

JOSE LLOREDA CAMACH & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6088700 Fax 6088701

256

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 05-000582- -00006-0000

Fee: 2007-04-11 16:30:17 Dep. 2020 NUECREACIONES

Trá. 11 PATENTEYI

Eve: 379 FASENACIONALI

101799 CTUINFORMACION Folio: 25

Re: **P1.-WYETH Y AROULE, INC.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "FENILSULFONAMIDAS SUSTITUIDAS COMO INHIBIDORES DE LA PRODUCCION DE BETA AMILOIDES".-Clase A61K 31/18.-Expediente número 05-000.582.-**

1. Me refiero a mi memorial de fecha 6 de Marzo de 2007, mediante el cual se modificó el capítulo reivindicatorio originalmente presentado correspondiente a la solicitud de Patente arriba mencionada.

2. Dando alcance al memorial anteriormente reseñado, me permito manifestar a este Despacho que debido a un error involuntario en el mismo, el juego reivindicatorio fue enumerado incorrectamente.

En consecuencia, anexo me permito presentar el capítulo reivindicatorio correspondiente en el cual se subsana dicho error y adicionalmente se presenta una nueva modificación a las reivindicaciones primera y novena del mismo.

- La reivindicación 1 fue modificada en su ultimo párrafo (Página 106, líneas 31 y 32), el cual deberá leerse así:

"O una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este y un vehiculo fisiológicamente compatible."

- En la reivindicación 9 fue eliminada la palabra *Prevenir* que se encontraba repetida y fue modificado su ultimo párrafo (Página 118, líneas 9 y 10), el cual deberá leerse así:

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 8069700 Fax 8069701

257

"O una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este y un vehículo fisiológicamente compatible."

El soporte para las modificaciones presentadas puede encontrarse en el capítulo descriptivo, en particular en la página 38, líneas 7 y 8.

Sobre este particular, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que las modificaciones realizadas en el capítulo descriptivo de la presente solicitud, no amplían de manera alguna el alcance de la presente invención, toda vez que las mismas solamente obedecen a corregir algunos errores tipográficos, en aras de permitir un mejor entendimiento de la presente invención. Adicionalmente, dichas modificaciones se encuentran perfectamente sustentadas en el capítulo descriptivo, como se expuso anteriormente.

3. Anexos:

- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones.**
- (b) Recibo No. 07-23.768, que acredita el pago de la tasa de modificaciones.**
- (c) Copia de las páginas 105 a 128 del capítulo reivindicatorio, las cuales reemplazan aquellas presentadas anteriormente, en las que se han realizado las modificaciones expuestas anteriormente; y**
- (d) Copia de mi memorial de fecha Marzo 6 de 2007.**

4. En vista de lo anterior, ruego a Usted tomar atenta nota y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Sollicitud.

②

S LICITANTE

Nombre: **WYETH y ARQULE, INC.**, sociedades existentes y organizadas de conformidad con las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América.

Dirección: Five Giralda Farms, Madison, Estado de New Jersey 07940 y 19 Presidential Way, Woburn, Estado de Massachusetts 01801, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Madison, Estado de New Jersey y Woburn, Estado de Massachusetts, Estados Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O AP DERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: Calle 72 No. 5-83 Piso 5º, Bogotá, Colombia

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.690.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

05-000.582

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificación al capítulo reivindicatorio

⑥

Comprobante de pago No. 07 - 23.768

Fecha 22-03-07

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

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

⑧

NOMBRE ALICIA LLOREDA RICAURTE

FIRMA



C.C. 39.690.713

T.P. 53.215

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

259

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 23,760
FECHA : MARZO 22 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55738179	22/03/2007	6,327,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

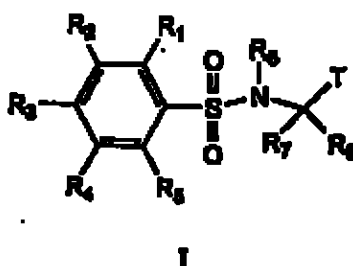
SOM: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica para el uso en el monitoreo de
5 niveles de beta-amilode en un paciente, caracterizada por contener un compuesto de fórmula I:



10 en donde

- R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;
 R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;
 R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;
 R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y N=N;
 15 R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

o

- 20 R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

- R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-
 25 furano, $(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$ y $(\text{CH}_2)_2\text{NHBOC}$;

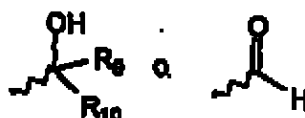
R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

- 30 R_8 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquilo sustituido, cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2

cicloalquilo, CH₂-3-indol, CH(alquilo menor)-2-furano, CH(alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH(alquilo menor)fenilo, y CH(OH)-4-SCH₃-fenilo; o

R₇ y R₈ están fusionados para formar un anillo saturado con base en
5 carbono;

T es



10 R₉ y R₁₀ son H; o

R₉ es H y R₁₀ es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, CF₃, alquenilo menor, alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH₂CH₂-1,3-dioxalano; o

