

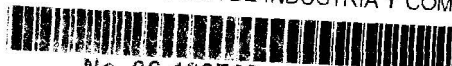
303

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C

Tel. 6069700 Fax 6069701

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-128789-00004-0000

Recibido: 2007-09-19 17:25:05 Dep. 2020 NUECREACIONES
VIA 11 PATENTE/INFORMACION ENE: 375 FASENACIONAL
40 320 OTDINFORMACION Folios: 29

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: P1.-**INCYTE CORPORATION**-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para **"COMPUESTOS DE AMIDO Y SU USO COMO FARMACÉUTICOS"**.-Clase **A61K 31/495**.- Expediente número **06-128.789**.-

1. Me refiero a mi memorial radicado ante ese Despacho el 02 de Abril de 2007.

2. Debidamente autorizado por mí representado, y siguiendo los lineamientos de la respuesta emitida por ese Despacho al Derecho de Petición cuyo numero de radicación es 07-089.021, me permito allegar el capitulo reivindicatorio que **deberá ser tenido en cuenta para el trámite de la presente solicitud en Fase Nacional**, y en el cual constan las modificaciones voluntarias que el solicitante realizó al capitulo reivindicatorio presentado en fase internacional, junto con el pago de la tasa correspondiente.

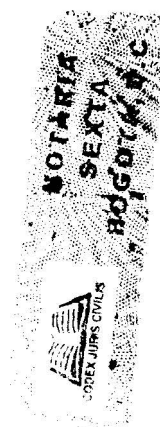
En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de manera alguna el alcance de la presente invención.

3. Anexos me permito presentar:

(a) Recibo No. 07-74,039, que acredita el pago de la tasa de modificación;

(b) Formulario único de modificaciones y correcciones; y

(c) Copia de capitulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado en fase internacional.



JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

ACTA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
 DEL DR. GARCIA
 18 SEP 2007
 AL SEÑOR MANUEL GONZALEZ MEDINA
 OFICINARIO DEL CIRCULO DE BOGOTA

Ricardo: Alicia Moreda

cc # 39 690 713 Usagen
TP # 53215

1/P7 65215

ALICIA LLORED A RICAURTE

NOTARIA
SEXTA
BOGOTÁ D. C.



BOGOTÁ D. C.
NOTARIA SEXTA

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

1

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE

Nombre: **INCYTE CORPORATION**

Dirección: Experimental Station, Route 141 & Henry Clay Road, Building E 336 Wilmington, DE 19880, Estados Unidos de América.

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Wilmington, Estado de Delaware, Estados Unidos de América.

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

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

Teléfono: 3 264270

Fax: 6 069701

E-mail: jllcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____ TP 53.215

4

Número de expediente:

06-128.789

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Modificaciones voluntarias que el Solicitante realizó al Capítulo reivindicatono presentado en fase internacional.

6

Comprobante de pago No. 07-74.039

Fecha 13 de Septiembre de 2007

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.

306

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 06-128789-00004-0000

Fecha: 2007-08-19 17:25:05 Dep: 2020 NUECREACION
Tr: 01 PA ENTE VII C: 178 FASENACIONALI
Act: 325 CTOALFORMACION P: 08/08/07

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 74,039
HA : SEPTIEMBRE 13 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999528	13/09/2007	3,960,000.00

***** CONCEPTO *****

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

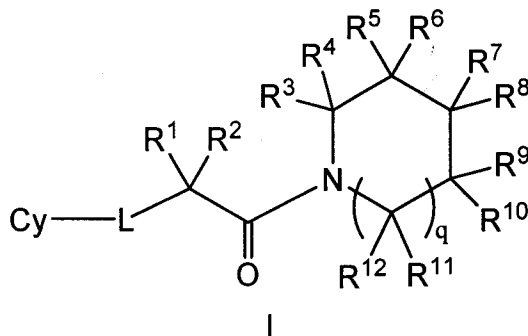
DIEZ Y NUEVE MIL PESOS

APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

307

Reivindicaciones:

1. Un compuesto de Formula I:



o sal farmacéuticamente aceptable o profármaco del mismo, en donde:

Cy es arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterocicloalquilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 $-W-X-Y-Z$;

L está ausente, es $(CR^{13}R^{14})_m$, $(CR^{13}R^{14})_nO(CR^{13}R^{14})_p$, $(CR^{13}R^{14})_nS(CR^{13}R^{14})_p$, $(CR^{13}R^{14})_nSO_2(CR^{13}R^{14})_p$, $(CR^{13}R^{14})_nSO(CR^{13}R^{14})_p$, $(CR^{13}R^{14})_nCO(CR^{13}R^{14})_p$, o $(CR^{13}R^{14})_nNR^{15}(CR^{13}R^{14})_p$;

