CASTELLANOS & Co. LTDA
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Señor
Director de la Dirección de Nuevas Creacio
Superintendencia de Industria y Comercio
Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-167060- -00011-0000
Fecha: 2014-06-20 15:01:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 51

Re.: Expediente No. **11 167060**
Solicitud de Patente PCT entrada en Fase Nacional, para:
"COMPUESTOS CARBOXAMIDA Y SU USO COMO INHIBIDORES DE CALPAÍNA"
Solicitante: **ABBOTT GMBH & CO. KG – ABBVIE INC**

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

Yo, **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, obrando en mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante del asunto citado en la referencia, en atención a su oficio No. **1911** notificado el **18 de febrero de 2014** y para el cual solicité oportunamente prórroga el **08 de mayo de 2014,** atentamente me permito dar respuesta al mismo de la siguiente manera:

1. Modificación a las reivindicaciones

De acuerdo con lo establecido en el Artículo 34 de la Decisión 486 y en vista de las observaciones realizadas por el examinador, se presenta en esta oportunidad un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 24 reivindicaciones, en el cual se han realizado las siguientes modificaciones:

- En la reivindicación 1 se eliminó la alternativa que señalaba $\overline{\text{----}}$ como un doble enlace cuando R^4 está ausente. Además, se incluyeron las características de la reivindicación 5, es decir, que R^2 se limitó a fenilo opcionalmente sustituido. Se adaptó también la definición de R^4.

- De otro lado, para mayor claridad, se definen los términos arilo y hetarilo de acuerdo con lo revelado en la página 23, línea 15 en adelante y página 29, líneas 7 a 10 de la memoria descriptiva de la solicitud internacional original. Además, las reivindicaciones ya no mencionan a los tautómeros de los compuestos de fórmula I.

- Igualmente, se incluyó las definiciones de todos los radicales en cada reivindicación dependiente, tal como lo requirió el Examinador.

- Las reivindicaciones 5 y 11 se eliminaron con el fin de no repetir materia ya contenida en reivindicaciones previas. También se eliminó la reivindicación 18 ya que no se encuentra abarcada por la reivindicación 1 modificada.

- Se eliminaron las reivindicaciones de uso 27 y 29 a 33, así como la reivindicación 34, objetada por excepción a la patentabilidad.

- De acuerdo con lo anterior, se reenumeraron las reivindicaciones restantes así como sus dependencias.

Se solicita atentamente tener en cuenta este nuevo pliego reivindicatorio para el análisis de patentabilidad, toda vez que no implica una ampliación de la materia inicialmente solicitada y además permite superar las objeciones comunicadas por el examinador.

2. Claridad de las reivindicaciones

El Examinador objeta las reivindicaciones por incluir en las definiciones de R^1 los términos arilo, heteroarilo, O-arilo y CH_2-arilo, por ser considerados imprecisos. Esta objeción se supera al haber definido los términos arilo y heteroarilo en la reivindicación 1 modificada.

Además, el Examinador objeta el término "C_1-C_3-alcandiilo lineal" de la reivindicación 1, considerando que no es una definición utilizada en el campo técnico. El Solicitante respetuosamente disiente, ya que el término C_1-C_3-alcandiilo lineal se entiende claramente como un radical alifático saturado (alcan) bivalente (diilo) que tiene 1, 2 o 3 átomos de carbono como por ejemplo $-CH_2$-(metandiilo), $-CH_2-CH_2$-(1,2-etandiilo), $-CH_2-CH_2-CH_2$-(1,3-propandiilo) o $>CHCH_3$ (1,1-etandiilo).

El Examinador también objeta las reivindicaciones 14, 16 y 18 considerando que carecen de claridad al no definir algunos de los radicales. El Solicitante respetuosamente disiente, ya que dichas reivindicaciones dependen de la reivindicación 1, donde estas variables están definidas. Sin embargo, se han incluido todas las definiciones de los radicales en cada reivindicación dependiente. Por lo tanto se supera esta objeción.

Por todo lo anterior, es posible establecer que el pliego reivindicatorio es claro y conciso, cumpliendo así con los requerimientos del Artículo 30 de la Decisión 486.

3. Unidad de invención

Según la opinión del Examinador, las reivindicaciones no cumplen con el requisito de unidad invención y comprenderían en total cuatro grupos de invención, a saber:

1. un primer grupo donde el anillo heteroaromático C-Y-A-N es un anillo de pirrol;
2. un segundo grupo donde el anillo heteroaromático C-Y-A-N es un anillo de imidazol;
3. un tercer grupo donde el anillo heteroaromático C-Y-A-N es un anillo de piridina;
4. un cuarto grupo donde el anillo heteroaromático C-Y-A-N es un anillo de tiazol.

El Examinador realiza dicha afirmación porque considera que los grupos 2 a 4 están anticipados por D1 y D2. El argumento del Examinador, sin embargo, parece estar basado en una premisa equivocada, es decir, que el anillo C-Y-A-N es un anillo heteroaromático. Al contrario de lo afirmado por el Examinador, el anillo C-Y-A-N no es heteroaromático, ya que el grupo Q-R^2, el cual está unido al átomo de nitrógeno del anillo, impide la formación de un sistema de electrones aromático 6-π. Esto ocurre especialmente en la reivindicación 1 modificada, en la cual es claramente un anillo saturado, ya que Y es CH_2, CH_2-CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, N($R^{y\#}$)-CH_2 o N($R^{y\#}$)-CH_2-CH_2 y el grupo C-R^4 es también un miembro del anillo saturado.

En efecto, los compuestos de los documentos D1 y D2 son compuestos de tipo carboxamida, donde el radical en la posición correspondiente al C-Y-A-N de los compuestos reivindicados son heterociclos aromáticos de 5 o 6 miembros como puede observarse en la definición de Y en los documentos D1 y D2. Al contrario de lo afirmado por el Examinador, el anillo C-Y-A-N no está por lo tanto anticipado por D1 o D2. En cambio, el elemento estructural C-Y-A-N es un elemento estructural novedoso e inventivo, siendo además una característica técnica especial en términos de la normativa referente a unidad de invención.

Además de lo anterior, la unidad de invención es un requisito formal. De acuerdo con el Artículo 27 (1) del PCT, la ley nacional no debe aplicar requisitos más estrictos que el PCT con respecto a la forma y contenido de una solicitud. Por lo tanto, los requisitos formales no están abiertos a discusión en la fase nacional, si los mismos no fueron cuestionados durante la fase internacional. Como la unidad de invención no se cuestionó en la fase internacional, no está abierto a discusión por parte del Examinador.

No obstante lo anterior y siguiendo las recomendaciones del examinador cuando indica: *"El solicitante también puede realizar una o más de las divisionales de acuerdo a los grupos de conceptos técnicos inventivos presentados en esta solicitud"*, se presenta junto con el presente memorial una solicitud divisional, la cual cumple con lo establecido en el Artículo 36 de la

Decisión 486. Por lo tanto, se solicita atentamente darle trámite beneficiándose de la fecha de prioridad invocada.

En este sentido, es relevante poner de presente que la Guía para el Estudio de Solicitudes de Patente de Invención y Modelo de Utilidad publicada por su Despacho menciona en el numeral 2.11.5 (páginas 112 y 113):

Después que el solicitante ha presentado las solicitudes divisionales, como consecuencia a que se ha comunicado que su solicitud carece de unidad de invención el procedimiento será el siguiente:

Si el examinador considera que las solicitudes divisionales presentadas por el solicitante como respuesta a un requerimiento por falta de unidad de invención, están bien divididas, aceptará las solicitudes divisionales.