15

R₉ y R₁₀ son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

En donde:

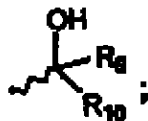
- 20 (i) cuando R₅ es un metoxi; R₂ es halógeno y R₁, R₃ y R₄ son H;
 (ii) cuando R₅ es un metilo; R₁ es halógeno y R₂, R₃ y R₄ son H;
 (iii) cuando R₄ es un amino; R₃ es halógeno y R₁, R₂ y R₅ son H;
 (iv) cuando R₂ es N=N y R₁ es O; R₂ está enlazado a R₁ para formar un anillo heterocíclico;
 25 (v) cuando R₄ es N=N y R₅ es O; R₄ está enlazado a R₅ para formar un anillo heterocíclico; y
 (vi) al menos uno de R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ es halógeno a menos que R₁ y R₂; R₂ y R₃; R₄ y R₅; o R₃ y R₄ estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono con el anillo benceno;

30

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este y un vehículo fisiológicamente compatible.

2. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde:

T es



5

$R_1, R_2, R_4, R_5, R_6, R_7, R_9$ y R_{10} son H;

R_3 es halógeno; y

R_8 es alquilo menor de estequiometría S en el átomo de carbono al cual N, T, R_7 y R_9 están unidos.

10

3. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde la sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto es seleccionada del grupo consistente de sales de hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, hidróxido de magnesio, dietanolamina, etilen amina, sales de bases, y mezclas de estos.

15

4. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es entregado a dicho paciente oralmente o mediante inyección.

20

5. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es seleccionado del grupo consistente de 2-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 3-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]-1,2,3-benzoxadiazol-7-sulfonamida, 2-cloro-4-fluor-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 5-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]-2-metoxibencenosulfonamida, 2-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]-6-metilbencenosulfonamida, 3,5-dicloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 2,4-difluoro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]naftalen-1-sulfonamida, N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]naftalen-2-sulfonamida, 3-amino-4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-

25

30

- metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-1-bencil-2-hidroxietyl]-4-bromo
bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-1-ciclohexil-1-(4-hidroxifenil)etyl]
bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1R)-2-hidroxi-1-(4-hidroxifenil)etyl]
bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-3-metilbutil]
5 bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-(1H-indol-2-ilmetil)etyl]
bencenosulfonamida, 4-bromo-2,5-difluoro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
metilbutil] bencenosulfonamida, 2,5-dibromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
metilbutil] bencenosulfonamida, 3,4-dibromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
metilbutil] bencenosulfonamida, 2,3-dicloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
10 metilbutil] bencenosulfonamida, 3,4-dicloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
metilbutil] bencenosulfonamida, 2,4,5-tricloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
metilbutil] bencenosulfonamida, 4-bromo-2,5-difluoro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-
metilpropil] bencenosulfonamida, 3,4-dicloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-
metilpropil] bencenosulfonamida, 2,4,6-tricloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-
15 metilpropil] bencenosulfonamida, 3,4-dibromo-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2,2-
dimetilpropil] bencenosulfonamida, 3,4-dicloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2,2-
dimetilpropil] bencenosulfonamida, 2,4,5-tricloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2,2-
dimetilpropil] bencenosulfonamida, 2,4,6-tricloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2,2-
dimetilpropil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1R,2R)-1-(hidroximetil)-2-
20 metilbutil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-1,2-
dimetilpropil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-(hidroximetil)-2-fenilpropil]
bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]
bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-1,2-dimetilpropil]
bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[1-(hidroximetil)-2-fenilpropil]
25 bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]
bencenosulfonamida, N-alil-4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]
bencenosulfonamida, N-[(1,1'-bifenil]-4-ilmetil)-4-cloro-N-[(1S,2S)-1-
(hidroximetil)-2-metilbutil] bencenosulfonamida, terc-butyl-2-[[[(4-clorofenil)
sulfoni] [(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]amino} etilcarbamato, 4-cloro-N-(4-
30 clorobencil)-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-
cloro-N-(ciclobutilmetil)-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]
bencenosulfonamida, 4-cloro-N-(3,4-dimetoxibencil)-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-
2-metilbutil] bencenosulfonamida,
4-cloro-N-(2-furilmetil)-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]
35 bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil]-N-[2-
(metilito)etyl] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-

- metilbutil]-N-(3-fenilprop-2-inil) bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-(4-metoxifenil)propil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-metiloctil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-fenilpropil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-etil-1-
- 5 (hidroximetil)butil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-2-etil-1-(hidroximetil)-4-metilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-metilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-2-etil-1-(hidroximetil)pentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-4-metil-2-propilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-
- 10 (4-metoxifenil)pentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-propiloctil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-fenilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilheptil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-2-etil-1-(hidroximetil)-heptil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-pentiloctil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-fenilpropil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-4-metil-2-fenilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-feniloctil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)butil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)-4-metil pentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)octil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2,3-dimetilbutil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-isopropiloctil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-(4-metoxifenil)propil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-metiloctil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-2-etil-1-(hidroximetil)-4-metilpentil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-(4-metoxifenil)butil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-2-etil-1-(hidroximetil)octil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilpentil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-2-etil-1-(hidroximetil)pentil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-4-metil-2-propilpentil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-1-(hidroximetil)-2-propiloctil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilheptil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-fenilpropil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-fenilbutil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)propil]
- 25
- 30
- 35

- bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)butil]
 bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2R)-2-(2-furil)-1-(hidroximetil)-4-
 metilpentil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
 isopropil-4-metilpentil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-2-etil-1-
 5 (hidroximetil)octil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2R)-2-etil-1-
 (hidroximetil)octil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-metil-N-[(1S,2S)-1-
 (hidroximetil)-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-2-etil-1-
 (hidroximetil)-2-metilbutil]-bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-
 3-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1R,2S)-2-hidroxi-1-metil-2-
 10 feniletil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-(hidroximetil)ciclopentil]
 bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-ciclohexil-
 (hidroximetil)etil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-1-[4-(benciloxi)bencil]-2-
 hidroxietil]-4-clorobencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1R)-1-(hidroximetil)-1-
 metilpropil] bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-
 15 metilbutil]-bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-(hidroximetil)pentil]
 bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1R,2S)-2-hidroxi-1-metil-2-feniletil]
 bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-feniletil]bencenosulfonamida,
 4-bromo-N-[(1R)-1-(hidroximetil)-3-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[1-
 (hidroximetil)ciclopentil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-(hidroximetil)butil]
 20 bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[1-(hidroximetil)butil] bencenosulfonamida, 3-
 cloro-N-[(1S)-2-ciclohexil-1-(hidroximetil)etil]bencenosulfonamida, 3-cloro-N-
 [(1R)-1-(hidroximetil)-3-(metiltio)propil]bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S)-1-
 (hidroximetil)propil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-3-
 metilbutil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[1-
 25 (hidroximetil)pentil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1R,2S)-2-hidroxi-1-metil-2-
 feniletil] bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-
 feniletil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1R)-1-(hidroximetil)-3-
 metilbutil]bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[1-(hidroximetil)ciclopentil]
 bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-ciclohexil-1-(hidroximetil)etil]-2-
 30 fluorobencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S,2S)-2-hidroxi-1-(hidroximetil)-2-[4-
 (metiltio)fenil]etil] bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S)-1-(hidroxi1-
 metiletil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-1-bencil-2-hidroxietil]-2-
 fluorobencenosulfonamida, 2-fluoro-N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-
 metilpropil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-
 35 (hidroximetil)ciclohexil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[2-
 (hidroximetil)biciclo[2.2.1]hept-2-il]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[1-

- (hidroximetil)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[1-(hidroximetil)ciclohexil]bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[1-(hidroximetil)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]bencenosulfonamida, 4-cloro-N-(1-ciclobutil-2-hidroxi-1-feniletíl)bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxietyl)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S,2S)-1-[ciclopentil(hidroxi)metil]-2-metilbutil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]heptil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi-(2-metilfenil)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-3,3-dimetil-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]bencenosulfonamida, N-[(1S,2S)-1-[(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-4-metil-1-[(1S)-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi-(4-metoxifenil)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-4-(1,3-dioxan-2-il)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi-[4-(metilsulfanil)fenil]metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S,2S)-1-[(4-(dimetilamino)fenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi-(1-naftil)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxietyl)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-[ciclopentil(hidroxi)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]heptil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-3,3-dimetil-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-[(4-fluorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-[(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-bromo-N-

- {(1S)-2-hidroxi-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil}bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil}bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi(4-metoxifenil)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-4-(1,3-dioxan-2-il)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil}bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentinil}bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi-[4-(metilsulfanil)fenil]metil}-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-[[4-(dimetilamino)fenil](hidroxi)metil]-2-metoxibutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-formil-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxietil)-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[ciclopentil(hidroxi)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]heptil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi(2-metilfenil)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-3,3-dimetil-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi(4-metoxifenil)metil]-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-4-(1,3-dioxan-2-il)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentinil}bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[4-(metilsulfanil)fenil]metil}-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[[4-(dimetilamino)fenil](hidroxi)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi-(1-naftil)metil]-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxietil)-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S,2S)-1-[ciclopentil(hidroxi)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-

