



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TITULO _____

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE _____

DOMICILIO _____

74. APODERADO _____

22. BOGOTA, D. C., _____



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
CONVERSIÓN, DIVISIÓN Y FUSIÓN DE SOLICITUDES

1. Identificación del Trámite

☐ Conversión ☒ División ☐ Fusión

- ☒ Patente de Invención
☐ Patente de Modelo de Utilidad
☐ Registro de Diseño Industrial
☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitantePersona Natural ☐Persona Jurídica ☒**TETRAPHASE PHARMACEUTICALS, INC.**

Nombre o denominación / Nombre o razón social

Nombre del representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Domicilio Titular		
Estados Unidos de América	480 Arsenal Street, Suite 110, Watertown, Massachusetts 02472		
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico	

☒ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:**RUBIO CAMACHO HUMBERTO****17'192.062****50.007 C.S.J.**

Apellidos y Nombre

Documento de identificación

Tarjeta profesional

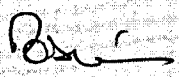
Dirección y domicilio	Ciudad	
Carrera 7 # 74-64 Oficina 506	Bogotá, D.C.	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
mail@rubiolawyers.com	3131647	3132408

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

4. Datos del trámite		
CONVERSION	DIVISION	FUSION
Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____	Expediente <u>11-027711</u> _____ _____ De: _____ A: _____	Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____

5. Comprobante de Pago No.	14-0087062	Fecha:	13/08/2014
	14-0087063		13/08/2014

6. Anexos
☒ Comprobante de pago de la tasa. de presentación y Excedente de Reivindicaciones
☐ Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación
☐ Número de documento que ordena la comisión o fusión o división
☒ Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud
☐ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético

7. Firma		HUMBERTO RUBIO CAMACHO
Firma		Nombre y apellidos
17'192.062		50.007 C.S.J.
C.C		Tarjeta Profesional

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

3



RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0087062

Bogotá D.C., Agosto 13 de 2014 - 11:42:35

RECIBIDO DE : HUMBERTO RUBIO & CIA

NI 8.300.002.283

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	644076532	13/08/2014	2.072.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	2205 DIVISIONAL SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN CONT. DERE	464.000.00	464.000.00
				\$464.000.00

SON: **CUATROCIENTOS SESENTA Y CUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO4



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

DIVISIONAL

COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Agosto 13 de 2014 - 11:42:36

3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 0087063

Bogotá D.C., Agosto 13 de 2014 - 11:42:35

RECIBIDO DE : HUMBERTO RUBIO & CIA

NI 8.300.002.283

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	644076532	13/08/2014	2.072.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
10 50005-01-01	SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	31.000.00	310.000.00
				\$310.000.00

SON: **TRESCIENTOSDIEZ MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO4



No. 14-176831- -00000-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 13

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-027711- -00021-0000

Fecha: 2014-08-13 14:12:32 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 13

EXCEDENTE DE REIVINDICACION

COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7

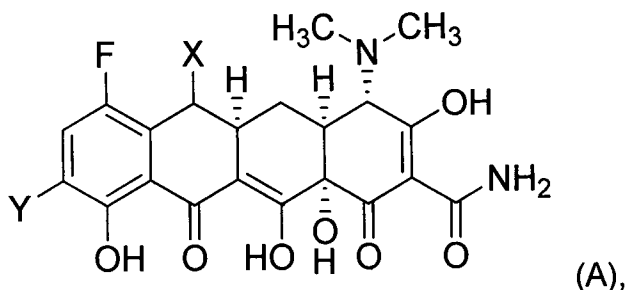
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Agosto 13 de 2014 - 11:42:36

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la Fórmula Estructural (A):



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde:

X se selecciona entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), carbociclilo, arilo y heteroarilo;