R^1 y R^2 son cada uno, independientemente, alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido por halo, $C(O)OR^a$ o $C(O)NR^cR^d$;

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , and R^{12} son cada uno, independientemente, H o $-W'-X'-Y'-Z'$;

o R^3 y R^4 junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

208
300

o R^5 y R^6 junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^7 y R^8 junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^9 y R^{10} junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^{11} y R^{12} junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^3 y R^{12} juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^3 y R^{10} juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^3 y R^8 juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^5 y R^{12} juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

o R^5 y R^{10} juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

309

o R^7 y R^{12} juntos forman un puente de alquileo C_{1-4} opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$;

R^{13} y R^{14} son cada uno, independientemente, H, halo, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO_2 , $OR^{a'}$, $SR^{a'}$, $C(O)R^{b'}$, $C(O)NR^{c'}R^{d'}$, $C(O)OR^{a'}$, $OC(O)R^{b'}$, $OC(O)NR^{c'}R^{d'}$, $NR^{c'}R^{d'}$, $NR^{c'}C(O)R^{d'}$, $NR^{c'}C(O)OR^{a'}$, $S(O)R^{b'}$, $S(O)NR^{c'}R^{d'}$, $S(O)_2R^{b'}$, o $S(O)_2NR^{c'}R^{d'}$;

R^{15} es H, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, OH, $C(O)R^{b'}$, $C(O)NR^{c'}R^{d'}$, $C(O)OR^{a'}$, $S(O)R^{b'}$, $S(O)NR^{c'}R^{d'}$, $S(O)_2R^{b'}$, o $S(O)_2NR^{c'}R^{d'}$;

W, W' y W'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-6} , alquilenilenilo C_{2-6} , alquilenileno C_{2-6} , O, S, NR^e , CO, COO, $CONR^e$, SO, SO_2 , $SONR^e$, o NR^eCONR^f , en donde dicho alquilenilo C_{1-6} , alquilenilenilo C_{2-6} , alquilenileno C_{2-6} están cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

X, X' y X'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-8} , alquilenilenilo C_{2-8} , alquilenileno C_{2-8} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, cicloalquilalquilo, heteroarilalquilo, heterocicloalquilalquilo, arilalquilenilo, cicloalquiloalquilenilo, heteroarilalquilenilo, heterocicloalquiloalquilenilo, arilalquilenilo, cicloalquilalquilenilo, heteroarilalquilenilo, heterocicloalquilalquilenilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por uno o más halo, CN, NO_2 , OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

Y, Y' y Y'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-6} , alquilenilenilo C_{2-6} , alquilenileno C_{2-6} , O, S, NR^e , CO, COO, $CONR^e$, SO, SO_2 , $SONR^e$, o NR^eCONR^f , en donde dicho alquilenilo C_{1-6} , alquilenilenilo C_{2-6} ,

310

6, alquinilenilo C_{2-6} está cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

Z, Z' y Z'' son cada uno, independientemente, H, halo, CN, NO_2 , OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} , alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo, en donde dicho alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , haloalquilo C_{1-4} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO_2 , OR^a , SR^a , $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d , $NR^cC(O)R^d$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(=NCN)NR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, o $S(O)_2NR^cR^d$;

en donde dos -W-X-Y-Z junto con el átomo al cual ambos están unidos opcionalmente forman un grupo cicloalquilo de 3-20 miembros o grupo heterocicloalquilo de 3-20 miembros opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 -W''-X''-Y''-Z'';

en donde dos -W'-X'-Y'-Z' junto con el átomo al cual ambos están unidos opcionalmente forman un grupo cicloalquilo de 3-20 miembros o grupo heterocicloalquilo de 3-20 miembros opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 -W''-X''-Y''-Z'';

en donde -W-X-Y-Z es diferente de H;

en donde -W'-X'-Y'-Z' es diferente de H;

en donde -W''-X''-Y''-Z'' es diferente de H;

R^a y R^a' son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo;

311

R^b y $R^{b'}$ son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo;

R^c y R^d son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o R^c y R^d junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

$R^{c'}$ y $R^{d'}$ son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o $R^{c'}$ y $R^{d'}$ junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

R^e y R^f son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o R^e y R^f junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

m es 1, 2, 3 o 4;

n es 0, 1, 2 o 3;

p es 0, 1, 2 o 3; y

q es 0, 1, o 2;

con las condiciones:

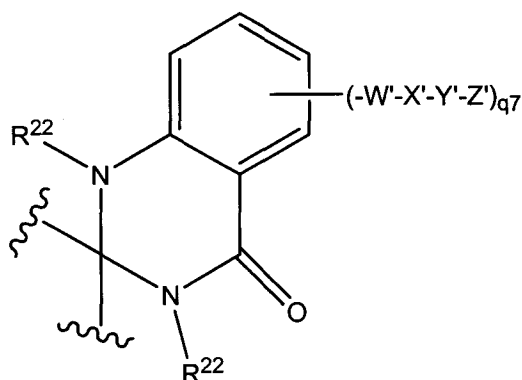
312

(a) R^3 y R^4 son ambos diferentes de H, o R^5 y R^6 son ambos diferentes de H, o R^7 y R^8 son ambos diferentes de H, o R^9 y R^{10} son ambos diferentes de H;

(b) cuando q es 1 y uno de R^7 y R^8 es fenilo, entonces el otro de R^7 y R^8 es alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo, o cicloalquilo;

(c) cuando q es 1 y uno de R^7 y R^8 es OH, entonces el otro de R^7 y R^8 es diferente de 3-(trifluorometil)-fenilo; y

(d) cuando q es 1, entonces R^7 y R^8 junto con el carbono al cual están unidos forman una mitad diferente a la que tiene la estructura:



en donde cada R^{22} es independientemente, H o $-W'-X'-Y'-Z'$, y en donde $q7$ es 0, 1, 2 o 3.

2. El compuesto de la reivindicación 1 en donde Cy es arilo opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 $-W-X-Y-Z$.

3. El compuesto de la reivindicación 1 en donde Cy es fenilo opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 $-W-X-Y-Z$.

313
313

4. El compuesto de la reivindicación 1 en donde Cy es fenilo opcionalmente sustituido por 1 o 2 halo, CN, cianoalquilo, o piridilo.
5. El compuesto de la reivindicación 1 en donde Cy está sustituido.
6. El compuesto de la reivindicación 1 en donde L está ausente.
7. El compuesto de la reivindicación 1 en donde L es $(CR^6R^7)_nO(CR^6R^7)_p$ o $(CR^6R^7)_nS(CR^6R^7)_p$.
8. El compuesto de la reivindicación 1 en donde L es S.
9. El compuesto de la reivindicación 1 en donde L es O.
10. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R^1 y R^2 son ambos metilo.
11. El compuesto de la reivindicación 1 en donde -W-X-Y-Z es halo, ciano, cianoalquilo C_{1-4} , nitro, alquilo C_{1-8} , alquenilo C_{1-8} , haloalquilo C_{1-8} , alcoxi C_{10-} , haloalcoxi C_{1-4} , OH, alcoxialquilo C_{1-8} , amino, alquilamino C_{1-4} , dialquilamino C_{2-8} , $OC(O)NR^cR^d$, $NR^cC(O)R^d$, $NR^cC(=NCN)NR^d$, $NR^cC(O)OR^a$, ariloxi, heteroariloxi, arilalquilo, heteroarilalquilo, heteroariloxialquilo, ariloxialquilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, heteroarilalquilo, heteroarilalquenilo, heteroarilalquinilo, cicloalquilalquilo, o heterocicloalquilalquilo;

en donde cada uno de dicho alquilo C_{1-8} , alquenilo C_{1-8} , haloalquilo C_{1-8} , alcoxi C_{1-8} , ariloxi, heteroariloxi, arilalquilo, heteroarilalquilo, heteroariloxialquilo, ariloxialquilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, heteroarilalquilo,

heteroarilalquenilo, heteroarilalquinilo, cicloalquilalquilo, o heterocicloalquilalquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2, o 3 halo, ciano, nitro, hidroxil-(alquilo C₁₋₆), aminoalquilo, dialquilaminoalquilo, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, OH, alcoxialquilo C₁₋₈, amino, alquilamino C₁₋₄, dialquilamino C₂₋₈, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, NR^cC(O)R^d, NR^cS(O)₂R^d, (C₁₋₄ alquil)sulfonilo, arilsulfonilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterocicloalquilo.

12. El compuesto de la reivindicación 1 en donde -W-X-Y-Z es halo, ciano, cianoalquilo C₁₋₄, nitro, nitroalquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, OH, alcoxialquilo C₁₋₈, amino, alquilamino C₁₋₄, dialquilamino C₂₋₈, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilalquilo, o heterocicloalquilalquilo.

13. El compuesto de la reivindicación 1 en donde -W-X-Y-Z es halo, ciano, cianoalquilo o piridilo.

14. El compuesto de la reivindicación 1 en donde -W'-X'-Y'-Z' es halo, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, OH, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, hidroxialquilo, alcoxialquilo, arilo, heteroarilo, arilo sustituido por halo, heteroarilo sustituido por halo.

15. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R³ y R⁴ junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 -W''-X''-Y''-Z''.

16. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R⁵ y R⁶ junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20

315
315

miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$.

17. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R^7 y R^8 junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$.