- metilpropil]octil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]heptil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]hexil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-3-metil-1-[(1S)-
1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-3,3-dimetil-1-
5 [(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-4-metil-1-
[(1S)-1-metilpropil]pentil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-
1-metilpropil]-3-butenil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-
1-metilpropil]-4-pentenil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-
1-metilpropil]butil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S,2S)-1-[(4-
10 clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-
hidroxi-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil}bencenosulfonamida, 3-cloro-N-
((1S,2S)-1-[hidroxi(4-metoxifenil)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, 3-
cloro-N-((1S)-4-(1,3-dioxan-2-il)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil}
bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil}
15 bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S,2S)-1-[hidroxi[4-(metilsulfanil)fenil]metil]-2-
metilbutil} bencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-[ciclopentil(hidroxi)metil]-2-
metilbutil)-2-fluorobencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]octil}bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]heptil}bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
20 metilpropil]hexil}bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]-3-butenil} bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S,2S)-1-[(4-
fluorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-[(4-
clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil)-2-fluorobencenosulfonamida, 2-fluoro-N-
((1S,2S)-1-[hidroxi(4-metoxifenil)metil]-2-metilbutil} bencenosulfonamida, N-
25 ((1S)-4-(1,3-dioxan-2-il)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil)-2-
fluorobencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S,2S)-1-(1-hidroxi-1-metiletil)-2-
metilbutil}bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-
2-pentilheptil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S)-2-butil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
metilpropil]hexil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S)-2-hidroxi-4-isobutil-4-
30 metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S,2S)-1-
[hidroxi(difenil)metil]-2-metilbutil}bencenosulfonamida, N-((1S)-2-alil-2-hidroxi-1-
[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil)-4-bromo bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S)-
2-etil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-
[bis(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil)-4-bromobencenosulfonamida, 4-
35 bromo-N-((1S)-2-hidroxi-2-isopropenil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil}
bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-2-[(1E)-1-metil-1-

- propenil]-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S)-2-(3-butenil)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil]
 bencenosulfonamida, 4-bromo-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[di(1-naftil)]metil}-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxi-1-metiletil)-2-metilbutil]
 5 metilpropil]octil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hexil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil} bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-butil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil]-4-clorobencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-2-isobutil-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-[hidroxi(difenil)metil]-2-metilbutil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-alil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil]-4-cloro bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-etil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-2-isopropenil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil]
 10 bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[bis(4-metoxifenil)]metil}-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-2-[(1E)-1-metil-1-propenil]-1-[(1S)-1-metilpropil]-1-pentenil] bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-(3-butenil)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil]-4-cloro bencenosulfonamida, 4-cloro-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[di(1-naftil)]metil}-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-(1-hidroxi-1-metiletil)-2-metilbutil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hexil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil} bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-2-pentilheptil} bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-butil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-2-isopropil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-2-isobutil-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil]bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-alil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil]-4-fluoro bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-etil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S)-2-hidroxi-2-isopropenil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil]bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[bis(4-metoxifenil)metil]-2-metoxibutil] bencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-2-[(1E)-1-metil-1-propenil]-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil] bencenosulfonamida, N-[(1S)-2-(3-butenil)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil]-4-fluorobencenosulfonamida, N-[(1S,2S)-1-[bis[4-(dimetilamino)fenil](hidroxi)metil]-2-metilbutil]-4-fluorobencenosulfonamida, 4-fluoro-N-[(1S,2S)-1-{hidroxi[di(1-naftil)]metil}-2-metilbutil] bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S)-2-hexil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-[(1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-
- 35

metilpropil]-2-pentilheptil} bencenosulfonamida, N-((1S)-2-butil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil)-3-clorobencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-2-isobutil-4-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]pentil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S,2S)-1-[hidroxi(difenil)metil]-2-metilbutil)bencenosulfonamida, N-((1S)-2-alil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-4-pentenil)-3-cloro bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-etil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil} bencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-[bis(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil-3-cloro bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-2-isopropenil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil} bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S,2S)-1-[hidroxi[bis(4-metoxifenil)]metil]-2-metilbutil)bencenosulfonamida, 3-cloro-N-((1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-2-[(1E)-1-metil-1-propenil]-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil} bencenosulfonamida, N-((1S)-2-(3-butenil)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil)-3-clorobencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hexil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]octil} bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-2-pentilheptil)bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S,2S)-1-[hidroxi(difenil)metil]-2-metilbutil)bencenosulfonamida, N-((1S)-2-alil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]hexil)-4-pentenil)-2-fluorobencenosulfonamida, N-((1S)-2-etil-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]butil)-2-fluorobencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-[bis(4-fluorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil)-2-fluoro bencenosulfonamida, N-((1S,2S)-1-[bis(4-clorofenil)(hidroxi)metil]-2-metilbutil)-2-fluoro bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S)-2-hidroxi-2-isopropenil-3-metil-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-butenil} bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S,2S)-1-[hidroxi[bis(4-metoxifenil)]metil]-2-metilbutil) bencenosulfonamida, 2-fluoro-N-((1S,3E)-2-hidroxi-3-metil-2-[(1E)-1-metil-1-propenil]-1-[(1S)-1-metilpropil]-3-pentenil} bencenosulfonamida, N-((1S)-2-(3-butenil)-2-hidroxi-1-[(1S)-1-metilpropil]-5-hexenil)-2-fluoro bencenosulfonamida, 4-cloro-N-((1S)-1-ciclohexil-2-hidroxietil} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-((1S)-2-hidroxi-1-feniletíl} bencenosulfonamida, 4-cloro-N-((1S)-1-(hidroximetil)-2-metilpropil} bencenosulfonamida, 4-bromo-N-((1S)-1-(hidroximetil)-2-metilpropil} bencenosulfonamida, 4-yodo-N-((1S,2S)-1-(hidroximetil)-2-metilbutil} bencenosulfonamida, y 4-cloro-N-((1S)-1-(hidroximetil)-2,2-dimetilpropil} bencenosulfonamida;

o una sal, hidrato, metabolito o profármaco farmacéuticamente aceptable de estos.

