se recita en la reivindicación 12, en donde Y es – $\text{C}(=\text{O})\text{NH-}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)\text{-}$, $-\text{NHC}(=\text{O})$, o $-\text{C}(=\text{O})\text{-piperazin-}$.

15. Un compuesto representado por la fórmula (I):

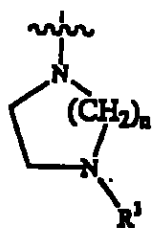


en donde

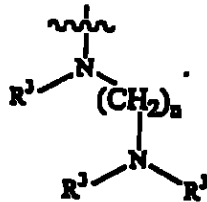
R^1 está en cada posición, representado independientemente por hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, metoxilo, tiometoxilo, -NHA, -NA₂, -NHC(=O)A, aminocarbonilo, -C(=O)NHA, -C(=O)NA₂, halógeno, hidroxilo, -OA, ciano o arilo;

A es alquilo, cicloalquilo, alquenilo o alquinilo;

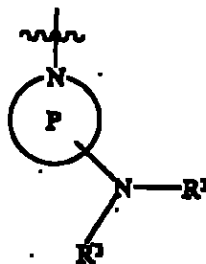
R^2 está representado por (i), (ii), (iii), o (iv) a continuación:



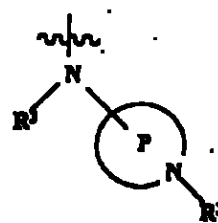
(i)



(ii)



(iii)



(iv)

R^3 es -H, alquilo C₁₋₈, alquenilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, cicloalquilo C₃₋₈ ó AOH;

n es 2 ó 3;

P es un anillo heterocíclico;

R^4 es -H o alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido o heteroalquilo opcionalmente sustituido;

R^5 es -H, -OR⁴ ó -NR⁴₂;

R^6 es -H o metilo;

Y es $-C(=O)NH-$, $-C(=O)NA-$, $-C(=O)N(A)-$, $-NHC(=O)-$, $-C(=S)NH-$, $-CH_2NH-$, $-C(=O)CH_2-$, $-CH_2C(=O)-$, $-C(=O)-$ piperazina-, $-C(=O)R^8-$, $-NAC(=O)-$, $-C(=S)N(A)-$, $-CH_2N(A)-$, $-N(A)CH_2-$ o un heterocíclico de 5 miembros.

R^7 es un anillo aromático monocíclico o bicíclico o un heterociclo, opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados de R^8 - R^9 y R^{10} ; donde R^7 está conectado a Y por cualquiera de, un enlace sencillo o por una fusión de anillo;

R^8 es $-CH_2-$, $-C(=O)-$, $-SO_2-$, $-SO_2NH-$, $-C(=O)NH-$, $-O-$, $-S-$, $-S(=O)-$, un heterocíclico de cinco miembros conectado a R^7 por una fusión de anillo o un enlace sencillo como unión;

R^9 representa morfolina opcionalmente sustituida con al menos un sustituyente seleccionado de A, tiomorfolina, piperazin- R^{11} , arilo opcionalmente sustituido, heterocíclico opcionalmente sustituido ó $-C(=O)CA$;

R^{10} es alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, hidroxilo, arilo, ciano, halógeno, $-C(=O)NH_2$, metiltio, $-NHA$, $-NA_2$, $-NHC(=O)A$, $-C(=O)NHA$, $-C(=O)NA_2$, ó OA ;

R^{11} es -H, alquilo, AOH, $-SO_2A$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NHA$, $-SO_2NA_2$, $-SO_2NHAR^9$, $-C(=O)R^9$, $-alquiloR^9$, $C(=O)A$, $C(=O)NH_2$, $C(=O)NHA$, $C(=O)NA_2$, ó $-C(=O)OA$.

16. El compuesto recitado en la reivindicación 15; en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por hidrógeno o un alquilo que posee 1-6 átomo de carbono.

17. El compuesto como se recita en la reivindicación 15, en donde R^1 es en cada posición, independientemente representado por un cicloalquilo que posee 3-6 átomos de carbono.

18. El compuesto como se recita en la reivindicación 14, en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

19. El compuesto como se recita en la reivindicación 15, en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por OA en donde A representa alquilo.