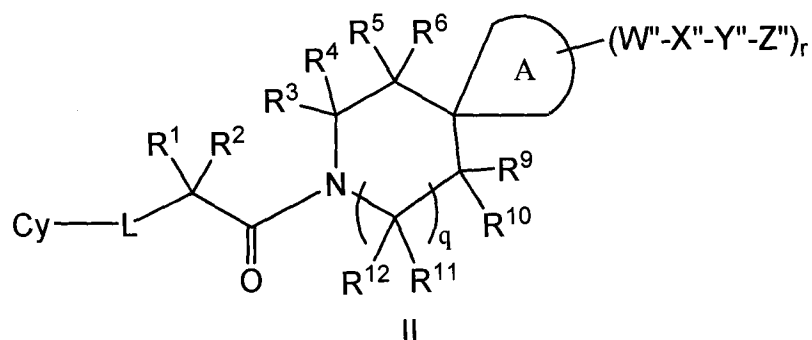
18. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R^9 y R^{10} junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$.

19. El compuesto de la reivindicación 1 en donde R^{11} y R^{12} junto con el átomo de C al cual están unidos forman un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros opcionalmente sustituido por 1 o 2 $-W''-X''-Y''-Z''$.

20. El compuesto de la reivindicación 1 en donde q es 1.

21. El compuesto de la reivindicación 1 en donde q es 0.

22. Un compuesto de la reivindicación 1 que tiene la Formula II:

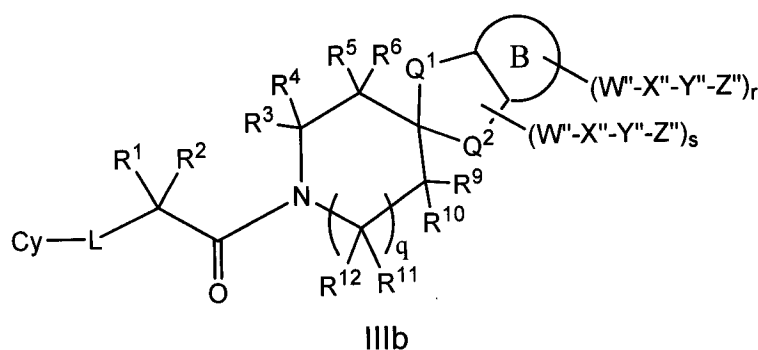
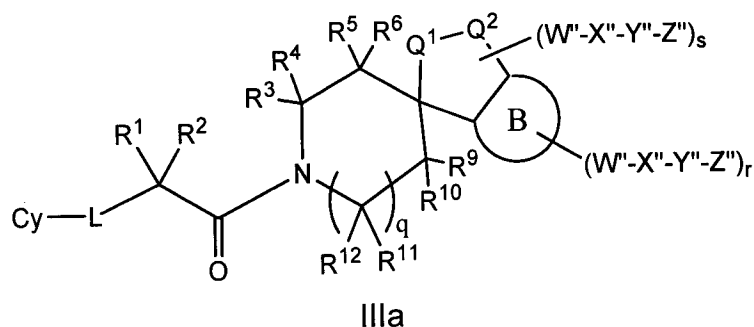


en donde:

el anillo A es un grupo cicloalquilo de 4-20 miembros o un grupo heterocicloalquilo de 4-20 miembros; y

r es 0, 1 o 2.

23. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la Formula IIIa o IIIb:



en donde:

el anillo B es un grupo arilo fusionado de 5 o 6 miembros o heteroarilo fusionado de 5 o 6 miembros;

Q¹ es O, S, NH, CH₂, CO, CS, SO, SO₂, OCH₂, SCH₂, NHCH₂, CH₂CH₂, COCH₂, CONH, COO, SOCH₂, SONH, SO₂CH₂, o SO₂NH;

Q² es O, S, NH, CH₂, CO, CS, SO, SO₂, OCH₂, SCH₂, NHCH₂, CH₂CH₂, COCH₂, CONH, COO, SOCH₂, SONH, SO₂CH₂, o SO₂NH;

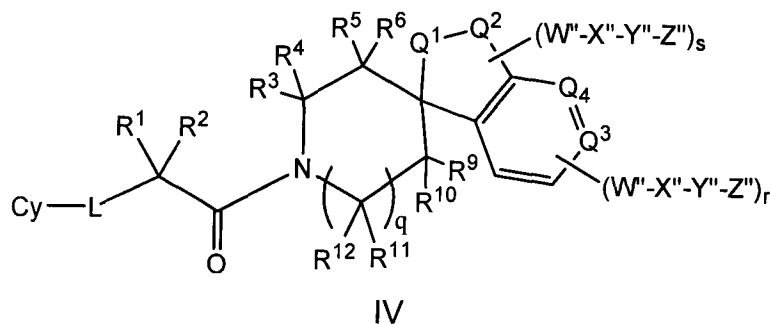
r es 0, 1 o 2;

~~317~~
317

s es 0, 1 o 2; y

la suma de r y s es 0, 1 o 2.

24. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la Formula IV:



en donde:

Q^1 es O, S, NH, CH_2 , CO, CS, SO, SO_2 , OCH_2 , SCH_2 , $NHCH_2$, CH_2CH_2 , $COCH_2$, CONH, COO, $SOCH_2$, SONH, SO_2CH_2 , o SO_2NH ;

Q^2 es O, S, NH, CH_2 , CO, CS, SO, SO_2 , OCH_2 , SCH_2 , $NHCH_2$, CH_2CH_2 , $COCH_2$, CONH, COO, $SOCH_2$, SONH, SO_2CH_2 , o SO_2NH ;

Q^3 y Q^4 son cada uno, independientemente, CH o N;

r es 0, 1 o 2;

s es 0, 1 o 2; y

la suma de r y s es 0, 1 o 2.

25. El compuesto de la reivindicación 24 en donde Q^1 es O, NH, CH_2 o CO, en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

26. El compuesto de la reivindicación 24 en donde Q^2 es O, S, NH, CH_2 , CO, o SO_2 , en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

318
318

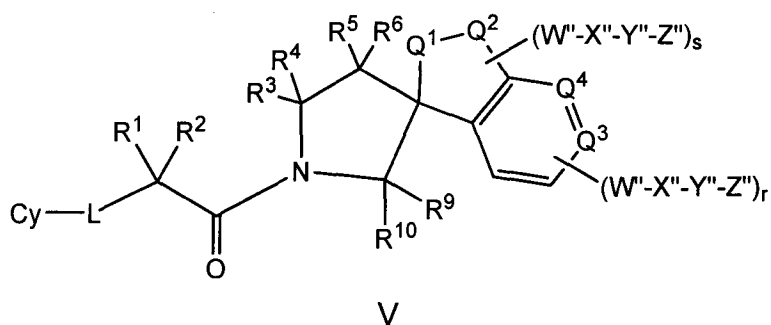
27. El compuesto de la reivindicación 24 en donde uno de Q^1 y Q^2 es CO y el otro es O, NH, o CH_2 , en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

28. El compuesto de la reivindicación 24 en donde uno de Q^1 y Q^2 es CH_2 y el otro es O, S, NH, o CH_2 , en donde cada uno de NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

29. El compuesto de la reivindicación 24 en donde uno de Q^1 y Q^2 es O y el otro es CO o CONH, en donde dicho CONH está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

30. El compuesto de la reivindicación 24 en donde Q^3 es CH opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

31. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la Formula V:



en donde:

Q^1 es O, S, NH, CH_2 , CO, CS, SO, SO_2 , OCH_2 , SCH_2 , $NHCH_2$, CH_2CH_2 , $COCH_2$, CONH, COO, $SOCH_2$, SONH, SO_2CH_2 , o SO_2NH ;

Q^2 es O, S, NH, CH_2 , CO, CS, SO, SO_2 , OCH_2 , SCH_2 , $NHCH_2$, CH_2CH_2 , $COCH_2$, CONH, COO, $SOCH_2$, SONH, SO_2CH_2 , o SO_2NH ;

~~319~~
319

Q^3 y Q^4 son cada uno, independientemente, CH o N;
r es 0, 1 o 2;
s es 0, 1 o 2; y
la suma de r y s es 0, 1 o 2.

32. El compuesto de la reivindicación 31 en donde Q^1 es O, NH, CH_2 o CO, en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

33. El compuesto de la reivindicación 31 en donde Q^2 es O, S, NH, CH_2 , CO, o SO_2 , en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

34. El compuesto de la reivindicación 31 en donde uno de Q^1 y Q^2 es CO y el otro es O, NH, o CH_2 , en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

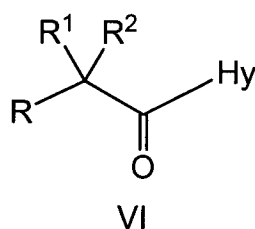
35. El compuesto de la reivindicación 31 en donde uno de Q^1 y Q^2 es CH_2 y el otro es O, S, NH, o CH_2 , en donde cada uno de dicho NH y CH_2 está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

36. El compuesto de la reivindicación 31 en donde uno de Q^1 y Q^2 es O y el otro es CO o CONH, en donde dicho CONH está opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

