

230
230

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-007559- -00007-0000

Fecha: 2009-10-05 15:00:03 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASE NACIONAL I
Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 30

Clarke, Modet & C^o

COLOMBIA

P-1776

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: Expediente No. **06.007.559**

Solicitud de patente a nombre de **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.**

Yo, DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, actuando como apoderada sustituta de acuerdo con la sustitución adjunta, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.**, domiciliada Beerse, Belgica, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 07663 notificado por fijación en lista el 10 de julio de 2009 relacionado con el concepto técnico de fondo No. 2113, me permito manifestar:

1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo juego de reivindicaciones, que ahora consta de 16 reivindicaciones y en donde se realizaron las siguientes modificaciones:

1.1 Se cancelaron las antiguas reivindicaciones 35-55, 59-65, 69-75, 79-85, 89-95, 99-105 relacionadas con métodos de tratamiento.

1.2 Se excluyeron del nuevo juego de reivindicaciones las cláusulas 46, 56, 66, 76, 86, 96 y 106 que hacían referencia a un equipo que comprendía uno o más recipientes con una cantidad de la composición farmacéutica de la solicitud.

1.3 Se canceló de la expresión "caracterizado además" el término además, de acuerdo con lo sugerido por el señor examinador.

1.4 Ahora, el nuevo capítulo reivindicatorio consta que 40 cláusulas, las cuales tienen sustento en el antiguo capítulo reivindicatorio como a continuación se muestra:

Nueva Reivindicación	Sustento dentro del antiguo juego de reivindicaciones
1	Antigua reivindicación 1
2	Antigua reivindicación 19
3	Antigua reivindicación 20
4	Antigua reivindicación 21
5	Antigua reivindicación 22
6	Antigua reivindicación 23
7	Antigua reivindicación 24
8	Antigua reivindicación 25
9	Antigua reivindicación 26
10	Antigua reivindicación 27
11	Antigua reivindicación 28
12	Antigua reivindicación 29
13	Antigua reivindicación 30
14	Antigua reivindicación 31
15	Antigua reivindicación 32
16	Antigua reivindicación 107
17	Antigua reivindicación 108
18	Antigua reivindicación 109
19	Antigua reivindicación 110
20	Antigua reivindicación 111
21	Antigua reivindicación 112
22	Antigua reivindicación 113
23	Antigua reivindicación 114
24	Antigua reivindicación 115
25	Antigua reivindicación 116
26	Antigua reivindicación 117
27	Antigua reivindicación 118
28	Antigua reivindicación 119
29	Antigua reivindicación 120
30	Antigua reivindicación 121
31	Antigua reivindicación 122
32	Antigua reivindicación 123
33	Antigua reivindicación 124
34	Antigua reivindicación 125
35	Antigua reivindicación 126
36	Antigua reivindicación 127
37	Antigua reivindicación 128
38	Antigua reivindicación 129
39	Antigua reivindicación 33
40	Antigua reivindicación 34

- 1.5 Se introdujo dentro de las nuevas reivindicaciones 1, 2, 8, 16 y 33 el disclaimer: *“con la condición de que cuando X es S, R1 es diferente de CONMe₂ ó CONEt₂ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo”* con el propósito de hacer la exclusión expresa de materia del alcance de la presente invención.
- 1.6 Se canceló el término “solvatos” dentro de las nuevas reivindicaciones.

Sobre este particular nos permitimos manifestar que las anteriores modificaciones no involucran ampliación alguna de la materia originalmente presentada en esta solicitud y se dan como respuesta a las objeciones presentadas por el señor examinador en su concepto técnico No. 2113.

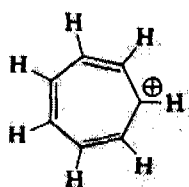
Teniendo en cuenta el concepto técnico emitido por el Señor Superintendente Delegado para la propiedad intelectual GianCarlo Marcenaro Jiménez a la doctora Ana Maria Castro Wey, que da alcance a las comunicaciones No. 09-001524 y 09-012566, no se presenta una tasa adicional, toda vez que el nuevo capítulo reivindicatorio comprende menos de 15 reivindicaciones y la solicitud fue presentada con anterioridad al 1 de enero de 2009.