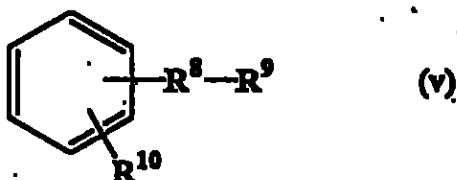
20. El compuesto como se recita en la reivindicación 15, en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por halógeno.

21. El compuesto como se recita en la reivindicación 20, donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por bromo, cloro o flúor.

22. El compuesto como se recita en la reivindicación 15, donde las mitades R^1 representan cada una independientemente hidrógeno.

23. El compuesto como se recita en cualquiera de las reivindicaciones 15-22, donde R^3 es -H ó alquilo C_{1-6} .

24. El compuesto como se recita en cualquiera de las reivindicaciones 15-22, donde R^7 es representado por la fórmula (v):

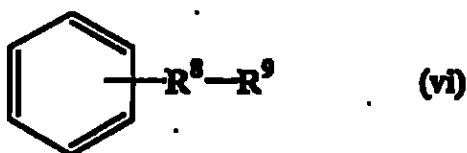


en donde R^7 es opcionalmente sustituido por al menos un sustituyente seleccionado de R^8-R^9 y R^{10} , en donde R^8 es un enlace sencillo como unión o un heterociclo de cinco miembros conectado a R^7 por una fusión de anillo y R^9 es morfolina, tiomorfolina ó $C(=O)A$.

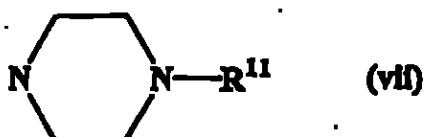
25. El compuesto como se recita en la reivindicación 15, donde R^{10} es al menos un sustituyente seleccionado de alquilo, cicloalquilo, OA, halógeno o ciano.

26. El compuesto como se recita en la reivindicación 24, donde R^{10} es ciano, hidroxilo, metoxilo, etoxilo, cloro, bromo o flúor.

27. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 15-26, donde R^7 es representado por la fórmula (vi):



en donde R^8 es un enlace sencillo como unión y R^9 es metoxilo, ciano o un compuesto representado por la fórmula (vii)



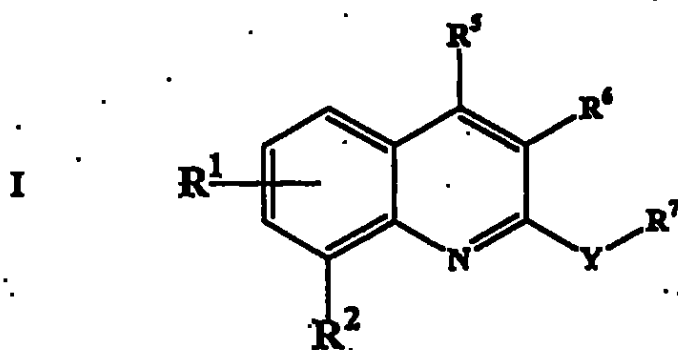
en donde R^{11} es $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $\text{SO}_2\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_4\text{H}_9$, $-\text{SO}_2\text{-i-C}_4\text{H}_9$, $-\text{SO}_2\text{-t-C}_4\text{H}_9$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NCH}_2\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{NH-ciclo-C}_6\text{H}_{12}$, $\text{C}(=\text{O})\text{-ciclo-C}_5\text{H}_9$, $\text{C}(=\text{O})\text{-pirrolidona}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-morfolina}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_4\text{H}_9$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_4\text{H}_9$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-t-C}_4\text{H}_9$, $-\text{CH}_3\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ó $-\text{C}(=\text{O})\text{OC}_4\text{H}_9$.

28. Los compuestos como se recitan en las reivindicaciones 15-27, donde Y representa un anillo heterocíclico de cinco miembros que comprende uno o más heteroátomos seleccionados de S, N y O.

29. El compuesto como se recita en la reivindicación 27, donde Y es furano, diazol, oxadiazol, pirrol, tiofeno, furano, imidazol, tiazol, oxazol, pirazol, isotiazol, isoxazol, 1,2,3-triazol, 1,2,3-tiadiazol, 1,2,3-oxadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-triazol, 1,3,4-tiadiazol ó 1,3,4-oxadiazol.

30. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 15-29, donde Y es $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)-$, $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ó $-\text{C}(=\text{O})\text{-piperazin-}$.