37. El compuesto de la reivindicación 31 en donde Q^3 es CH opcionalmente sustituido por $-W''-X''-Y''-Z''$.

38. Un compuesto de Formula VI:

320
38



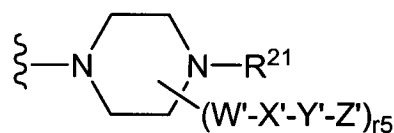
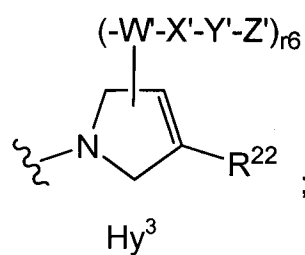
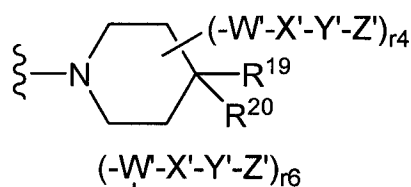
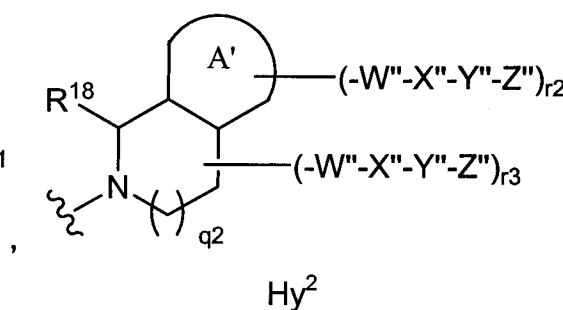
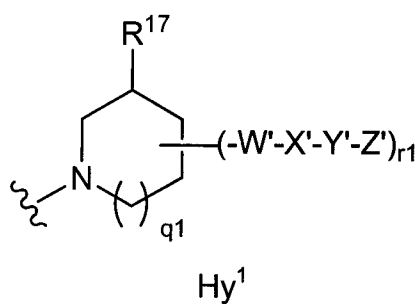
o sal farmacéuticamente aceptable o profármaco del mismo, en donde:

R es fenilo, Cy-S-, Cy-(CR¹³R¹⁴)_m-S- o Cy¹-(CR¹³R¹⁴)_m-, en donde dicho fenilo está opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 -W-X-Y-Z;

Cy es arilo, heteroarilo, cicloalquilo, o heterocicloalquilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 -W-X-Y-Z;

Cy¹ es arilo o cicloalquilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 -W-X-Y-Z;

Hy es:



o

321
327

R^1 y R^2 son cada uno, independientemente, alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido por halo, $C(O)OR^a$ o $C(O)NR^cR^d$;

R^{13} y R^{14} son cada uno, independientemente, H, halo, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO_2 , OR^a , SR^a , $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d , $NR^cC(O)R^d$, $NR^cC(O)OR^a$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, o $S(O)_2NR^cR^d$;

R^{17} es arilo, heteroarilo, arilalquilo o heteroarilalquilo, cada uno opcionalmente sustituido por uno o más $-W''-X''-Y''-Z''$;

R^{18} es H o $-W'-X'-Y'-Z'$;

R^{19} es arilo o heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por uno o más $-W'''-X'''-Y'''-Z'''$;

R^{20} es H o $-W'-X'-Y'-Z'$;

R^{21} es H o $-W-X-Y-Z$;

R^{22} es arilo, heteroarilo, arilalquilo o heteroarilalquilo, cada uno opcionalmente sustituido por uno o más $-W'''-X'''-Y'''-Z'''$;

el anillo A' es un grupo arillo fusionado de 5 o 6 miembros o heteroarilo fusionado de 5 o 6 miembros, un grupo cicloalquilo de 3-14 miembros o un grupo heterocicloalquilo fusionado de 3-14 miembros;

W , W' y W'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-6} , alquilenileno C_{2-6} , alquilenileno C_{2-6} , O, S, NR^e , CO, COO, $CONR^e$, SO, SO_2 , $SONR^e$, o NR^eCONR^f , en donde cicho alquilenilo C_{1-6} , alquilenileno C_{2-6} .

322

$_6$, alquinilenilo C_{2-6} está cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

X, X' y X'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-8} , alquenilenilo C_{2-8} , alquinilenilo C_{2-8} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, arilalquilo, cicloalquilalquilo, heteroarilalquilo, heterocicloalquilalquilo, arilalquenilo, cicloalquiloalkenilo, heteroarilalquenilo, heterocicloalquilalquenilo, arilalquinilo, cicloalquilalquinilo, heteroarilalquinilo, heterocicloalquilalquinilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por uno o más halo, CN, NO_2 , OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

Y, Y' y Y'' son cada uno, independientemente, ausente, alquilenilo C_{1-6} , alquenilenilo C_{2-6} , alquinilenilo C_{2-6} , O, S, NR^e , CO, COO, $CONR^e$, SO, SO_2 , $SONR^e$, o NR^eCONR^f , en donde dicho alquilenilo C_{1-6} , alquenilenilo C_{2-6} , alquinilenilo C_{2-6} está cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} ;