2. Claridad de la solicitud

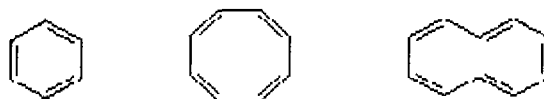
- 2.1 En cuanto a la objeción relacionada con el término “solvatos”, atentamente nos permitimos decir que con la cancelación de dicha expresión dentro del nuevo capítulo reivindicatorio, queda cabalmente superada dicha objeción.
- 2.2 Respecto a las antiguas reivindicaciones 19, 25, 28, 29, 30, 107 y 124, atentamente manifestamos que ahora son dependientes de la reivindicación 1.
- 2.3 Con la cancelación del término “además” queda claro que no se están adicionando nuevas características sino que hacen referencia a limitaciones en los sustituyentes establecidos en las reivindicación 1.
- 2.4 En relación con la objeción del señor examinador sobre la claridad de términos como heteroariloalcanilo de C₁₋₈, nos permitimos decir que luego de realizar la búsqueda de aquellos términos donde no era especificado el número de carbonos, se incluyeron teniendo en cuenta lo manifestado en la memoria descriptiva, especialmente desde la página 8 línea 15 hasta la página 16, línea 10. No obstante, agradecemos que el señor examinador indique exactamente cuales términos son los que no tienen determinado el número de carbonos dentro de las reivindicaciones, pues al verificar no encontramos términos que no tengan tales especificaciones de acuerdo con lo manifestado en la descripción.

Respecto al término arilo de C_{6-10} atentamente manifestamos que contrario a lo establecido por el señor examinador, pueden existir estructuras de 7 a 10 átomos de carbono donde los dobles enlaces se encuentran dispuestos de forma alternada lo cual les puede dar a dichas estructuras un carácter aromático.

Por ejemplo el catión cicloheptatrienilo:



Y las estructuras cíclicas como ciclooctatetraeno y ciclodecapentaeno que presentan el mismo patrón del benceno.



Por lo tanto, consideramos que los sustituyentes revelados en el capítulo reivindicatorio se encuentran definidos de manera específica y clara y acorde con lo manifestado en la descripción.

- 2.5 De otra parte, nos permitimos señalar que no estamos de acuerdo con la objeción planteada en cuanto a que no exista soporte para toda la materia revelada en las reivindicaciones, pues claramente la descripción hace alusión específica a cada una de las modalidades de compuestos que se pretenden proteger. Por lo tanto, no consideramos procedente realizar una restricción tan extrema a los sustituyentes mencionados por el señor examinador, pues los compuestos de la solicitud presentan actividad como moduladores del receptor delta-opioide como se puede evidenciar en el cuadro 2 donde se reportan los datos biológicos junto con los espectros de masa para los compuestos representativos de la invención en estudio.
- 2.6 Finalmente, en relación con las antiguas reivindicaciones dirigidas a composiciones, nos permitimos manifestar que en el nuevo capítulo reivindicatorio se dejaron únicamente dos de estas cláusulas.

3. Excepciones a la patentabilidad

Sobre este particular, nos permitimos señalar que las antiguas reivindicaciones relacionadas con métodos de tratamiento, se cancelaron del capítulo reivindicatorio.

4. Unidad de Invención

De igual manera, la objeción planteada en cuanto a las antiguas cláusulas 46, 56, 66, 76, 86, 96 y 106 que hacían referencia a un equipo, nos permitimos manifestar que también queda cabalmente superada gracias a su cancelación.

5. Novedad

En cuanto a este requisito, el señor examinador expresa que el documento D1 incluye compuestos de la solicitud en estudio y que por tal razón no se cumple con el requisito de novedad.

Sobre este particular, respetuosamente nos permitimos manifestar que el artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que la invención se considera como nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica. Si de acuerdo con el espíritu de la norma legal indicada, la invención no se considera como nueva si está “comprendida” en el estado de la técnica, dicha norma se está refiriendo, naturalmente, a la **totalidad del invento** y no a **alguno o a algunos** de los componentes.

Así pues, para que la invención pierda su calidad de novedosa, es claro que ella, TODA ELLA, ha de estar contenida en el “*conjunto de conocimientos existentes que son aplicables al proceso industrial*” como define el estado de la técnica el Tribunal de justicia del Acuerdo de Cartagena (Proceso No. 6-IP-89, sentencia de 31 de octubre de 1989, publicada en Jurisprudencia del Tribunal de Justicia del Acuerdo de Cartagena, Tomo 11, BID-INTAL, Buenos Aires, 1994, página 60).

Lo anterior se conoce como NOVEDAD ABSOLUTA, de conformidad con lo cual para desvirtuar el requisito de novedad de una invención será necesario que lo reivindicado por la invención bajo estudio corresponda de forma total con lo revelado en un documento o anterioridad señalada o de manera independiente si son varias referencias, conclusión a la que se llega después de un análisis exhaustivo mediante una comparación entre el capítulo reivindicatorio de la invención en estudio y la divulgación D1.