Si el examinador considera que las solicitudes divisionales presentadas por el Solicitante como respuesta a un Requerimiento por falta de Unidad de Invención, no están bien divididas (de acuerdo con los grupos que él mencionó), por ejemplo, porque contienen materia que se traslapa, aceptará las solicitudes divisionales.

Y en cada una de ellas presentará un primer requerimiento que contenga:

- Una definición clara de cuál es la materia que se traslapa y que, por tanto, debe ser retirada de alguna de las solicitudes divisionales y puede permanecer en otra; con el fin de que esta vez queden bien divididas; y
- El examen de patentabilidad (novedad y nivel inventivo), por lo menos de la primera invención.

El solicitante puede, en respuesta al requerimiento, aportar sus propios argumentos o retirar de una de las solicitudes divisionales la materia que se traslapa. Después de lo cual, se continuará el examen de cada una de ellas de forma independiente.

Si se desestiman los argumentos presentados, se redactará un segundo requerimiento, para que cada solicitud divisional contenga una sola invención. En caso que el solicitante no responda, o subsista la situación de falta de unidad, se denegará la patente.

4. Análisis de patentabilidad

4.1 Nivel inventivo

La presente invención se relaciona con compuestos carboxamida de fórmula I, los cuales son inhibidores de calpaina. Los compuestos de fórmula I se caracterizan por las siguientes características estructurales:

1) Tienen un anillo central C-Y-A-N con un átomo de nitrógeno como miembro del anillo;

1a) El anillo central está saturado, ya que tanto Y como el grupo C-R^4, donde R^4 es hidrógeno, permiten únicamente anillos saturados;
1b) el cual tiene además un grupo A deficiente en electrones, es decir, un grupo carbonilo C=O, o un grupo S(=O) o $S(=O)_2$ como miembro del anillo;

2) Tienen una cadena lateral del tipo amida de fórmula C(=O)NH-C(R^1)-C(R^{3a},R^{3b})-X

2a) la cual está unida en posición *orto* con respecto al nitrógeno del anillo;

3) El anillo central lleva un radical Q-R^2, donde

3a) R^2 es un fenilo opcionalmente sustituido,
3b) donde el radical Q-R^2 está unido al nitrógeno del anillo central saturado.

El documento D1 divulga compuestos que son inhibidores de calpaina. Los compuestos del D1 comparten cierta similitud con los compuestos de la presente reivindicación 1, por cuanto tienen una cadena lateral de tipo amida similar a la característica 2 de los compuestos reivindicados y un anillo central al cual se une la cadena lateral. Además, ellos pueden llevar un grupo X-R^1 que puede corresponder, aunque en la mayoría de los casos no corresponde, al grupo Q-R^2 de la presente reivindicación 1. Sin embargo, los compuestos del D1 se diferencian de los compuestos de la presente invención en que la cadena lateral de tipo amida está unida a un heterociclo aromático como puede observarse en la definición para Y en D1. En segundo lugar, el anillo central Y de los compuestos de D1 carecen de un grupo A deficiente de electrones, es decir, un grupo carbonilo C=O, o un grupo S(=O) o $S(=O)_2$ como miembro del anillo. Por lo tanto, D1 no anticipa los compuestos reivindicados.

Al igual que D1, D2 divulga compuestos que son inhibidores de calpaina. Los compuestos del D2 también comparten una cierta similitud con los compuestos de la presente reivindicación 1 ya que tienen una cadena lateral de tipo amida similar a la característica 2 de los compuestos reivindicados y un anillo central al cual se une la cadena lateral. Sin embargo, al igual que los compuestos del D1, el anillo central es un heterociclo aromático como puede observarse en la definición para Y en D2. De hecho, D2 requiere estrictamente que Y sea un radical heteroaromático divalente de 6 miembros (ver las líneas 14 a 16 de la página 9). Evidentemente, D2 no considera compuestos en donde la cadena lateral de tipo amida está unida a un heterociclo saturado, menos aún a un heterociclo que tiene las características 1a) y 1b). Por otra parte, los compuestos del D2 no tienen un radical Q-R^2, el cual está unido al átomo de nitrógeno del anillo central. De hecho, los compuestos de D2 llevan un grupo W2-R^2 o un grupo tricíclico W3 a W8. Evidentemente, la posición del grupo W-R^2 corresponde a la posición del grupo Q-R^2 de los compuestos de la presente reivindicación 1, si Q es un enlace simple. El grupo pirazol/imidazol W-R^2 en D1 corresponde al radical R^2 de la reivindicación 1, el cual es un radical fenilo. Por lo tanto, los compuestos de D2 no cumplen con la característica 3a de los compuestos reivindicados. Además, el grupo W-R^2 de D2 no puede estar unido a un átomo de nitrógeno, ya que de esa manera dejaría de ser aromático. Por lo tanto, los compuestos de D2 no pueden cumplir con la característica 3b de los compuestos reivindicados. En consecuencia, los compuestos de D2 se diferencian de los compuestos reivindicados en cuatro características estructurales.

Evidentemente, ninguno de los documentos citados como arte previo divulga un compuesto que tenga un anillo central saturado con las características 1a y 1b de los compuestos reivindicados. Por lo tanto, la materia reivindicada es novedosa.

Por otra parte, el Examinador considera que D1 es el arte previo más cercano. Como se mencionó anteriormente, los compuestos de D1 son diferentes a los compuestos de la presente invención en que la cadena lateral de tipo amida está unida a un anillo heteroaromático como se puede observar en la definición para Y en D1. De hecho, D1 requiere de manera estricta que Y sea un anillo heterocíclico insaturado tal como piridina, pirimidina, pirazina, imidazol o tiazol, los cuales son anillos heteroaromáticos. D1 no proporciona ni el más mínimo indicio de que los compuestos en los que el Y es distinto de un radical heteroaromático puedan ser útiles como un medicamento, y menos aún, de compuestos en los que el heterociclo central es un anillo saturado que tiene un grupo deficiente de electrones como lo requieren las características 1a) y 1b) de la presente reivindicación 1.

Por su parte, D2 no subsana los defectos de D1. D2 divulga compuestos que son inhibidores de calpaina, los cuales comparten una cierta similitud con los compuestos de la presente

reivindicación 1 ya que tienen una cadena lateral de tipo amida similar a la característica 2 de los compuestos reivindicados y un anillo central al cual se une la cadena lateral. Sin embargo, al igual que en D1, el anillo central es un heterociclo aromático como puede observarse en la definición de Y para D2. De hecho, el D2 requiere de manera estricta que Y sea un radical heteroaromático divalente de 6 miembros (ver las líneas 14 a 16 de la página 9 del D2). Evidentemente, D2 no considera compuestos en los que la cadena lateral de tipo amida esté unida a un heterociclo saturado, menos aún, a un heterociclo que tenga las características 1a) y 1b).

No hay enseñanzas en los documentos D1 y D2 para que una persona versada en la materia se vea motivada a reemplazar el anillo aromático central Y por un anillo heterocíclico saturado, menos aún, por un anillo heterociclo saturado que tenga un grupo deficiente en electrones como lo requiere la característica 1b de la invención reivindicada.