Z, Z' y Z'' son cada uno, independientemente, H, halo, CN, NO_2 , OH, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , amino, alquilamino C_{1-4} o dialquilamino C_{2-8} , alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo, en donde dicho alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 halo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquilo C_{1-4} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, CN, NO_2 , OR^a , SR^a , $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d , $NR^cC(O)R^d$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(=NCN)NR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, o $S(O)_2NR^cR^d$;

en donde dos $-W'-X'-Y'-Z'$ junto con el átomo al cual ambos están unidos opcionalmente forman un grupo cicloalquilo de 3-20 miembros o

323

grupo heterocicloalquilo de 3-20 miembros opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 $-W''-X''-Y''-Z''$;

en donde $-W-X-Y-Z$ es diferente de H;

en donde $-W'-X'-Y'-Z'$ es diferente de H;

en donde $-W''-X''-Y''-Z''$ es diferente de H;

R^a y $R^{a'}$ son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo;

R^b y $R^{b'}$ son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, heteroarilo o heterocicloalquilo;

R^c y R^d son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o R^c y R^d junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

$R^{c'}$ y $R^{d'}$ son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o $R^{c'}$ y $R^{d'}$ junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

324

R^e y R^f son cada uno, independientemente, H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo, cicloalquilo, arilalquilo, o cicloalquilalquilo;

o R^e y R^f junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo heterocicloalquilo de 4, 5, 6 o 7 miembros;

m es 1, 2, 3 o 4;

r_1 , r_2 , r_3 , r_4 y r_6 son cada uno, independientemente, 0, 1, 2 o 3;

r_5 es 1, 2, 3 o 4; y

q_1 y q_2 son cada uno, independientemente, 0, 1, o 2;

con las condiciones:

(a) cuando el anillo A' es fenilo, R^{18} es diferente de $COOR^a$ o $C(O)NR^cR^d$;

(b) cuando R^{19} es fenilo, R^{20} es H, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , arilo, o cicloalquilo; y

(c) cuando R^{20} es OH, R^{19} es diferente de 3-(trifluorometil)-fenilo.

39. Un compuesto seleccionado de:

{{(1S)-2-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-1-il}metanol;

2-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina;

6-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4,5,6,7-tetrahidrotien[2,3-c]piridina;

3-fenil-1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]piperidina;

1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-1,3-dihidroespiro[inden-2,4'-piperidina];

2-metil-1-fenil-4-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]piperazina;

2-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-2,3,3a,4,5,9b-hexahidro-1H-benzo[e]isoindol;

~~225~~
325

3-(3-cluorofenil)-1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidina;
 1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-
 pirrolidin]-3-ona;
 ((1S)-2-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-1-
 il)metanol;
 2-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina;
 6-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-4,5,6,7-tetrahidrotien[2,3-c]piridina;
 3-fenil-1-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]piperidina;
 1'-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-1,3-dihidroespiro[inden-2,4'-piperidina];
 2-metil-1-fenil-4-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]piperazina;
 2-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-2,3,3a,4,5,9b-hexahidro-1H-
 benzo[e]isoindol;
 3-(3-fluorofenil)-1-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]pirrolidina;
 1'-[2-metil-2-(feniltio)propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-
 3-ona;
 ((1S)-2-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-1,2,3,4-
 tetrahidroisoquinolin-1-il)metanol;
 2-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-1,2,3,4-
 tetrahidroisoquinolina;
 6-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-4,5,6,7-tetrahidrotien[2,3-
 c]piridina;
 3-fenil-1-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}piperidina;
 1'-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-1,3-dihidroespiro[inden-2,4'-
 piperidina];
 2-metil-1-fenil-4-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}piperazina;
 2-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-2,3,3a,4,5,9b-hexahidro-1H-
 benzo[e]isoindol;
 3-(3-fluorofenil)-1-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}pirrolidina;
 1'-{2-[(2-clorobencil)tio]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-
 pirrolidin]-3-ona;

325
326

4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]benzonitrilo;

1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

{4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]fenil}acetonitrilo;

{4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]fenil}acetonitrilo;

1'-[2-metil-2-(4-piridin-2-ilfenoxi)propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-{2-[(4'-fluorobifenil-4-il)oxi]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-{2-[(4'-fluorobifenil-4-il)oxi]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidina];

(1R)-1'-[2-(4-clorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(2,4-diclorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(3,4-diclorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-7H-espiro[furo[3,4-b]piridin-5,3'-pirrolidin]-7-ona;

(4aR,8aS)-2-{2-[(4-clorofenil)tio]-2-metilpropanoil}decahidroisoquinolina;