Y se selecciona entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), carbociclilo, -alquilen (C_1-C_4)- $N(R^A)(R^B)$, -alquilen (C_1-C_4)- $N(R^F)-C(O)-[C(R^D)(R^E)]_{0-4}-N(R^A)(R^B)$, - $CH=N-OR^A$, - $N(R^A)(R^B)$, - $N(R^F)-C(O)-[C(R^D)(R^E)]_{1-4}-N(R^A)(R^B)$, - $N(R^F)-C(O)-N(R^A)(R^B)$, - $N(R^F)-C(O)$ -alquilo (C_1-C_6), - $N(R^F)-C(O)$ -heterociclilo, - $N(R^F)-C(O)$ -heteroarilo, - $N(R^F)-C(O)$ -carbociclilo, - $N(R^F)-C(O)$ -arilo, - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen (C_1-C_4)- $N(R^A)(R^B)$, - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen (C_1-C_4)-carbociclilo, y - $N(R^F)-S(O)_m$ -alquilen (C_1-C_4)-arilo donde:

al menos uno de X e Y no es hidrógeno;

cada R^A y R^B se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), -O-alquilo (C_1-C_7), -alquilen (C_0-C_6)-carbociclilo, -alquilen (C_0-C_6)-arilo, -alquilen (C_0-C_6)-heterociclilo, -alquilen (C_0-C_6)-heteroarilo, -alquilen (C_1-C_6)-O-carbociclilo, -alquilen (C_1-C_6)-O-arilo, -alquilen (C_1-C_6)-O-heterociclilo, -alquilen (C_1-C_6)-O-heteroarilo, - $S(O)_m$ -alquilo (C_1-C_6), -alquilen (C_0-C_4)- $S(O)_m$ -carbociclilo, -alquilen (C_0-C_4)- $S(O)_m$ -arilo, -alquilen (C_0-C_4)- $S(O)_m$ -heterociclilo y -alquilen (C_0-C_4)- $S(O)_m$ -heteroarilo; o

R^A y R^B tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclilo o heteroarilo, donde el heterociclo o heteroarilo comprende opcionalmente de 1 a 4 heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, S y O;

cada R^D y cada R^E se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_6), carbociclilo, arilo, heterociclilo, heteroarilo, o un resto de cadena lateral de aminoácidos naturales, o

R^D y R^E tomados junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclilo de 3-7 miembros, o un heterociclilo de 4-7 miembros, donde el heterociclilo formado por R^D y R^E comprende opcionalmente de uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente

entre N, S y O;

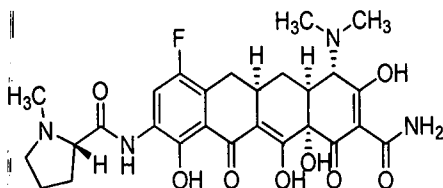
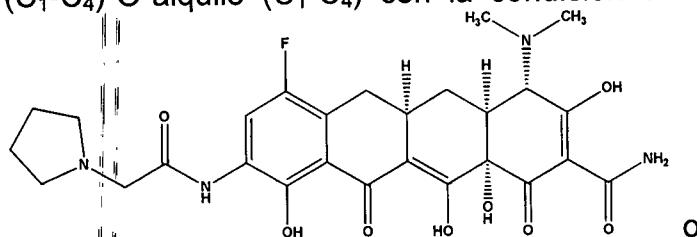
R^F se selecciona entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), carbociclilo, arilo y heteroarilo; y

m es 1 o 2, donde:

5 cada carbociclilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C_1-C_4), $-OH$, $=O$, $-O$ -alquilo (C_1-C_4), $-alquil$ (C_1-C_4)- O -alquilo (C_1-C_4), $-alquilo$ (C_1-C_4) halo-sustituido, $-O$ -alquilo (C_1-C_4) halo-sustituido, $-C(O)$ -alquilo (C_1-C_4), $-C(O)$ -(alquilo (C_1-C_4) fluoro-sustituido), $-S(O)_m$ -alquilo (C_1-C_4), $-N(R^G)(R^G)$, y CN ;

10 cada alquilo del grupo representado por R^A , R^B , R^D y R^E está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C_1-C_4), $-OH$, $-O$ -alquilo (C_1-C_7), $-alquil$ (C_1-C_4)- O -alquilo (C_1-C_4), $-alquilo$ (C_1-C_4) fluoro-sustituido, $-S(O)_m$ -alquilo (C_1-C_4), y $-N(R^G)(R^G)$, donde

15 cada R^G es hidrógeno o alquilo (C_1-C_4), donde cada alquilo del grupo representado por R^G está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo entre $-alquilo$ (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), halo, $-OH$, $-O$ -alquilo (C_1-C_4), y alquil (C_1-C_4)- O -alquilo (C_1-C_4) con la condición de que el compuesto no sea