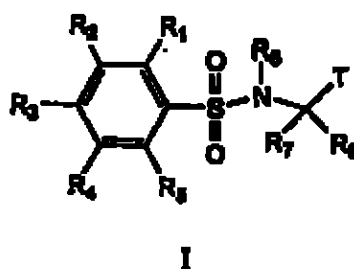
6. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde el compuesto es 4-cloro-N-[(1S,2S)-2-etil-1-(hidroximetil)butil] bencenosulfonamida o una sal farmacéuticamente aceptable, metabolito, hidrato o profármaco de este.

5

7. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo 1,2,3-oxadiazol.

8. La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde R_5 está enlazado a R_4 para formar un anillo 1,2,3-oxadiazol.

9. Una composición farmacéutica para prevenir o tratar la enfermedad de Alzheimer, síndrome de Down, deterioro cognitivo medio y otras enfermedades involucradas con beta amiloide en un mamífero en necesidad del mismo, caracterizada por contener un compuesto de Formula I:



En donde

R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;
 R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y $N=N$;
 R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;
 R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;
 R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

25

o

R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

30

R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

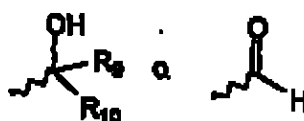
5 R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

R_8 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquilo sustituido, cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -3-indol, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH (alquilo menor)fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo; o

R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado con base en carbono;

15

T es



20

R_9 y R_{10} son H; o

R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, CF_3 , cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

25

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

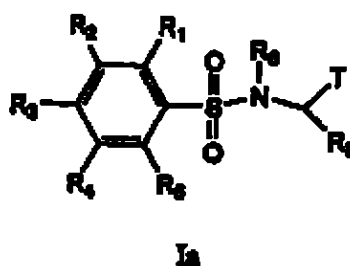
En donde:

30

- (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
- (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
- (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;

- (iv) cuando R_2 es $N=N$ y R_1 es O ; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico;
- (v) cuando R_4 es $N=N$ y R_5 es O ; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico; y
- 5 (vi) al menos uno de R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y R_5 es halógeno a menos que R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono con el anillo benceno;
- o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de
- 10 este y un vehículo fisiológicamente compatible.

10. La composición farmacéutica según la reivindicación 9, en donde R_3 es halógeno y R_8 es un alquilo menor de estereoquímica S en el átomo de carbono al cual N , T , R_7 y R_8 están unidos; o una sal farmacéuticamente aceptable.
- 15
11. Un compuesto es de fórmula Ia:

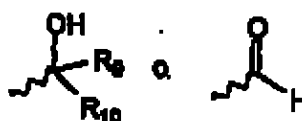


En donde

- 20 R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O ;
- R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y $N=N$;
- R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;
- R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;
- 25 R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O ;
- R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-
- 30 furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

- R_8 es seleccionado del grupo consistente de n-propilo, iso-propilo, iso-butilo, n-butilo, t-butilo, butilo sustituido, hexilo opcionalmente sustituido, heptilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo, CH_2 cicloalquilo, $\text{CH}(\text{alquilo menor})$ -2-furano, $\text{CH}(\text{alquilo menor})$ -4-metoxifenilo, $\text{CH}(\text{alquilo menor})$ fenilo, $\text{CH}(\text{OH})$ -4-SCH₃-fenilo y $(\text{CH}_2)_2$ -S-alquilo menor;

T es



- R_9 y R_{10} son H; o
- 10 R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, CF_3 , alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

- R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de
- 15 alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

En donde:

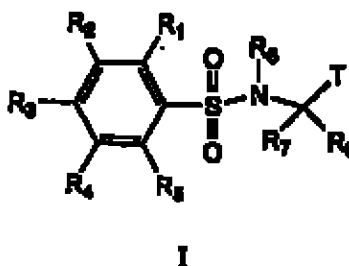
- (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
- (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
- 20 (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;
- (iv) cuando R_2 es $\text{N}=\text{N}$ y R_1 es O; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico;
- (v) cuando R_4 es $\text{N}=\text{N}$ y R_5 es O; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico; y
- 25 (vi) uno o más de R_1 a R_5 es un halógeno;
- (vii) cuando R_3 es halogeno, R_6 es butilo y R_9 y R_{10} son H, al menos uno entre R_1 , R_2 , R_4 y R_5 no es H;

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

30

12. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente compatible y un compuesto según la reivindicación 11.