El Examinador argumenta que la única diferencia entre los compuestos de los documentos D1 y D2 y los compuestos reivindicados sería el grupo A deficiente de electrones. En vista de las modificaciones introducidas en la reivindicación 1, este argumento se torna irrelevante. Por otra parte, el Examinador argumenta que el efecto de este grupo no es evidente. Dicho argumento está claramente basado en un análisis en retrospectiva, ya que la pregunta a responder es si una persona versada en la materia estaría motivada a proporcionar compuestos que tengan una estructura determinada. En particular, debe haber una clara motivación para hacerlo.

Por lo tanto, la pregunta que tiene que responderse es si una persona versada en la materia podría razonablemente esperar a partir de las enseñanzas de los documentos D1 y D2 que los compuestos con las características estructurales 1a) y 1b), y también con las características 3a) y 3b) puedan servir como inhibidores de calpaina o como un medicamento.

Como se señaló anteriormente, no hay enseñanzas en los documentos D1 y D2 a partir de lo cual una persona versada en la materia hubiese recibido una motivación para reemplazar el anillo aromático central Y por un anillo heterocíclico saturado y menos aun por un anillo heterocíclico saturado que tenga un grupo deficiente en electrones como lo requiere la característica 1b) de la invención reivindicada. En cambio, esto iría en contra del concepto estructural de los compuestos del D1 y del D2, los cuales requieren estrictamente un anillo heteroaromático en esta posición.

Por otra parte, los compuestos de D2 comparten más similitudes con los compuestos de D1 que con los compuestos de la presente reivindicación 1. Es importante señalar que los inventores involucrados en D1 son parcialmente los mismos que los de D2. Por lo tanto, D2, el cual se

presentó en 2007, debe considerarse como un desarrollo adicional de los compuestos de D1 (presentado en 1999). D2, sin embargo, aleja a la persona versada en la materia de la invención reivindicada al señalar a los anillos aromáticos de 6 miembros y los radicales W-R^2 como variantes estructurales mejoradas de las características Y y X-R^1 de los compuestos de D1.

Por lo tanto, el arte previo no hace que la invención reivindicada sea obvia.

Cabe destacar que la Oficina de Patentes de los Estados Unidos ha concedido dos patentes de la presente solicitud, la US 8,236,798 B2 y la US 8,283,363 B2 con un alcance similar en las reivindicaciones. Se puede ver en la carátula de ambas patentes que tanto D1 (y la correspondiente WO 9954304) y D2 han sido considerados por el examinador estadounidense.

5. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por veinticuatro (24) reivindicaciones.
- Copia del radicado de la solicitud divisional.

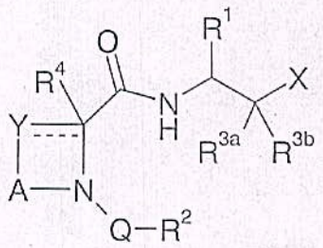
Señor Director,

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. **39.779.654** de Bogotá
T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.
Calle 94A No. 7A-09 - Bogotá, D.C.
Teléfono: 7560770

Bogotá, D.C. 20 JUN. 2014
MCA/jm
P2343
RESPUESTA EXAMEN DE FONDO

REIVINDICACIONES EN RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

1. Un compuesto de carboxamida CARACTERIZADO PORQUE es de la fórmula I



(I)

en donde ---- indica una unión simple;

R^1 es hidrógeno, C_1-C_{10}-alquilo, C_2-C_{10}-alquenilo, C_2-C_{10}-alquinilo, donde los últimos 3 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, donde un grupo CH_2 en la porción cicloalquilo de los últimos dos radicales mencionados puede reemplazarse por O, NH, o S, o dos átomos de C adyacentes pueden formar una unión doble, donde la porción cicloalquilo además puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b},

arilo, hetarilo, aril-C_1-C_6-alquilo, aril-C_2-C_6-alquenilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_2-C_6-alquenilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 6 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes; donde

R^{1a} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_3-C_7-cicloalquiloxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, $COOR^{a1}$, $CONR^{a2}R^{a3}$, $SO_2NR^{a2}R^{a3}$, $-NR^{a2}$-SO_2-R^{a4}, NR^{a2}-CO-R^{a5}, SO_2-R^{a4} y $NR^{a6}R^{a7}$;

R^{1b} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, halógeno, fenilo que tiene opcionalmente 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 3 sustituyentes mencionados pueden estar

parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

$COOR^{b1}$, $CONR^{b2}R^{b3}$, $SO_2NR^{b2}R^{b3}$, NR^{b2}-SO_2-R^{b4}, NR^{b2}-CO-R^{b5}, SO_2-R^{b4} y $NR^{b6}R^{b7}$,

además los radicales R^{1b} pueden formar juntos un grupo C_1-C_4-alquileno, o 2 radicales R^{1b} unidos a átomos de C de cicloalquilo adyacentes también pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos un anillo benceno;

R^{1c} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 4 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquiloxi, donde la porción cicloalquilo de los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos tres radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1d},

$COOR^{c1}$, $CONR^{c2}R^{c3}$, $SO_2NR^{c2}R^{c3}$, NR^{c2}-SO_2-R^{c4}, NR^{c2}-CO-R^{c5}, SO_2-R^{c4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{c6}R^{c7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{c6}R^{c7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6; donde

R^{a1}, R^{b1} y R^{c1} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales

mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

R^{a2}, R^{b2} y R^{c2} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a3}, R^{b3} y R^{c3} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o

los dos radicales R^{a2} y R^{a3}, o R^{b2} y R^{b3} o R^{c2} y R^{c3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo,

R^{a4}, R^{b4} y R^{c4} son en forma independiente entre sí C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales

mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a5}, R^{b5} y R^{c5} tienen en forma independiente entre sí uno de los significados mencionados para R^{a1}, R^{b1} y R^{c1},

R^{a6}, R^{b6} y R^{c6} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, arilo, hetarilo, O-arilo, OCH_2-arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a7}, R^{b7} y R^{c7} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o los dos radicales R^{a6} y R^{a7}, o R^{b6} y R^{b7} o R^{c6} y R^{c7} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo,

o dos radicales R^{1b} o R^{1c} unidos a átomos de C adyacentes

forman junto con los átomos de C a los cuales están unidos un carbociclo opcionalmente sustituido de 4, 5, 6 o 7 miembros o un heterociclo opcionalmente sustituido que tiene 1, 2 o 3 heteroátomos iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo;

R^{1d} se selecciona entre halógeno, OH, SH, NO_2, COOH, $C(O)NH_2$, CHO, CN, NH_2, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, NH-C_1-C_6-alquilo, NHCHO, NH-$C(O)C_1$-C_6-alquilo, y SO_2-C_1-C_6-alquilo o dos radicales R^{1d} unidos a átomos de carbono adyacentes pueden formar juntos una porción -O-Alk''-O-, donde Alk'' es C_1-C_2-alcandiilo lineal, que no está sustituido o donde 1 o 2 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por flúor, cloro o metilo;

R^2 es fenilo, el cual no está sustituido o lleva 1, 2, 3 o 4 radicales R^{2b} iguales o diferentes, donde

R^{2b} tiene uno de los significados indicados para R^{1c};

R^{3a} y R^{3b} son en forma independiente entre sí hidroxi o C_1-C_4-alcoxi, o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O o $C=NR^3$; o