327
327

1'-{2-[(4-clorofenil)tio]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-{2-[(4-clorofenil)tio]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidina];

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-(2-metoxifenil)piperidina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-(2-trifluorometilfenil)piperidina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-(2-fluorofenil)piperidin-4-ol;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]azepan;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3-fenil-2,5-dihidro-1H-pirrol;

3-{1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidin-3-il}piridina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-metil-4-fenilpiperidina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-(2-metilfenil)piperidina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3-(2-feniletil)pirrolidina;

3-(3-clorofenil)-1-[2-(3-clorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidina;

4-{1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidin-3-il}piridina;

3-(3-clorofenil)-1-[2-(3,4-diclorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidina;

4-{1-[2-(3,4-diclorofenil)-2-metilpropanoil]pirrolidin-3-il}piridina;

1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-fenilpirrolidin-2-il}metanol;

{(2S,4R)-1-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-4-fenilpirrolidin-2-il}metanol;

2-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-1,2,3,3a,4,9b-hexahidrocromen[3,4-c]pirrol;

(1R)-1'-(2-metil-2-piridin-3-ilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

Metilo 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)piperazin-1-carboxilato;

Propil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)piperazin-1-carboxilato;

328
328

Isobutil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)piperazin-1-carboxilato;

Isopropil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)piperazin-1-carboxilato;

Etil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)piperazin-1-carboxilato;

(1R)-1'-(2-metil-2-{4-[4-(metilsulfonil)piperazin-1-il]fenil}propanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-{4-[4-(etilosulfonil)piperazin-1-il]fenil}-2-metilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-{4-[4-(butilsulfonil)piperazin-1-il]fenil}-2-metilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-metil-2-(4-{4-[(trifluorometil)sulfonil]piperazin-1-il}fenil)propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-[4-(4-acetilpiperazin-1-il)fenil]-2-metilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-metil-2-[4-(4-propionilopiperazin-1-il)fenil]propanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-{4-[4-(ciclopropilcarbonil)piperazin-1-il]fenil}-2-metilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-[4-(4-isobutirilpiperazin-1-il)fenil]-2-metilpropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-metil-2-[4-(2-oxopirrolidin-1-il)fenil]propanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[3-(4-clorofenil)-2,2-dimetilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil)-3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-(2-(4-clorofenil)-2-metilpropanoil)-7H-espiro[furo[3,4-b]piridin-5,3'-pirrolidin]-7-ona;

~~329~~
329

ter-butil 3-(4-clorofenil)-4-[3-(3-clorofenil)pirrolidin-1-il]-3-metil-4-oxobutanoato;

ácido 3-(4-clorofenil)-4-[3-(3-clorofenil)pirrolidin-1-il]-3-metil-4-oxobutanóico;

3-(4-clorofenil)-4-[3-(3-clorofenil)pirrolidin-1-il]-N,N,3-trimetil-4-oxobutanamida;

(1R)-1'-(2-metil-2-fenoxipropanoil)-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(4-clorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(3,4-diclorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(2,4-diclorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(4-cloro-3-fluorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-(4-cloro-2-metilfenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

(1R)-1'-[2-metil-2-[4-(trifluorometil)fenoxi]propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-[2-metil-2-(4-piridin-2-ilfenoxi)propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]benzonitrilo;

{4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]fenil}acetonitrilo;

{4-[1,1-dimetil-2-oxo-2-(1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il)etoxi]fenil}acetonitrilo;

1'-{2-[(4'-fluorobifenil-4-il)oxi]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

ter-butil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etoxi}fenil)piperazin-1-carboxilato;

Cloridrato de (1R)-1'-[2-metil-2-(4-piperazin-1-ilfenoxi)propanoil]-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

Metil 4-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etoxi}fenil)piperazin-1-carboxilato;

1'-[2-(4-clorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1'-[2-(4-clorofenoxi)-2-metilpropanoil]-7-fluoro-3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-3-ona;

1-[2-(4-clorofenoxi)-2-metilpropanoil]-3-fenilpiperazina;

1'-{2-[(4'-fluorobifenil-4-il)oxi]-2-metilpropanoil}-3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidina];

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)-N-metilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}fenil)-N,N-dimetilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N,N-dimetilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N-metilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[2-benzofuran-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N,N-dietilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N-metilpiridin-2-carboxamida;

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N,N-dimetilpiridin-2-carboxamida; y

~~331~~
331

5-(4-{1,1-dimetil-2-oxo-2-[(1R)-3-oxo-1'H,3H-espiro[furo[3,4-c]piridin-1,3'-pirrolidin]-1'-il]etil}-3-fluorofenil)-N,N-dietilpiridin-2-carboxamida, o sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

40. Una composición que comprende un compuesto de la reivindicación 1, 38, o 39 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.