13. Un compuesto de Formula I:



5 En donde

R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;

R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;

R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y N=N;

10 R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O; o

R_1 y R_2 o R_4 y R_5 están fusionados para formar un anillo insaturado basado en Carbono;

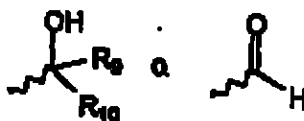
15 R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$ y $(\text{CH}_2)_2\text{NHBOC}$;

R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

20

R_8 es seleccionado del grupo consistente de bencilo y bencilo sustituido;

T es



25 R_9 y R_{10} son H; o

R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, CF_3 , alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

5 En donde:

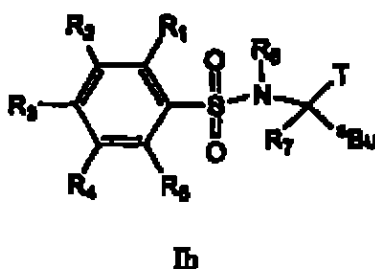
- (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
- (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
- (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;
- (iv) cuando R_2 es N=N y R_1 es O; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico;
- (v) cuando R_4 es N=N y R_5 es O; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico; y
- (vi) uno o más de R_1 a R_5 es un halógeno;

15 o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

14. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente aceptable y un compuesto según la reivindicación 13.

20

15. Un compuesto de Formula Ib:



25 En donde

- R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;
- R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;
- R_3 es seleccionado del grupo consistente de H, bromo, flúor, y yodo;
- R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y N=N;
- R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

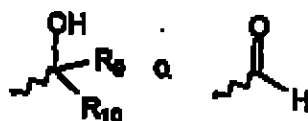
30

R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

5

R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

T es



10

R_9 y R_{10} son H; o

R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, CF_3 , alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

15

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

20

En donde:

- (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
- (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
- (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;
- (iv) cuando R_2 o R_4 es $N=N$; R_1 o R_5 es O, y R_2 o R_4 está enlazado a R_1 o R_5 para formar un anillo heterocíclico; y
- (v) uno o más de R_1 a R_5 es un halógeno;

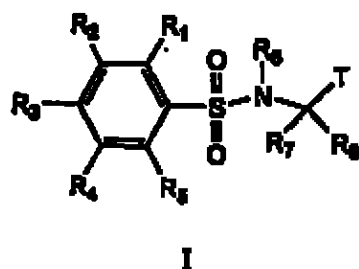
25

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

30

16. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente aceptable y un compuesto según la reivindicación 15.

17. Un compuesto de Formula I:



5

En donde

- R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;
- R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;
- R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;
- 10 R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y N=N;
- R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

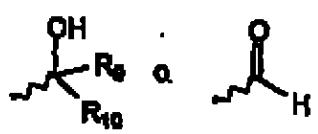
- R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alqueno menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

- R_7 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor y cicloalquilo;

- 20 R_8 es seleccionado del grupo consistente de cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH (alquilo menor)fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo;

25

T es



R_9 y R_{10} son H; o

R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, CF_3 , alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

5

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

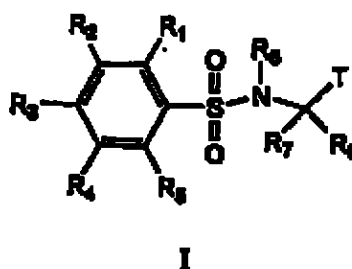
En donde:

- 10 (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
 (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
 (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;
 (iv) cuando R_2 es $N=N$ y R_1 es O; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico; y
 15 (v) cuando R_4 es $N=N$ y R_5 es O; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico; y
 (vi) uno o más de R_1 a R_5 es un halógeno;

20 o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

18. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente aceptable y un compuesto según la reivindicación 17.

25 19. Un compuesto de Formula I:



En donde

- 30 R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;
 R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y $N=N$;
 R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O; o R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

5

R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alqueno menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

10

R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

15

R_8 es seleccionado del grupo consistente de cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH (alquilo menor)fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo; o

R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado con base en carbono;

20

T es



25

En donde:

(i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;

(ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;

(iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;

30

(iv) cuando R_2 es $N=N$ y R_1 es O; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico;

(v) cuando R_4 es $N=N$ y R_5 es O; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico;

(vi) cuando cada uno de R_1 , R_2 , R_4 , R_5 y R_6 es H, R_3 es halógeno y R_7 es H, entonces R_8 es alquilo C_5 a C_8 , o R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado basado en carbono;

(vii) cuando cada uno de R_3 , R_4 , R_5 , R_6 y R_7 es H, y R_1 y R_2 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono, entonces R_8 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo; CH (alquilo menor) fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo;

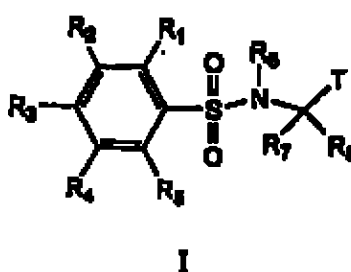
(viii) cuando cada uno de R_1 , R_2 , R_4 , R_5 y R_6 es H, y R_3 es halógeno, entonces R_7 y R_8 no son ambos CH_3 ; y

(ix) al menos uno de R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y R_5 es halógeno, a menos que R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono, con el anillo benceno;

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

20. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente aceptable y un compuesto según la reivindicación 19.