R^{3a} y R^{3b} juntos forman una porción S-Alk-S, O-Alk-S o O-Alk-O, donde Alk es C_2-C_5-alcandiilo lineal, que puede no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados entre C_1-C_4-alquilo o halógeno;

R^3 es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_2-C_6-alquenilo, C_3-C_6-cicloalquilo, C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_2-C_6-alqueniloxi, C_3-C_6-cicloalquiloxi o C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquiloxi;

R^4 indica hidrógeno;

A es C=O, S(=O) o $S(=O)_2$;

Q es una unión simple o una porción Alk'-Z, donde

Z está unido a R^2 y se selecciona entre una unión simple, O, S, S(=O), $S(=O)_2$ y NR^q, donde R^q se selecciona entre hidrógeno, C_1-C_4-alquilo y C_1-C_4-haloalquilo;

Alk' es C_1-C_3-alcandiilo lineal, donde 1, 2 o 3 átomos de hidrógeno

pueden reemplazarse por C_1-C_4-alquilo, C_1-C_4-haloalquilo o halógeno;

X es hidrógeno o un radical de las fórmulas C(=O)-O-R^{x1}, C(=O)-$NR^{x2}R^{x3}$, C(=O)-N(R^{x4})-(C_1-C_6-alquilen)-$NR^{x2}R^{x3}$ o C(=O)-N(R^{x4})$NR^{x2}R^{x3}$, en donde

R^{x1} es hidrógeno, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd},

R^{x2} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, O-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 10 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, O-CH_2-hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 19 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

R^{x3} es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-

cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, o

los dos radicales R^{x2} y R^{x3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo, y que puede tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xb},

R^{x4} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 9 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

donde R^{xa} tiene uno de los significados indicados para R^{1a}, R^{xb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b}, y R^{xd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d};

Y es CH_2, CH_2-CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, N($R^{y\#}$)-CH_2 o N($R^{y\#}$)-CH_2-CH_2, donde en las últimas 6 porciones mencionadas, 1 o 2 átomos de hidrógeno

pueden reemplazarse por un radical R^y,

R^y se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde

R^{ya} tiene uno de los significados indicados para R^{1a},

R^{yb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b},

R^{yd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d},

R^{y1} tiene uno de los significados indicados para R^{c1},

R^{y2} tiene uno de los significados indicados para R^{c2},

R^{y3} tiene uno de los significados indicados para R^{c3},

R^{y4} tiene uno de los significados indicados para R^{c4},

R^{y5} tiene uno de los significados indicados para R^{c5},

R^{y6} tiene uno de los significados indicados para R^{c6}, y

R^{y7} tiene uno de los significados indicados para R^{c7};

$R^{y\#}$ se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-

alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde arilo es, independientemente en cada caso, fenilo o naftilo y hetarilo es, independientemente en cada caso, un radical heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros que tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de nitrógeno como miembros del anillo o que tiene un heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre, y, opcionalmente, 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno como miembros del anillo.

y las sales aceptables farmacéuticamente del mismo.

2. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE A es C=C.

3. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, CARACTERIZADO PORQUE Q es CH_2 o CH_2CH_2.

4. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE R^1 se selecciona entre:

C_3-C_{10}-alquilo que no está sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

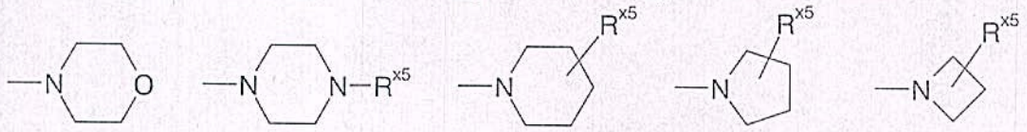
fenil-C_1-C_4-alquilo y hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos fenilo y hetarilo en los últimos 2 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes.

5. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE X en la fórmula I es un radical $C(=O)-NR^{x2}R^{x3}$ en donde

R^{x2} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

R^{x3} es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo o C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o

$NR^{x2}R^{x3}$ es un heterociclo con nitrógeno de las siguientes fórmulas:



en donde R^{x5} es hidrógeno o tiene el significado indicado en la reivindicación 1 para R^{xb}.

6. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 5, CARACTERIZADO PORQUE X es $C(O)-NH_2$.

7. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 5, CARACTERIZADO PORQUE X es $C(O)-NHR^{x22}$, donde R^{x22} es CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}.

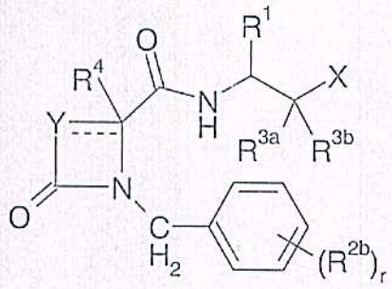
8. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 7, CARACTERIZADO PORQUE R^{x22} es C_1-C_4-alquilo, C_3-C_6-cicloalquilo, fenil-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd} y hetarilo es un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros

que tiene como miembros del anillo 1 o 2 heteroátomos seleccionados entre O, S y N.

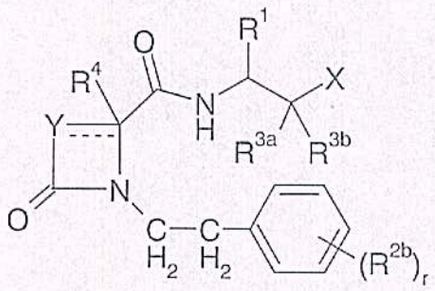
9. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE R^{3a} y R^{3b} son hidroxi o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O.

10. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE el átomo de carbono que lleva el radical R^4 tiene predominantemente configuración R.

11. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE corresponde a las fórmulas I-a o I-b,



(Ia)



(Ib)

donde

R^1 es hidrógeno, C_1-C_{10}-alquilo, C_2-C_{10}-alquenilo, C_2-C_{10}-alquinilo, donde los últimos 3 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},
C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, donde un grupo CH_2 en la porción cicloalquilo de los últimos dos radicales mencionados puede reemplazarse por O, NH, o S, o dos átomos de C adyacentes pueden formar una unión doble, donde la porción cicloalquilo además puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b},
arilo, hetarilo, aril-C_1-C_6-alquilo, aril-C_2-C_6-alquenilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_2-C_6-alquenilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 6 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes; donde

R^{1a} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_3-C_7-

cicloalquiloxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, $COOR^{a1}$, $CONR^{a2}R^{a3}$, $SO_2NR^{a2}R^{a3}$, $-NR^{a2}-SO_2-R^{a4}$, $NR^{a2}-CO-R^{a5}$, SO_2-R^{a4} y $NR^{a6}R^{a7}$;

R^{1b} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, halógeno, fenilo que tiene opcionalmente 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 3 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

$COOR^{b1}$, $CONR^{b2}R^{b3}$, $SO_2NR^{b2}R^{b3}$, $NR^{b2}-SO_2-R^{b4}$, $NR^{b2}-CO-R^{b5}$, SO_2-R^{b4} y $NR^{b6}R^{b7}$,

además los radicales R^{1b} pueden formar juntos un grupo C_1-C_4-alquileno, o 2 radicales R^{1b} unidos a átomos de C de cicloalquilo adyacentes también pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos un anillo benceno;

R^{1c} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 4 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquiloxi, donde la porción cicloalquilo de los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos tres radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1d},