Ahora bien, si un determinado elemento, condición o circunstancia de la nueva creación ya hace parte del estado de la técnica no quiere ello decir, desde luego,

que la invención deba ser rechazada por carecer del requisito de novedad. No sin razón ha dicho el mencionado Tribunal: *"hay que advertir que toda creación es en cierta forma, producto del estado de la técnica existente, en el sentido de que el inventor ha de tener en cuenta un conjunto de conocimientos técnicos que le permitan crear nuevos procedimientos aplicables a la industria"* (Ibidem, páginas 53 y 54) (El subrayado es nuestro).

Por lo tanto, como mínimo la novedad debe contemplar los siguientes aspectos:

-Que la invención en estudio esté contenida de forma TOTAL y ABSOLUTA en el documento que se menciona como anterioridad;

-Que la invención en estudio puede partir de conocimientos conocidos, caso en el cual habrá que hacer la comparación no de lo conocido sino de lo inédito y novedoso, teniendo que analizarse **el valor agregado** que aporta la invención con sus nuevas características al campo técnico al cual pertenece la invención en estudio.

Aplicando lo anterior al caso concreto, para que las razones que aduce ese despacho para desvirtuar la novedad fuesen ciertas, sería forzoso que se demostrara que la invención de mi mandante esté comprendida en el estado de la técnica de forma TOTAL, es decir, en cada uno de los documentos citados, lo cual no sucede, mucho menos ahora a la luz de las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio, como a continuación se demostrará.

En efecto, la presente invención ahora a la luz del nuevo capítulo reivindicatorio tiene novedad absoluta, toda vez que gracias al disclaimer introducido en el capítulo reivindicatorio la pequeña porción de superposición entre las enseñanzas generales de D1 y la solicitud en estudio se excluyó del alcance de la invención, toda vez cuando X en la fórmula (I) es azufre, el radical R_1 no puede ser $\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ ó $\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$.

Así las cosas, la presente invención cumple con los requisitos exigidos por la Decisión 486 de la Comunidad Andina, especialmente en lo que respecta a la novedad y el nivel inventivo, pues los compuestos aquí revelados no habían sido reportados por la técnica anterior como compuestos alternativos útiles para los receptores delta-opioide.

Habiendo atendido cabalmente las objeciones presentadas por ese despacho, atentamente solicitamos se conceda el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio o si el examinador considera que subsisten razones para objetar la presente invención, rogamos expedir otro examen de fondo con los debidos motivos y razones que sustenten su objeción con el fin de que nuestro mandante tenga la posibilidad de exponer sus argumentos con base en la

interpretación de los artículos 45 de la Decisión 486 -el cual otorga la facultad al examinador para emitir los exámenes de fondo-, 35 y 59 del Código Contencioso Administrativo que señala que: *“habiéndose dado oportunidad a los interesados para expresar sus opiniones, y con base en las pruebas e informes disponibles, se tomará la decisión que será motivada al menos en forma sumaria si afecta a particulares”* y *“(..) deberá proferirse la decisión definitiva. Esta se motivará en sus aspectos de hecho y de derecho, y en los de conveniencia si es el caso”*, respectivamente (El subrayado es nuestro).

En consecuencia, pedimos a ese despacho pronunciarse en relación con todos los argumentos presentados en este memorial dando estricta aplicación al principio del debido proceso consagrado en el artículo 29 de la Constitución Nacional

Señor Superintendente,

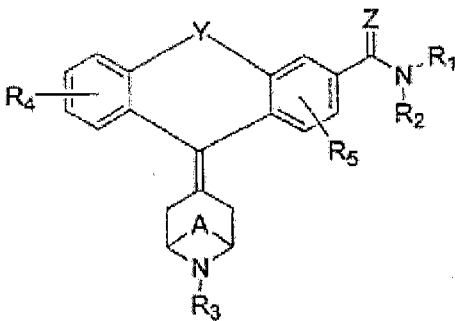


DILIA RODRIGUEZ D' ALEMAN
C.C. 41.654.882 de Bogotá
T.P. 20824 del C.S.J.

REIVINDICACIONES

1.- Un compuesto de fórmula (I):

5



Fórmula (I)

10 en donde: R₁ y R₂ son sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y alcanilo de C₁₋₈;