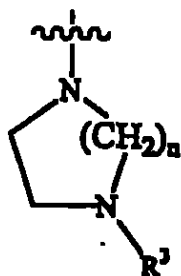
31. Un compuesto representado por la fórmula (I):



en donde R^1 está en cada posición, representado independientemente por hidrógeno, alquilo C_{1-6} , halógeno, hidroxilo, -OA o ciano;

en donde A es alquilo;

R^2 es:



(I)

R^3 es -H o alquilo C_{1-6} ,

n es 2

R^4 es -H o alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido;

R^5 es $-OR^4$ o $-NR^4_2$;

R^6 es -H o metilo;

Y es $-C(=O)NH$ o $-C(=O)$ -piperazin-;

R^7 representa fenilo opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados de R^8 - R^9 y R^{10} ;

R^8 es un heterociclo de cinco miembros conectado a R^7 por una fusión de anillo o un enlace sencillo como unión;

237

R^9 es morfolina, tiomorfolina, $-C(=O)A$ o piperazin- R^{11} ;

R^{10} es alquilo, hidroxilo, ciano, halógeno o OA;

R^{11} es $-H$, alquilo, AOH , $-SO_2A$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NHA$, $-SO_2NA_2$, $-SO_2NHAR^9$, $-C(=O)R^9$, $alquiloR^9$, $-C(=O)A$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHA$, $-C(=O)NA_2$ ó $-C(=O)OA$ ó una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto.

32. El compuesto como se recita en la reivindicación 31, en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por $-H$, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-6 , halógeno ó OA.

33. El compuesto como se recita en la reivindicación 32, en donde R^1 es, en cada posición, independientemente representado por flúor, cloro, bromo, metoxilo, etoxilo o metilo.

34. El compuesto como se recita en la reivindicación 33, en donde R^3 es metilo.

35. El compuesto como se recita en las reivindicaciones 33-34 en donde Y es $-C(=O)NH-$.

36. El compuesto como se recita en la reivindicación 35, en donde R^7 es fenilo opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados de R^8 - R^9 y R^{10} , en donde R^8 representa un heterocíclico de cinco miembros conectado a R^7 por una fusión de anillo o un enlace sencillo como unión y R^9 es morfolina opcionalmente sustituida sobre el carbono con al menos un sustituyentes seleccionado de A, piperazin- R^{11} o tiomorfolina.

-A

37. El compuesto como se recita en la reivindicación 36, en donde R^9 es morfolina.

38. El compuesto como se recita en la reivindicación 37, en donde R^{10} es ciano, OA, OH o halógeno.

39. El compuesto como se reivindica en la reivindicación 38, en donde R^{10} es ciano, metoxilo, etoxilo, flúor, cloro, bromo o hidroxilo.

40. El compuesto de la reivindicación 36, en donde R^9 es piperazin- R^{11} , en donde R^{11} es $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $-\text{SO}_2\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $-\text{SO}_2\text{-n-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{SO}_2\text{-i-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{SO}_2\text{-t-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NCH}_2\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{NH-ciclo-C}_6\text{H}_{12}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-ciclo-C}_5\text{H}_{10}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-pirrolidona}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-morfolina}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_3\text{H}_7$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_3\text{H}_7$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{C}(=\text{O})\text{-n-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-i-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{-t-C}_4\text{H}_{10}$, $-\text{CH}_3\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ó $-\text{C}(=\text{O})\text{OC}_4\text{H}_{10}$.

41. Un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-40 para el uso en el tratamiento de depresión, ansiedad generalizada, trastornos en la alimentación, demencia, trastorno de pánico, trastornos del sueño, trastornos gastrointestinales, trastornos motores, trastornos endocrinos, vasoespasmo y disfunción sexual de un animal que requiere de tal terapia.

42. Un método de tratamiento de un humano o animal que sufre de depresión, ansiedad generalizada, trastornos en la alimentación, demencia, trastorno de pánico, trastornos del sueño, trastornos gastrointestinales,

trastornos motores, trastornos endocrinos, vasoespasmo y disfunción sexual; mediante la administración a tal animal de una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula I o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto.

43. El uso de cualquiera de los compuestos de las reivindicaciones 1-40 en la preparación de un medicamento para el tratamiento de depresión, ansiedad generalizada, trastornos en la alimentación, demencia, trastorno de pánico, trastornos del sueño, trastornos gastrointestinales, trastornos motores, trastornos endocrinos, vasoespasmo y disfunción sexual.