$COOR^{c1}$, $CONR^{c2}R^{c3}$, $SO_2NR^{c2}R^{c3}$, $NR^{c2}-SO_2-R^{c4}$, $NR^{c2}-CO-R^{c5}$, SO_2-R^{c4},

$-(CH_2)_p-NR^{c6}R^{c7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

$O-(CH_2)_q-NR^{c6}R^{c7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6; donde

R^{a1}, R^{b1} y R^{c1} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

R^{a2}, R^{b2} y R^{c2} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a3}, R^{b3} y R^{c3} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o

los dos radicales R^{a2} y R^{a3}, o R^{b2} y R^{b3} o R^{c2} y R^{c3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como

miembros del anillo,

R^{a4}, R^{b4} y R^{c4} son en forma independiente entre sí C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a5}, R^{b5} y R^{c5} tienen en forma independiente entre sí uno de los significados mencionados para R^{a1}, R^{b1} y R^{c1},

R^{a6}, R^{b6} y R^{c6} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, arilo, hetarilo, O-arilo, OCH_2-arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a7}, R^{b7} y R^{c7} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales

mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o los dos radicales R^{a6} y R^{a7}, o R^{b6} y R^{b7} o R^{c6} y R^{c7} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo,

o dos radicales R^{1b} o R^{1c} unidos a átomos de C adyacentes forman junto con los átomos de C a los cuales están unidos un carbociclo opcionalmente sustituido de 4, 5, 6 o 7 miembros o un heterociclo opcionalmente sustituido que tiene 1, 2 o 3 heteroátomos iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo;

R^{1d} se selecciona entre halógeno, OH, SH, NO_2, COOH, $C(O)NH_2$, CHO, CN, NH_2, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, NH-C_1-C_6-alquilo, NHCHO, NH-$C(O)C_1$-C_6-alquilo, y SO_2-C_1-C_6-alquilo o dos radicales R^{1d} unidos a átomos de carbono adyacentes pueden formar juntos una porción -O-Alk"-O-, donde Alk" es C_1-C_2-alcandiilo lineal, que no está sustituido o donde 1 o 2 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por flúor, cloro o metilo;

R^{2b} tiene uno de los significados indicados para R^{1c};

R^{3a} y R^{3b} son en forma independiente entre sí hidroxi o C_1-C_4-alcoxi, o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O o $C=NR^3$; o

R^{3a} y R^{3b} juntos forman una porción S-Alk-S, O-Alk-S o O-Alk-O, donde Alk es C_2-C_5-alcandiilo lineal, que puede no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados entre C_1-C_4-alquilo o halógeno;

R^3 es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_2-C_6-alquenilo, C_3-C_6-cicloalquilo, C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_2-C_6-alqueniloxi, C_3-C_6-cicloalquiloxi o C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquiloxi;

R^4 indica hidrógeno;

X es hidrógeno o un radical de las fórmulas $C(=O)-O-R^{x1}$, $C(=O)-NR^{x2}R^{x3}$, $C(=O)-N(R^{x4})-(C_1-C_6\text{-alquilen})-NR^{x2}R^{x3}$ o $C(=O)-N(R^{x4})NR^{x2}R^{x3}$, en donde

R^{x1} es hidrógeno, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd},

R^{x2} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, $CO-C_1-C_6$-alquilo, $CO-O-C_1-C_6$-alquilo, $SO_2-C_1-C_6$-alquilo, $O-C_1-C_6$-alquilo, donde los grupos alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 10 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, arilo, O-arilo, $O-CH_2$-arilo, hetarilo, $O-CH_2$-hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 19 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

R^{x3} es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo,

alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, o

los dos radicales R^{x2} y R^{x3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo, y que puede tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xb},

R^{x4} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 9 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

donde R^{xa} tiene uno de los significados indicados para R^{1a}, R^{xb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b}, y R^{xd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d};

Y es CH_2, CH_2-CH_2, $CH_2CH_2CH_2$, N($R^{y\#}$)-CH_2 o N($R^{y\#}$)-CH_2-CH_2, donde en las últimas 6 porciones mencionadas, 1 o 2 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por un radical R^y,

R^y se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno,

OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde

R^{ya} tiene uno de los significados indicados para R^{1a},

R^{yb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b},

R^{yd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d},

R^{y1} tiene uno de los significados indicados para R^{c1},

R^{y2} tiene uno de los significados indicados para R^{c2},

R^{y3} tiene uno de los significados indicados para R^{c3},

R^{y4} tiene uno de los significados indicados para R^{c4},

R^{y5} tiene uno de los significados indicados para R^{c5},

R^{y6} tiene uno de los significados indicados para R^{c6}, y

R^{y7} tiene uno de los significados indicados para R^{c7};

$R^{y\#}$ se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3

sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

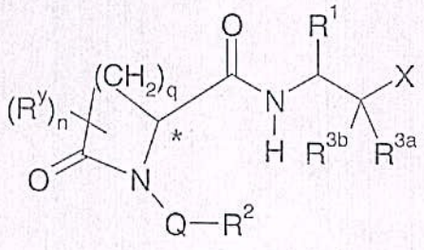
NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde arilo es, independientemente en cada caso, fenilo o naftilo y hetarilo es, independientemente en cada caso, un radical heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros que tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de nitrógeno como miembros del anillo o que tiene un heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre, y, opcionalmente, 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno como miembros del anillo;
y donde r es 0, 1, 2, 3 o 4, y las sales farmacéuticamente adecuadas del mismo.

12. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE corresponde a la fórmula I-A,



(I-A)

donde

R^1 es hidrógeno, C_1-C_{10}-alquilo, C_2-C_{10}-alquenilo, C_2-C_{10}-alquinilo, donde los últimos 3 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, donde un grupo CH_2

en la porción cicloalquilo de los últimos dos radicales mencionados puede reemplazarse por O, NH, o S, o dos átomos de C adyacentes pueden formar una unión doble, donde la porción cicloalquilo además puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b},

arilo, hetarilo, aril-C_1-C_6-alquilo, aril-C_2-C_6-alquenilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_2-C_6-alquenilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 6 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes; donde

R^{1a} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_3-C_7-cicloalquiloxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, $COOR^{a1}$, $CONR^{a2}R^{a3}$, $SO_2NR^{a2}R^{a3}$, $-NR^{a2}-SO_2-R^{a4}$, $NR^{a2}-CO-R^{a5}$, SO_2-R^{a4} y $NR^{a6}R^{a7}$;

R^{1b} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, halógeno, fenilo que tiene opcionalmente 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 3 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

$COOR^{b1}$, $CONR^{b2}R^{b3}$, $SO_2NR^{b2}R^{b3}$, $NR^{b2}-SO_2-R^{b4}$, $NR^{b2}-CO-R^{b5}$, SO_2-R^{b4} y $NR^{b6}R^{b7}$,

además los radicales R^{1b} pueden formar juntos un grupo C_1-C_4-alquileno, o 2 radicales R^{1b} unidos a átomos de C de cicloalquilo adyacentes también pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos un anillo benceno;

R^{1c} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 4 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-

cicloalquiloxi, donde la porción cicloalquilo de los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos tres radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1d},

$COOR^{c1}$, $CONR^{c2}R^{c3}$, $SO_2NR^{c2}R^{c3}$, NR^{c2}-SO_2-R^{c4}, NR^{c2}-CO-R^{c5}, SO_2-R^{c4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{c6}R^{c7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{c6}R^{c7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6; donde