R₃ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C₁₋₈, halo₁₋₃-alcanilo de C₁₋₈, alquenilo de C₂₋₈, alquinilo de C₂₋₈, cicloalcanilo de C₃₋₈, cicloalcanil-alcanilo de C₁₋₈, alcaniloxi(C₁₋₈)-alcanilo de C₁₋₈, alcaniltio(C₁₋₈)-alcanilo
15 de C₁₋₈, hidroxialcanilo de C₁₋₈, alcaniloxi(C₁₋₈)-carbonilo, halo₁₋₃-alcanil(C₁₋₈)-carbonilo, formilo, tioformilo, carbamimidoilo, fenilimino-alcanilo de C₁₋₈, fenil-alcanilo de C₁₋₈, fenil-alquenilo de C₁₋₈, fenil-alquinilo de C₁₋₈, naftil-alcanilo de C₁₋₈ y heteroaril-alcanilo de C₁₋₈;

en donde el fenilo, naftilo y heteroarilo están sustituidos opcionalmente con
20 uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alcanilo de C₁₋₆, alquenilo de C₂₋₆, alcaniloxi de C₁₋₆, amino, alcanil(C₁₋₆)-amino, di(alcanil(C₁₋₆))-amino, alcanil(C₁₋₆)-carbonilo, alcanil(C₁₋₆)-carboniloxi, alcanil(C₁₋₆)-carbonilamino, alcaniltio de C₁₋₆, alcanilsulfonilo de C₁₋₆, halógeno, hidroxilo, ciano, fluoroalcanilo de C₁₋₈, tioureido y fluoroalcaniloxi; u opcionalmente,
25 cuando el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada; en donde la porción fusionada se selecciona del grupo que consiste de -(CH₂)₃₋₅- y -O(CH₂)₁₋₃-O-;

R_4 es de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno, alcanilo de C_{1-6} , alquenilo de C_{2-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , amino, alcanil(C_{1-6})-amino, di(alcanil(C_{1-6}))-amino, alcanil(C_{1-6})-carbonilo, alcanil(C_{1-6})-carboniloxi, alcaniloxi(C_{1-6})-carbonilo, alcanil(C_{1-6})-aminocarbonilo, di(alcanil(C_{1-6}))-aminocarbonilo, alcanil(C_{1-6})-carbonilamino, alcaniltio de C_{1-6} , alcanilsulfonilo de C_{1-6} , halógeno, hidroxilo, ciano, hidroxycarbonilo, arilo de C_{6-10} , cromanilo, cromenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo, isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, naftiridinilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinolizínilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolilo, tiofenilo, fluoroalcanilo y fluoroalcaniloxi; u opcionalmente, cuando R_4 son dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada, en donde la porción fusionada se selecciona del grupo que consiste de $-(CH_2)_{3-5}-$ y $-O(CH_2)_{1-3}-O-$;

R_5 es uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno, alcanilo de C_{1-6} , alquenilo de C_{2-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , amino, alcanil(C_{1-6})-amino, di(alcanil(C_{1-6}))amino, alcanil(C_{1-6})-carbonilo, alcanil(C_{1-6})-carboniloxi, alcaniloxi(C_{1-6})-carbonilo, alcanil(C_{1-6})-aminocarbonilo, alcanil(C_{1-6})-carbonilamino, alcaniltio de C_{1-6} , alcanilsulfonilo de C_{1-6} , halógeno, hidroxilo, ciano, fluoroalcanilo y fluoroalcaniloxi;

A es $-(CH_2)_m-$, en donde m es 0, 2 o 3;

Y es $-(CH_2)_nX-$ ó $-X(CH_2)_n-$; X es O, o S;

n es 0 o 1;

Z es O, o S; y

con la condición de que cuando X es S, R^1 es diferente de $CONMe_2$ ó $CONEt_2$ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo y

enantiómeros, diastereómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente

aceptables del mismo.

2.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R_1 es alcanilo de C_{1-8}

5 R_2 es hidrógeno ó alcanilo de C_{1-3} ;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C_{1-8} , alquenilo de C_{2-8} , alquinilo de C_{2-8} , alcaniloxi(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , alcaniltio(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , hidroxialcanilo de C_{1-8} , tioformilo, fenilimino-alcanilo de C_{1-8} , fenil-alcanilo de C_{1-8} , y heteroaril-alcanilo de C_{1-8} ;

10 en donde el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alcaniloxi de C_{1-6} , e hidroxil; u opcionalmente, cuando el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada; en
15 donde la porción fusionada se selecciona de $-O(CH_2)_{1-3}-O-$;

R_4 es de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno, alcanilo de C_{1-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , alcanil(C_{1-6})-aminocarbonilo, alcanil(C_{1-6})-carbonilamino, halógeno, hidroxil, arilo de C_{6-10} , cromanilo, cromenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo,
20 isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, naftiridinilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinolizínilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolilo y tiofenilo,

R_5 es uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno y halógeno;

25 A se encuentra ausente o es CH_2CH_2 ;

Y es O, S; CH_2O ó OCH_2 ;

Z es O, y

con la condición de que cuando X es S, R^1 es diferente de $CONMe_2$ ó

CONEt₂ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo y

y

enantiómeros, diasterómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente
5 aceptables del mismo.