21. Un compuesto de Formula I:



En donde

R_1 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;

R_2 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y $N=N$;

R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

o

5

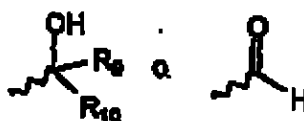
R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

R_6 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado con base en carbono;

15

T es



R_9 y R_{10} son H; o

R_9 es H y R_{10} es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, CF_3 , alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH_2CH_2 -1,3-dioxalano; o

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

25

En donde:

- (i) cuando R_5 es un metoxi; R_2 es halógeno y R_1 , R_3 y R_4 son H;
- (ii) cuando R_5 es un metilo; R_1 es halógeno y R_2 , R_3 y R_4 son H;
- (iii) cuando R_4 es un amino; R_3 es halógeno y R_1 , R_2 y R_5 son H;
- (iv) cuando R_2 es $N=N$ y R_1 es O; R_2 está enlazado a R_1 para formar un anillo heterocíclico;

30

(v) cuando R_4 es $N=N$ y R_5 es O ; R_4 está enlazado a R_5 para formar un anillo heterocíclico; y

(vi) al menos uno de R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y R_5 es halógeno a menos que R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono, con el anillo benceno;

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este.

10 22. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo fisiológicamente aceptable y un compuesto según la reivindicación 21.

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

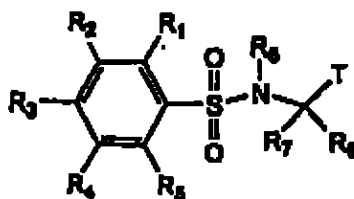
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
R.S.O. 05-000582- -00004-0000
Fec: 2007-03-08 16:37:30 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTE/II
Eve: 3/9 FASE NACIONAL II
Act 329 CTOINFORMACION Folios. 33

Re: P1.-WYETH Y AROULE INC.-Solicitud de Patente de Invención
en Fase Nacional PCT para "FENILSULFONAMIDAS
SUSTITUIDAS COMO INHIBIDORES DE LA PRODUCCION DE
BETA AMILOIDES".-Clase A61K 31/18.-Expediente número
05-000.582.-

1. Me refiero a memorial de 18 de Mayo de 2005.
2. Debidamente autorizado por mi representado, me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante modificar el capítulo reivindicatorio de la presente solicitud, tal como se muestra a continuación:
 - La Reivindicación original 1 se modifica remplazando su contenido por el texto citado a continuación:
"Una composición farmacéutica para el uso en el monitoreo de niveles de beta-amiloide en un paciente **caracterizada** por contener un compuesto de fórmula I:



I

en donde

R₁ es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;

R₂ es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6089700 Fax 6089701

285

R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

o

R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alqueno menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

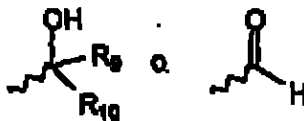
R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

R_8 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquilo sustituido, cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -3-indol, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH (alquilo menor)fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo;

o

R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado con base en carbono;

T es



R_9 y R_{10} son H; o

R₉ es H y R₁₀ es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, CF₃, alquenilo menor, alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH₂CH₂-1,3-dioxalano; o

R₉ y R₁₀ son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

En donde:

- (i) cuando R₅ es un metoxi; R₂ es halógeno y R₁, R₃ y R₄ son H;
- (ii) cuando R₅ es un metilo; R₁ es halógeno y R₂, R₃ y R₄ son H;
- (iii) cuando R₄ es un amino; R₃ es halógeno y R₁, R₂ y R₅ son H;
- (iv) cuando R₂ es N=N y R₁ es O; R₂ está enlazado a R₁ para formar un anillo heterocíclico;
- (v) cuando R₄ es N=N y R₅ es O; R₄ está enlazado a R₅ para formar un anillo heterocíclico; y
- (vi) al menos uno de R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ es halógeno a menos que R₁ y R₂; R₂ y R₃; R₄ y R₅; o R₃ y R₄ estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono con el anillo benceno;

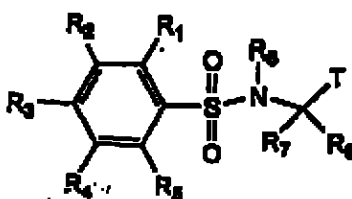
o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este."

- La Reivindicación original 2 fue eliminada.
- La Reivindicación original 3 pasa a ser la nueva reivindicación 2 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 4 pasa a ser la nueva reivindicación 3 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 5 pasa a ser la nueva reivindicación 4 reemplazando su contenido por el texto citado a continuación:

"La composición farmacéutica según la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es entregado a dicho paciente oralmente o mediante inyección."