R^{a1}, R^{b1} y R^{c1} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

R^{a2}, R^{b2} y R^{c2} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a3}, R^{b3} y R^{c3} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-

heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o

los dos radicales R^{a2} y R^{a3}, o R^{b2} y R^{b3} o R^{c2} y R^{c3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo,

R^{a4}, R^{b4} y R^{c4} son en forma independiente entre sí C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a5}, R^{b5} y R^{c5} tienen en forma independiente entre sí uno de los significados mencionados para R^{a1}, R^{b1} y R^{c1},

R^{a6}, R^{b6} y R^{c6} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, arilo, hetarilo, O-arilo, OCH_2-arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o

SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a7}, R^{b7} y R^{c7} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o los dos radicales R^{a6} y R^{a7}, o R^{b6} y R^{b7} o R^{c6} y R^{c7} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo,

o dos radicales R^{1b} o R^{1c} unidos a átomos de C adyacentes forman junto con los átomos de C a los cuales están unidos un carbociclo opcionalmente sustituido de 4, 5, 6 o 7 miembros o un heterociclo opcionalmente sustituido que tiene 1, 2 o 3 heteroátomos iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo;

R^{1d} se selecciona entre halógeno, OH, SH, NO_2, COOH, $C(O)NH_2$, CHO, CN, NH_2, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, NH-C_1-C_6-alquilo, NHCHO, NH-$C(O)C_1$-C_6-alquilo, y SO_2-C_1-C_6-alquilo o dos radicales R^{1d} unidos a átomos de carbono adyacentes pueden formar juntos una porción -O-Alk"-O-, donde Alk" es C_1-C_2-alcandiilo lineal, que no está sustituido o donde 1 o 2 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por flúor, cloro o metilo;

R^2 es fenilo, el cual no está sustituido o lleva 1, 2, 3 o 4 radicales R^{2b}

iguales o diferentes, donde

R^{2b} tiene uno de los significados indicados para R^{1c};

R^{3a} y R^{3b} son en forma independiente entre sí hidroxi o C_1-C_4-alcoxi, o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O o $C=NR^3$; o

R^{3a} y R^{3b} juntos forman una porción S-Alk-S, O-Alk-S o O-Alk-O, donde Alk es C_2-C_5-alcandiilo lineal, que puede no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados entre C_1-C_4-alquilo o halógeno;

R^3 es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_2-C_6-alquenilo, C_3-C_6-cicloalquilo, C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_2-C_6-alqueniloxi, C_3-C_6-cicloalquiloxi o C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquiloxi;

Q es una unión simple o una porción Alk'-Z, donde

Z está unido a R^2 y se selecciona entre una unión simple, O, S, S(=O), $S(=O)_2$ y NR^q, donde R^q se selecciona entre hidrógeno, C_1-C_4-alquilo y C_1-C_4-haloalquilo;

Alk' es C_1-C_3-alcandiilo lineal, donde 1, 2 o 3 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por C_1-C_4-alquilo, C_1-C_4-haloalquilo o halógeno;

X es hidrógeno o un radical de las fórmulas $C(=O)$-O-R^{x1}, $C(=O)$-$NR^{x2}R^{x3}$, $C(=O)$-$N(R^{x4})$-(C_1-C_6-alquilen)-$NR^{x2}R^{x3}$ o $C(=O)$-$N(R^{x4})NR^{x2}R^{x3}$, en donde

R^{x1} es hidrógeno, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd},

R^{x2} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo,

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, O-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 10 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, O-CH_2-hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 19 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

R^{x3} es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, o

los dos radicales R^{x2} y R^{x3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo, y que puede tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xb},

R^{x4} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-

C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 9 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

donde R^{xa} tiene uno de los significados indicados para R^{1a}, R^{xb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b}, y R^{xd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d};

R^y se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde

R^{ya} tiene uno de los significados indicados para R^{1a},

R^{yb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b},

R^{yd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d},

R^{y1} tiene uno de los significados indicados para R^{c1},

R^{y2} tiene uno de los significados indicados para R^{c2},

R^{y3} tiene uno de los significados indicados para R^{c3},

R^{y4} tiene uno de los significados indicados para R^{c4},

R^{y5} tiene uno de los significados indicados para R^{c5},

R^{y6} tiene uno de los significados indicados para R^{c6}, y

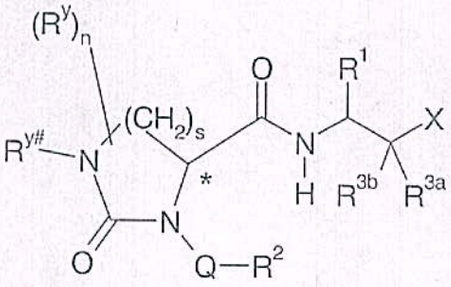
R^{y7} tiene uno de los significados indicados para R^{c7};

donde arilo es, independientemente en cada caso, fenilo o naftilo y hetarilo es, independientemente en cada caso, un radical heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros que tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de nitrógeno como miembros del anillo o que tiene un heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre, y, opcionalmente, 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno como miembros del anillo;

n es 0, 1 o 2, q es 2 o 3, y el asterisco (*) indica un centro quiral, y las sales farmacéuticamente adecuadas del mismo.

13. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 12, CARACTERIZADO PORQUE q es 2.

14. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, CARACTERIZADO PORQUE corresponde a la fórmula I-B,



(I-B)

donde

R^1 es hidrógeno, C_1-C_{10}-alquilo, C_2-C_{10}-alquenilo, C_2-C_{10}-alquinilo, donde los últimos 3 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, donde un grupo CH_2 en la porción cicloalquilo de los últimos dos radicales mencionados

puede reemplazarse por O, NH, o S, o dos átomos de C adyacentes pueden formar una unión doble, donde la porción cicloalquilo además puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b},

arilo, hetarilo, aril-C_1-C_6-alquilo, aril-C_2-C_6-alquenilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_2-C_6-alquenilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 6 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes; donde

R^{1a} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_3-C_7-cicloalquiloxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, $COOR^{a1}$, $CONR^{a2}R^{a3}$, $SO_2NR^{a2}R^{a3}$, $-NR^{a2}$-SO_2-R^{a4}, NR^{a2}-CO-R^{a5}, SO_2-R^{a4} y $NR^{a6}R^{a7}$;

R^{1b} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, COOH, CN, OCH_2COOH, halógeno, fenilo que tiene opcionalmente 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 3 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

$COOR^{b1}$, $CONR^{b2}R^{b3}$, $SO_2NR^{b2}R^{b3}$, NR^{b2}-SO_2-R^{b4}, NR^{b2}-CO-R^{b5}, SO_2-R^{b4} y $NR^{b6}R^{b7}$,

además los radicales R^{1b} pueden formar juntos un grupo C_1-C_4-alquileno, o 2 radicales R^{1b} unidos a átomos de C de cicloalquilo adyacentes también pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos un anillo benceno;

R^{1c} se selecciona en forma independiente entre sí entre OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde las porciones alquilo en los últimos 4 sustituyentes mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenadas y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquiloxi, donde la porción cicloalquilo de los últimos tres

radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1b}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos tres radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1d},