3.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado porque
R₁ es etilo; R₂ es etilo ó hidrógeno; y

R₃ es benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, carbamimidoil, 1H-imidazol-4-ilmetil,
10 feniliminometil, 1-prop-2-inil, tioformil, 2-hidroxifenilmetil, hidroxietil, metoxietil, 2-
metil-alil, 2-metil-but-2-enil, alil, furan,-3-ilmetil, H, Me, metiltioetil, fenetil, piridin-2-
ilmetil o tiofen-2-ilmetil.

4.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 caracterizado porque
15 R₁ es etil, R₂ es etilo; y

R₃ es benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, carbamimidoil, 1H-imidazol-4-ilmetil,
feniliminometil, 1-prop-2-inil, tioformil, 2-hidroxifenilmetil, hidroxietil, metoxietil, alil,
furan,-3-ilmetil, H, Me, metiltioetil o fenetil.

20 5.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 caracterizado porque
R₁ es etilo, R₂ es etilo; y

R₃ es H, benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, 1H-imidazol-4-ilmetil, furan-3-ilmetil, 2-
piridin-2-ilmetil ó feniliminometil.

25 6.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 caracterizado porque
R₃ es hidrógeno, metilo, alilo ó heteroarilmetilo.

7.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 caracterizado porque R_3 es hidrógeno, metilo, alil o heteroarilmetilo, y

R_4 es uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, metoxi, bromo, fluoro, 5- ó 6- fenil, 5- ó 6- piridinil, 5- ó 6-furanil e hidroxil; y R_5 es hidrógeno.

8.- Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R_1 es alcanilo de C_{1-3} ;

R_2 es hidrógeno ó alcanilo de C_{1-3} ;

10 R_3 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, alil, 2-metilalil, propinil, hidroxietil, tioformil, feniliminometil, fenetil y heteroarilo-alcanilo de C_{1-6} , en donde el fenil en cualquier sustituyente que lo contenga, es opcionalmente sustituido con un grupo hidroxil;

15 R_4 es uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alcanil de C_{1-4} , alcanil C_{1-4} -oxi, halógeno, fenilo, furanilo, imisazolil, indazolil, indolil, indolinil, isoindolinil, isoquinolinil, isotiazolil, isoxazolil, oxazolil, pirazinil, pirazolil, piridazinil, piridinil, pirimidinil, pirrolil, quinolinil, tetrazolil, tiazolil, tiofenil e hidroxil;

R_5 es hidrógeno;

20 A es CH_2CH_2 ;

Y es O ó S;

Z es O; y

con la condición de que cuando X es S, R^1 es diferente de $CONMe_2$ ó $CONEt_2$ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo y enantiómeros, diastereómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

9.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 caracterizado porque R3 es hidrógeno, metilo, alilo, o hetreoarilmetil.

10 5 10.- Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 caracterizado porque R3 es hidrógeno, metilo, alilo, o hetreoarilmetil y R4 es uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, metoxi, bromo, fluoro, 5- ó 6-fenil, 5- ó 6-piridinil, 5- ó 6-furanil e hidroxil y R5 es hidrógeno.

10 11. Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste de
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es CH₂O, y Z es O;
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es CH₂O, y Z es O;
15 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 1-benzo[1,3]dioxol-5-ilmetilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es CH₂O, y Z es O;
20 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es fenetilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es CH₂O, y Z es O;
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es alilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es CH₂O, y Z es O;
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;
25 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es alilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;
un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es fenetilo, R₄ es

H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es furan-3-il-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es furan-3-il-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es piridin-2-il-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 2-hidroxifenil-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

15 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 1-carbamimidoilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 1-prop-2-inilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es metilcarbonilamino, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es hidroxietilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es feniliminometilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es tioformilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es alilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metoxietilo, R₄

es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metiltioetilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

5 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metilo, R₄ es H, R₅ es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es piridin-2-il-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 2-hidroxi-etilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 1-*H*-imidazol-4-il-metilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

15 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es benzo[1,3]dioxol-5-ilmetilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es ciclopropilmetilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es metiltiopropilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 2-hidroxi-etilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es H, R₃ es 1-*H*-imidazol-4-il-

- metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 2-metil-but-2-enilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 2-metil-alilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- 5 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 4-hidroxi-3-metoxifenil-metilo, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es alilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- 10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 1,1,1-tricloroetoxicarbonilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es ciclopropilmetilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- 15 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- 20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es fenetilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es fenetilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es fenetilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- 25 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es piridin-2-il-metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es tiofen-2-il-metilo,

R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es metilo, R_3 es H, R_4 es H,