- La Reivindicación original 6 pasa a ser la nueva reivindicación 5 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 7 pasa a ser la nueva reivindicación 6 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 8 pasa a ser la nueva reivindicación 7 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 9 pasa a ser la nueva reivindicación 8 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 1 o uso según la reivindicación 2" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 1".
- La Reivindicación original 10 pasa a ser la nueva reivindicación 9 reemplazando su contenido por el texto citado a continuación:

"Una composición farmacéutica para prevenir prevenir o tratar la enfermedad de Alzheimer, síndrome de Down, deterioro cognitivo medio y otras enfermedades Involucradas con beta amiloide en un mamífero en necesidad del mismo, **caracterizada** por contener un compuesto de Formula I:



I

En donde

R₁ es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y O;

R₂ es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno y N=N;

R₃ es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_4 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, amino y $N=N$;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de H, halógeno, metoxi, metilo y O;

o

R_1 y R_2 ; R_2 y R_3 ; R_4 y R_5 ; o R_3 y R_4 están fusionados para formar un anillo naftaleno basado en Carbono, con el anillo benceno;

R_6 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor, alquenilo menor, 3-fenil-2-propin-1-ilo, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -2-furano, $(CH_2)_2SCH_3$ y $(CH_2)_2NHBOC$;

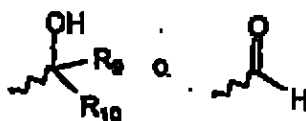
R_7 es seleccionado del grupo consistente de H, alquilo menor y cicloalquilo;

R_8 es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquilo sustituido, cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido, bencilo, bencilo sustituido, CH_2 cicloalquilo, CH_2 -3-indol, CH (alquilo menor)-2-furano, CH (alquilo menor)-4-metoxifenilo, CH (alquilo menor)fenilo, y $CH(OH)$ -4- SCH_3 -fenilo;

o

R_7 y R_8 están fusionados para formar un anillo saturado con base en carbono;

T es



R_9 y R_{10} son H; o

R₉ es H y R₁₀ es seleccionado del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, alquenilo sustituido con metilo, alquinilo menor, CF₃, cicloalquilo, fenilo sustituido, 1-naftilo, y CH₂CH₂-1,3-dioxalano; o

R₉ y R₁₀ son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo menor, alquenilo menor, fenilo, 4-sustituido-fenilo, y 1-naftilo;

En donde:

- (i) cuando R₅ es un metoxi; R₂ es halógeno y R₁, R₃ y R₄ son H;
- (ii) cuando R₅ es un metilo; R₁ es halógeno y R₂, R₃ y R₄ son H;
- (iii) cuando R₄ es un amino; R₃ es halógeno y R₁, R₂ y R₅ son H;
- (iv) cuando R₂ es N=N y R₁ es O; R₂ está enlazado a R₁ para formar un anillo heterocíclico;
- (v) cuando R₄ es N=N y R₅ es O; R₄ está enlazado a R₅ para formar un anillo heterocíclico; y
- (vi) al menos uno de R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ es halógeno a menos que R₁ y R₂; R₂ y R₃; R₄ y R₅; o R₃ y R₄ estén fusionados para formar un anillo naftaleno basado en carbono con el anillo benceno;

o una sal, metabolito, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable de este."

- La Reivindicación original 11 fue eliminada.
- La Reivindicación original 12 pasa a ser la nueva reivindicación 10 con la siguiente modificación: Donde se leía "El método según la reivindicación 10 o uso según la reivindicación 11" debe leerse ahora "La composición farmacéutica según la reivindicación 9".
- La reivindicación original 13 pasa a ser la nueva reivindicación 11 con la inclusión del numeral
"(vii) cuando R₃ es halógeno, R₈ es butilo y R₉ y R₁₀ son H, al menos uno entre R₁, R₂, R₄ y R₅ no es H; "
- La Reivindicaciones originales 14 a 24 pasan a ser las nuevas reivindicaciones 12 a 22 con las modificaciones correspondientes en las dependencias.

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 8089700 Fax 8089701

290

Sobre este particular, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que las modificaciones realizadas en el capítulo descriptivo de la presente solicitud, no amplían de manera alguna el alcance de la presente invención, toda vez que las mismas solamente obedecen a corregir algunos errores tipográficos, en aras de permitir un mejor entendimiento de la presente invención. Adicionalmente, dichas modificaciones se encuentran perfectamente sustentadas en el capítulo descriptivo, como se expuso anteriormente.

3. Anexos:

- (a) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (b) Recibo No. 07-13.783, que acredita el pago de la tasa de modificaciones; y
- (c) Copia de las páginas 105 a 128 del capítulo descriptivo, las cuales reemplazan aquellas presentadas originalmente, en las que se han realizado las modificaciones expuesta anteriormente.

4. En vista de lo anterior, ruego a Usted tomar atenta nota y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215