$COOR^{c1}$, $CONR^{c2}R^{c3}$, $SO_2NR^{c2}R^{c3}$, NR^{c2}-SO_2-R^{c4}, NR^{c2}-CO-R^{c5}, SO_2-R^{c4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{c6}R^{c7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{c6}R^{c7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6; donde

R^{a1}, R^{b1} y R^{c1} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d},

R^{a2}, R^{b2} y R^{c2} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a3}, R^{b3} y R^{c3} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquii-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo,

arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o

los dos radicales R^{a2} y R^{a3}, o R^{b2} y R^{b3} o R^{c2} y R^{c3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo,

R^{a4}, R^{b4} y R^{c4} son en forma independiente entre sí C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a5}, R^{b5} y R^{c5} tienen en forma independiente entre sí uno de los significados mencionados para R^{a1}, R^{b1} y R^{c1},

R^{a6}, R^{b6} y R^{c6} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, arilo, hetarilo, O-arilo, OCH_2-arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo

en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, y

R^{a7}, R^{b7} y R^{c7} son en forma independiente entre sí H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1d}, o los dos radicales R^{a6} y R^{a7}, o R^{b6} y R^{b7} o R^{c6} y R^{c7} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno opcionalmente sustituido de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo,

o dos radicales R^{1b} o R^{1c} unidos a átomos de C adyacentes forman junto con los átomos de C a los cuales están unidos un carbociclo opcionalmente sustituido de 4, 5, 6 o 7 miembros o un heterociclo opcionalmente sustituido que tiene 1, 2 o 3 heteroátomos iguales o diferentes seleccionados entre O, N y S como miembros del anillo;

R^{1d} se selecciona entre halógeno, OH, SH, NO_2, COOH, $C(O)NH_2$, CHO, CN, NH_2, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-haloalcoxi, C_1-C_6-alquiltio, C_1-C_6-haloalquiltio, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, NH-C_1-C_6-alquilo, NHCHO, NH-$C(O)C_1$-C_6-alquilo, y SO_2-C_1-C_6-alquilo o dos radicales R^{1d} unidos a átomos de carbono adyacentes pueden formar juntos una porción -O-Alk"-O-, donde Alk" es C_1-C_2-alcandiilo lineal, que no está sustituido o donde 1 o 2 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por flúor, cloro o metilo;

R^2 es fenilo, el cual no está sustituido o lleva 1, 2, 3 o 4 radicales R^{2b} iguales o diferentes, donde

R^{2b} tiene uno de los significados indicados para R^{1c};

R^{3a} y R^{3b} son en forma independiente entre sí hidroxi o C_1-C_4-alcoxi, o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O o $C=NR^3$; o

R^{3a} y R^{3b} juntos forman una porción S-Alk-S, O-Alk-S o O-Alk-O, donde Alk es C_2-C_5-alcandiilo lineal, que puede no estar sustituido o estar sustituido con 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados entre C_1-C_4-alquilo o halógeno;

R^3 es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_2-C_6-alquenilo, C_3-C_6-cicloalquilo, C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_2-C_6-alqueniloxi, C_3-C_6-cicloalquiloxi o C_3-C_6-cicloalquil-C_1-C_4-alquiloxi;

Q es una unión simple o una porción Alk'-Z, donde

Z está unido a R^2 y se selecciona entre una unión simple, O, S, S(=O), $S(=O)_2$ y NR^q, donde R^q se selecciona entre hidrógeno, C_1-C_4-alquilo y C_1-C_4-haloalquilo;

Alk' es C_1-C_3-alcandiilo lineal, donde 1, 2 o 3 átomos de hidrógeno pueden reemplazarse por C_1-C_4-alquilo, C_1-C_4-haloalquilo o halógeno;

X es hidrógeno o un radical de las fórmulas $C(=O)$-O-R^{x1}, $C(=O)$-$NR^{x2}R^{x3}$, $C(=O)$-$N(R^{x4})$-(C_1-C_6-alquilen)-$NR^{x2}R^{x3}$ o $C(=O)$-$N(R^{x4})NR^{x2}R^{x3}$, en donde

R^{x1} es hidrógeno, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd},

R^{x2} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-

heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, O-C_1-C_6-alquilo, donde los grupos alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 10 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, O-CH_2-hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 19 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

R^{x3} es H, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 6 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetarilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, o

los dos radicales R^{x2} y R^{x3} forman junto con el átomo de N un heterociclo con nitrógeno de entre 3 y 7 miembros que puede tener opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos adicionales iguales o diferentes seleccionados entre O, N, S como miembros del anillo, y que puede tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xb},

R^{x4} es H, OH, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, o C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, CO-C_1-C_6-alquilo, CO-O-C_1-C_6-alquilo, SO_2-C_1-C_6-alquilo, donde los

grupos alquilo, alquenilo, alcoxi, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo en los últimos 9 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa},

arilo, O-arilo, O-CH_2-arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo, hetaril-C_1-C_4-alquilo, CO-arilo, CO-hetarilo, CO-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-arilo, CO-O-hetarilo, CO-O-(aril-C_1-C_4-alquilo), CO-O-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), SO_2-arilo, SO_2-hetarilo, SO_2-(aril-C_1-C_4-alquilo) o SO_2-(hetaril-C_1-C_4-alquilo), donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 18 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}, y

donde R^{xa} tiene uno de los significados indicados para R^{1a}, R^{xb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b}, y R^{xd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d};

R^y se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, OH, SH, halógeno, NO_2, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, COOH, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde

R^{ya} tiene uno de los significados indicados para R^{1a},

R^{yb} tiene uno de los significados indicados para R^{1b},

R^{yd} tiene uno de los significados indicados para R^{1d},

R^{y1} tiene uno de los significados indicados para R^{c1},

R^{y2} tiene uno de los significados indicados para R^{c2},

R^{y3} tiene uno de los significados indicados para R^{c3},

R^{y4} tiene uno de los significados indicados para R^{c4},

R^{y5} tiene uno de los significados indicados para R^{c5},

R^{y6} tiene uno de los significados indicados para R^{c6}, y

R^{y7} tiene uno de los significados indicados para R^{c7};

$R^{y\#}$ se selecciona en forma independiente entre sí entre hidrógeno, NH_2, CN, CF_3, CHF_2, CH_2F, O-CF_3, O-CHF_2, O-CH_2F, OCH_2COOH, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-alcoxi, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alquiltio, donde los últimos 4 radicales mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{ya},

C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-cicloalquil-O, donde la porción cicloalquilo en los últimos tres radicales mencionados puede tener 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yb}, y donde 1 o 2 grupos CH_2 en la porción cicloalquilo pueden reemplazarse por O, NH o S,

arilo, hetarilo, O-arilo, CH_2-arilo, O-CH_2-arilo, donde los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos en la porción arilo o pueden llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{yd},

$COOR^{y1}$, $CONR^{y2}R^{y3}$, $SO_2NR^{y2}R^{y3}$, -NH-SO_2-R^{y4},

NH-CO-R^{y5}, SO_2-R^{y4},

-$(CH_2)_p$-$NR^{y6}R^{y7}$ con p = 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 y

O-$(CH_2)_q$-$NR^{y6}R^{y7}$ con q = 2, 3, 4, 5 o 6;

donde arilo es, independientemente en cada caso, fenilo o naftilo y hetarilo es, independientemente en cada caso, un radical heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros que tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de nitrógeno como miembros del anillo o que tiene un heteroátomo seleccionado entre oxígeno y azufre, y, opcionalmente, 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno como miembros del anillo;

n es 0, 1 o 2, s es 1 o 2, y el asterisco (*) indica un centro quiral, y las sales

farmacéuticamente adecuadas del mismo.

15. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14, CARACTERIZADO PORQUE el átomo de carbono indicado con un asterisco tiene predominantemente configuración R.

16. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14, CARACTERIZADO PORQUE Q es CH_2 y R^2 es fenilo, que no está sustituido o lleva 1, 2, 3 o 4 radicales R^{2b} idénticos o diferentes.

17. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15, CARACTERIZADO PORQUE Q es CH_2.

18. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15, CARACTERIZADO PORQUE Q es CH_2CH_2.

19. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 18, CARACTERIZADO PORQUE R^1 se selecciona entre:

    C_3-C_{10}-alquilo que no está sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado y/o tener 1, 2 o 3 sustituyentes R^{1a},

    fenil-C_1-C_4-alquilo y hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos fenilo y hetarilo en los últimos 2 radicales mencionados pueden no estar sustituidos o llevar 1, 2, 3 o 4 radicales R^{1c} idénticos o diferentes.

20. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 19, CARACTERIZADO PORQUE X es C(O)-NHR^{x2}, donde R^{x2} es hidrógeno, CN, C_1-C_6-alquilo, C_1-C_6-haloalquilo, C_1-C_6-alquilo que tiene 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xa}, C_2-C_6-alquenilo, C_2-C_6-alquinilo, C_3-C_7-cicloalquilo, C_3-C_7-cicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_3-C_7-heterocicloalquil-C_1-C_4-alquilo, C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_4-alquilo, arilo, hetarilo, aril-C_1-C_4-alquilo o hetaril-C_1-C_4-alquilo, donde los grupos arilo y hetarilo en los últimos 4 radicales mencionados no están sustituidos o tienen 1, 2 o 3 sustituyentes R^{xd}.

21. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 20, CARACTERIZADO PORQUE R^{3a} y R^{3b} son hidroxi o junto con el átomo de carbono al cual están unidos son C=O.

22. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE se selecciona

entre el grupo que consiste en

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3-clorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(4-fluorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3-metoxibencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3-trifluorometil-bencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3-fluorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–[2-(trifluorometoxi)-bencil]pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(naftalen–1–ilmetil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(naftalen-2-ilmetil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–[3-(trifluorometoxi)bencil]-pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-6-oxopiperidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–fenilpirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3-cianobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–[2-(trifluorometil)bencil]-pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-4-metil-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-{3,4-dioxo–1–fenil-4-[(piridin-2-ilmetil)amino]butan-2-il}-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-[4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il]-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3,5-dimetoxibencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(piridin-4-ilmetil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(3,5-difluorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(metilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(propilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(isobutilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(ciclobutilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(metoxiamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(2-(piridin-2-il)etilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(3-(piridin-2-il)propilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(3-fenilpropilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(etil(metil)amino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(2-clorobencilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(2-

(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(bencilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(isopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(2-(piridin-2-il)etilamino)butan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(3-(piridin-2-il)propilamino)butan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(2-metoxi-6-(trifluorometil)bencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(piridin-2-ilmetilamino)butan-2-il)–1–(2-metoxi-6-(trifluorometil)bencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(bencilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(2-metoxi-6-(trifluorometil)bencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(2-(piridin-2-il)etilamino)butan-2-il)-5-oxo–1–(2-(trifluorometoxi)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

1-(2-clorobencil)-N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-(2-clorobencil)-N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(2,6-difluorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-(2,6-difluorobencil)-N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–[2-metoxi-6-(trifluorometil)bencil]pirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(2,6-difluorobencil)pirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(2-feniletilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-3-bencilmetil-2-oxoimidazolidin-4-carboxamida,

1,1-dióxido de N-(4-amino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-2-bencilisotiazolidin-3-carboxamida y

las sales aceptables farmacéuticamente del mismo.

23. El compuesto de carboxamida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, CARACTERIZADO PORQUE se selecciona entre el grupo que consiste en

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(tiazol-5-ilmetilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(benzo[d]tiazol-2-ilmetilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-morfolino-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(4-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(ciclohexilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(2-benzoilhidrazinil)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxo–1–(4-(trifluorometil)bencil)pirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(tiazol-2-ilmetilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dicxo–1–fenil-4-(tiofen-2-ilmetilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(2,6-diclorobencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-(2,6-diclorobencil)-N-(4-(etilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(piridin-4-ilmetilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(oxazol-2-ilmetilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(fenilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-

carboxamida,

N-(4-(benzo[d][1,3]dioxol-5-ilmetilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–bencil-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(4-fluorobencilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(4-(trifluorometil)bencilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(((R)-tetrahidrofurano-2-il)metilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(((S)-tetrahidrofurano-2-il)metilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(3,4-dioxo–1–fenil-4-(2-(tiofen-3-il)etilamino)butan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(furan-2-ilmetilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

1-bencil-N-(4-(2-bencilhidrazinil)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida,

N-(4-(ciclopropilamino)-3,4-dioxo–1–fenilbutan-2-il)–1–(2-metoxi-6-(trifluorometil)bencil)-5-oxopirrolidin-2-carboxamida y

las sales aceptables farmacéuticamente del mismo.

24. Un medicamento CARACTERIZADO PORQUE comprende por lo menos un compuesto carboxamida que se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 23, o una sal del mismo farmacéuticamente apropiados.

COPY

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO7
No. 14-134384- -00000-0000
Fecha: 2014-06-20 14:58:40 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 204

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-167060- -00010-0000
Fecha: 2014-06-20 14:58:40 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 204

DIRECCION DE N
CONVERSION, DIVISION

1. Identificación del Trámite

[ ] Conversión [X]
[X] 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 [X]

1. ABBOTT GMBH & CO. KG.; 2. ABBVIE INC.
Nombre o Denominación / Nombre 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		Dirección del titular	Ciudad
1. ALEMANIA 2. ESTADOS UNIDOS DE AMERICA		1. Max- Planck-Ring, 2 2. 1 North Waukegan Road	1. 65205 Wiesbaden 2. North Chicago, IL 60064
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 representante o apoderado

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO — Apellidos y Nombre
39.779.654 de Bogotá — Documento de Identificación
70.819 de C.S.J. — T.P. No.

Dirección del representante			Ciudad
Calle 94 A No. 7 A - 09			Bogotá
Dirección electrónica		No. Fax	Número telefónico
info@castellanosyco.co		7 550158	7 560770

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

50

4. Datos del trámite

CONVERSION	DIVISION	FUSION
Expediente	Expediente 11 167060	Expediente
De:	No. de Divisional UNO (1)	De:
A:		A:

5. Comprobante de Pago No. 14-0065389 - 14-0065390 Fecha Junio 19, 2014

6. Anexos

- [X] Comprobante de pago de la tasa
- [X] Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación
- [ ] Número de documento que ordena la comisión o fusión o división
- [ ] Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud
- [X] Texto de la descripción, reivindicaciones y resumen

7. Firma

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
Nombre y Apellidos

Firma

39.779.654 de Bogotá
C.C.

70.819 C.S.J.
T.P.

P3500 - SOLICITUD DIVISIONAL DE LA P2343

20 JUN. 2014