5 R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isobutilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es *n*-propilo, R_2 es *n*-propilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es *n*-propilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es H, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es

15 H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-metilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-metilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-metoxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-fluoro, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-

25 metoxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es 1-*H*-imidazol-5-ilmetilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es *n*-butilo, R_3 es H, R_4 es

H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es 1-*H*-imidazol-4-ilmetilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

5 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 6-hidroxi, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-metoxi, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es H, R₃ es trifluorometilcarbonilo, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es H, R₃ es H, R₄ es H, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-hidroxi, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

15 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-bromo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-fenilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-piridin-4-ilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-furan-3-ilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-benzotiofen-2-ilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-(*N*-*t*-butoxicarbonil)pirrol-2-ilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-piridin-3-ilo, R₅ es H, A es CH₂CH₂, Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R₁ es etilo, R₂ es etilo, R₃ es H, R₄ es 7-

- tiofen-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-(3,5-dimetil)isoxazol-4-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isopropilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- 5 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-pirrol-2-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-bromo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- 10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-fenilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-piridin-4-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-furan-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- 15 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-quinolin-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-tiofen-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- 20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-hidroxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-piridin-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;
- un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-fluoro, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; y enantiómeros, diasterómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.
- 25

12.-Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es seleccionado del grupo que consiste de:

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

5 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; y

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 1-*H*-imidazol-4-il-metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 2-metil-but-2-enilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es 2-metil-alilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es alilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

15 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es fenetilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es piridin-2-il-metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es tiofen-2-il-metilo, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es CH_2O , y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es H, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A no existe, Y es O, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es 1-*H*-imidazol-5-il-metilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-hidroxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es 1-*H*-imidazol-4-ilmetilo, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-metoxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

5 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-piridin-4-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-furan-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-hidroxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isopropilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-bromo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

15 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-metoxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-metilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es S, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es *n*-propilo, R_2 es *n*-propilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-fluoro, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-piridin-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isobutilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es *n*-butilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-quinolin-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

5 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-tiofen-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-fenilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

10 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isopropilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; y enantiómeros, diastereómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

13.- Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1
15 caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste de:

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-hidroxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-metoxi, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

20 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-piridin-4-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-furan-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

25 un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 6-metilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 7-fluoro, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

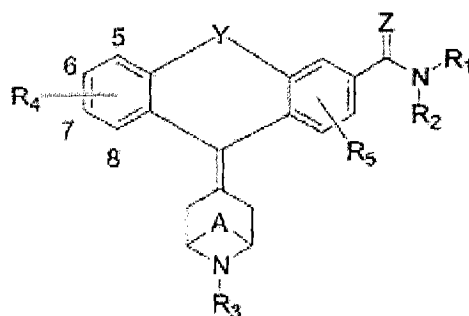
un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es

5-piridín-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es 5-tiofen-3-ilo, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O;

un compuesto de fórmula (I) en donde R_1 es metilo, R_2 es isopropilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; y enantiómeros, diastereómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

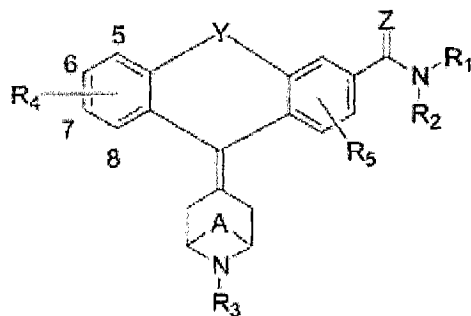
14.- Una composición que comprende el enantiómero dextrorrotatorio de un compuesto de fórmula (I):



Fórmula (I)

en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; en donde dicha composición está sustancialmente libre del isómero levorrotatorio de dicho compuesto.

15.- Una composición que comprende el enantiómero levorrotatorio de un compuesto de fórmula (I):



Fórmula (I)

en donde R_1 es etilo, R_2 es etilo, R_3 es H, R_4 es H, R_5 es H, A es CH_2CH_2 , Y es O, y Z es O; en donde dicha composición está sustancialmente libre del isómero dextrorrotatorio de dicho compuesto.

5 **16.-** Un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

R_1 y R_2 son sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y alcanilo de C_{1-8} ;

10 R_3 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C_{1-8} , halo $_{1-3}$ -alcanilo de C_{1-8} , alquenilo de C_{2-8} , alquinilo de C_{2-8} , cicloalcanilo de C_{3-8} , cicloalcanil-alcanilo de C_{1-8} , alcaniloxi(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , alcaniltio(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , hidroxialcanilo de C_{1-8} , alcaniloxi(C_{1-8})-carbonilo, halo $_{1-3}$ -alcanil(C_{1-8})-carbonilo, formilo, tioformilo, carbamimidoilo, fenilimino-alcanilo de C_{1-8} , fenil-alcanilo de C_{1-8} , fenil-alquenilo de C_{1-8} , fenil-alquinilo de C_{1-8} , naftil-alcanilo de C_{1-8}
15 y heteroaril-alcanilo de C_{1-8} ;

en donde el fenilo, naftilo y heteroarilo están sustituidos opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alcanilo de C_{1-6} , alquenilo de C_{2-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , amino, alcanil(C_{1-6})-amino, di(alcanil(C_{1-6}))-amino, alcanil(C_{1-6})-carbonilo, alcanil(C_{1-6})-carboniloxi,
20 alcanil(C_{1-6})-carbonilamino, alcaniltio de C_{1-6} , alcanilsulfonilo de C_{1-6} , halógeno, hidroxí, ciano, fluoroalcanilo, tioureido y fluoroalcaniloxi; u opcionalmente, cuando el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada; en donde la porción fusionada se selecciona del grupo que
25 consiste de $-(\text{CH}_2)_{3-5}-$ y $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-3}-\text{O}-$;

R_4 es de uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno, alcanilo de C_{1-6} , alquenilo de C_{2-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , amino, alcanil(C_{1-6})-amino, di(alcanil(C_{1-6}))-amino, alcanil(C_{1-6})-carbonilo,

alcanil(C₁₋₆)-carboniloxi, alcaniloxi(C₁₋₆)-carbonilo, alcanil(C₁₋₆)-aminocarbonilo, di(alcanil(C₁₋₆))-aminocarbonilo, alcanil(C₁₋₆)-carbonilamino, alcaniltio de C₁₋₆, alcanilsulfonilo de C₁₋₆, halógeno, hidroxilo, ciano, hidroxycarbonilo, arilo de C₆₋₁₀, cromanilo, cromenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo, isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, naftiridinilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinolizínilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolilo, tiofenilo, fluoroalcanilo y fluoroalcaniloxi; u opcionalmente, cuando R₄ son dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada, en donde la porción fusionada se selecciona del grupo que consiste de -(CH₂)₃₋₅- y -O(CH₂)₁₋₃-O-;

R₅ es uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de: hidrógeno, alcanilo de C₁₋₆, alquenilo de C₂₋₆, alcaniloxi de C₁₋₆, amino, alcanil(C₁₋₆)-amino, di(alcanil(C₁₋₆))amino, alcanil(C₁₋₆)-carbonilo, alcanil(C₁₋₆)-carboniloxi, alcaniloxi(C₁₋₆)-carbonilo, alcanil(C₁₋₆)-aminocarbonilo, alcanil(C₁₋₆)-carbonilamino, alcaniltio de C₁₋₆, alcanilsulfonilo de C₁₋₆, halógeno, hidroxilo, ciano, fluoroalcanilo y fluoroalcaniloxi;

A es -(CH₂)_m-, en donde m es 2 o 3;

Y es -(CH₂)_nX- ó -X(CH₂)_n-; X es O, o S;

n es 0 o 1;

Z es O, u S; y

con la condición de que cuando X es S, R¹ es diferente de CONMe₂ ó CONEt₂ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo y

enantiómeros, diasterómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

17.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 16 o con la

reivindicación 1 en donde R1 y R2 son sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno y alcanilo de C₁₋₄.

18.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R1 y R3 son sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, etilo y propilo.

19.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque R₁ y R₂ son sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno y etilo.

20.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque

R₃ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C₁₋₈, alquenilo de C₂₋₈, alquinilo de C₂₋₈, alcaniloxi(C₁₋₈)-alcanilo de C₁₋₈, alcaniltio(C₁₋₈)-alcanilo de C₁₋₈, hidroxialcanilo de C₁₋₈, tioformilo, fenilimino-alcanilo de C₁₋₈, fenil-alcanilo de C₁₋₈, y heteroaril-alcanilo de C₁₋₈;

en donde el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alcaniloxi de C₁₋₆, e hidroxil; u opcionalmente, cuando el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada; en donde la porción fusionada se selecciona de -O(CH₂)₁₋₃-O-;

21.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R3 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, alilo, 2-metil-alilo, propinilo, hidroxietilo, tioformilo, feniliminometilo, fenetilo, y heteroaril-alcanil de C₁₋₈ en donde el fenilo en cualquier sustituyente de lo contiene está

opcionalmente sustituido con un grupo hidroxilo.

22.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R₃ es hidrógeno, metilo, alilo o hetreoarilmetilo.

5

23.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R₄ es uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C₁₋₆, alcaniloxi de C₁₋₆, alcanil(C₁₋₆)-aminocarbonilo, alcanil(C₁₋₆)-carbonilamino, halógeno, hidroxilo, arilo de C₆₋₁₀, cromanilo, cremenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo, isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, naftiridinilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinolizínilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolilo y tiofenilo.

24.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R₄ es uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C₁₋₄, alcaniloxi de C₁₋₄, halógeno, fenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo, isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinolinilo, tetrazolilo, tiazolilo, tiofenilo e hidroxilo.

10

25.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 16 caracterizado porque R₄ es uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, metoxi, bromo, flúor, 5- o 6-fenilo, 5- o 6-piridinilo, 5- o 6-furanilo, e hidroxilo.

25

26.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 25, caracterizado porque Y es O, o S.

27.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 26,

caracterizado porque R_5 es uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y halógeno.

28.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque R_5 es hidrógeno.

5

29.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque A es $(CH_2)_{0-2}$.

30.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque X es O, o S.

31.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque n es 0.

32.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 ó 16, caracterizado porque Z es O.

33.- Un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque R_1 es alcanilo de C_{1-3} ;

R_2 es alcanilo de C_{1-3} o hidrógeno;

R_3 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C_{1-8} , alquenilo de C_{2-8} , alquinilo de C_{2-8} , alcaniloxi(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , alcaniltio(C_{1-8})-alcanilo de C_{1-8} , hidroxialcanilo de C_{1-8} , tioformilo, fenilimino-alcanilo de C_{1-8} , fenil-alcanilo de C_{1-8} , y heteroaril-alcanilo de C_{1-8} ; en donde el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alcaniloxi de C_{1-6} e hidroxil; u opcionalmente, cuando el fenilo y el heteroarilo están sustituidos opcionalmente con dos sustituyentes unidos a átomos de carbono adyacentes, los dos

sustituyentes forman juntos una sola porción fusionada, en donde la porción se selecciona de $-O(CH_2)_{1-3}O-$

R_4 es uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alcanilo de C_{1-6} , alcaniloxi de C_{1-6} , alcanil(C_{1-6})-aminocarbonilo, alcanil(C_{1-6})-carbonilamino, halógeno, hidroxil, arilo de C_{6-10} , cromanilo, cromenilo, furanilo, imidazolilo, indazolilo, indolilo, indolinilo, isoindolinilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, naftiridinilo, oxazolilo, pirazinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridinilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinolizininilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolilo y tiofenilo;

10 R_5 es uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de hidrógeno y halógeno;

A es CH_2CH_2 ;

Y es O, S, CH_2O , u OCH_2 ;

Z es O; y

15 con la condición de que cuando X es S, R^1 es diferente de $CONMe_2$ ó $CONEt_2$ y en donde heteroarilo significa un radical monovalente heteroaromático con 5 a 10 miembros por anillo y

enantiómeros, diastereómeros, tautómeros, y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

20

34.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 ó 32, caracterizado porque R_1 es etilo; R_2 es etilo ó hidrógeno; y R_3 es benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, carbamimidoil, 1-H-imidazol-4-il metil, feniliminometil, 1-prop-2-inil, tioformil, 2-hidroxifenil-metil, hidroxietil, metoxietil, 2-metil-alil, 2-metil-but-2-enil, alil, furan-3-il metil, H, Me, metiltioetil, fenetil, piridin-2-ilmetil ó tiofen-2-ilmetil.

25

35.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 ó 32, caracterizado porque R_1 es etilo; R_2 es etilo; y R_3 es benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, carbamimidoil,

1-H-imidazol-4-il metil, feniliminometil, 1-prop-2-inil, tioformil, 2-hidroxifenil-metil, hidroxietil, metoxietil, alil, furan-3-ilmetil, H, Me, metiltioetil ó fenetil.

36.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 ó 32, caracterizado porque R1 es etilo; R2 es etilo; y R3 es H, benzo[1,3]dioxol-5-ilmetil, 1-H-imidazol-4-ilmetil, furan-3-ilmetil, piridin-2-ilmetil o feniliminometil.

37.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 ó 32, caracterizado porque R3 es hidrógeno, metilo, alilo o heteroarilmetilo.

10

38.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 ó 32 caracterizado porque R3 es hidrógeno, metil, alilo o heteroarilmetilo, y R4 es uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, metoxi, bromo, flúor, 5- ó 6-fenilo, 5- ó 6-piridinilo, 5- ó 6-furanil e hidroxil y R5 es hidrógeno.

15

39.- Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto, una sal o un solvato de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 38 mezclado con un portador, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptable.

20

40.- Una composición veterinaria caracterizada porque comprende un compuesto, una sal o un solvato de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 38 mezclado con un portador, excipiente o diluyente veterinariamente aceptable.

25