2. Un compuesto de la reivindicación 1, donde

25 X se selecciona entre hidrógeno, metilo, etilo y fenilo; e Y se selecciona entre hidrógeno, $-(alquilo\ C_1-C_4)$, $-alquilen\ (C_1-C_4)-N(R^A)(R^B)$, $-alquilen\ (C_1-C_4)-NH-C(O)-[CH_2]_{0-1}-N(R^A)(R^B)$, $-N(R^A)(R^B)$, $-NH-C(O)$ -carbociclilo, $-NH-C(O)$ -arilo, $-NH-C(O)$ -heterociclilo, $-NH-C(O)$ -heteroarilo, $-NH-C(O)-N(R^A)(R^A)$, $-N(R^F)-C(O)-CH_2-N(R^A)(R^B)$, $-NH-C(O)-C(R^D)(R^E)-N(R^A)(R^B)$ y $-NH-S(O)_m$ -alquilen (C_1-C_4)- $N(R^A)(R^B)$;

30 cada R^A se selecciona independientemente entre hidrógeno y metilo; R^B se selecciona entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), $-alquilen\ (C_0-C_6)$ -

carbociclilo, -alquilen (C₀-C₆)-arilo, -alquilen (C₀-C₆)-heteroarilo, -S(O)_m-alquilo (C₁-C₆), -alquilen (C₀-C₄)-S(O)_m-carbociclilo, -alquilen (C₀-C₄)-S(O)_m-arilo, -alquilen (C₀-C₄)-S(O)_m-heterociclo y -alquilen (C₀-C₄)-S(O)_m-heteroarilo; o

5 R^A y R^B , cuando están unidos a un átomo de nitrógeno común, se toman junto con el átomo de nitrógeno para formar un heterociclo, donde el heterociclo está opcionalmente sustituido con =O y -N(R^G)(R^G);

$R^{D'}$ y R^E se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un cicloalquilo (C₃-C₇); y

10 m es 1 o 2;

cada carbociclilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C₁-C₄), -alquilo (C₁-C₄) halo-sustituido, -O-alquilo (C₁-C₄), y -N(R^G)(R^G);

15 cada parte alquilo del grupo representado por Y o R^B está opcional e independientemente sustituida con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, -OH, y -N(R^G)(R^G), donde

20 R^G es hidrógeno o alquilo (C₁-C₄), y donde cada alquilo del grupo representado por R^G está opcional e independientemente sustituido con cicloalquilo (C₃-C₆).

3. Un compuesto de la reivindicación 1, donde

X se selecciona entre hidrógeno y metilo; e

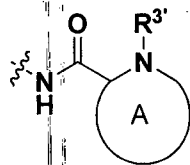
25 Y se selecciona entre -N(R^A)(R^B), -N(H)-C(O)-carbociclilo, -N(H)-C(O)-arilo, -N(H)-C(O)-heterociclo, y -N(H)-C(O)-heteroarilo; donde:

R^A es hidrógeno; y

R^B se selecciona entre alquilo (C₁-C₄), y -S(O)₂-CH₃; o

30 R^A y R^B se toman juntos para formar un anillo heterocíclico de 4-7 miembros; donde cada carbociclilo, arilo, heteroarilo, o heterociclo está opcional e independientemente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre -CH₃, fluoro, y -N(CH₃)₂.

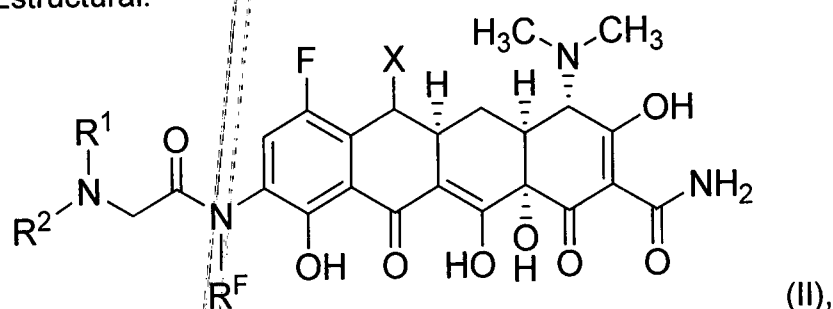
4. Un compuesto de la reivindicación 1, donde



35 Y es , donde el anillo A representa un heterociclilo de 4-7 miembros; y $R^{3'}$ es hidrógeno o alquilo (C₁-C₆).

5. El compuesto de la reivindicación 1, donde el compuesto se representa por

la Fórmula Estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde:

5 cada uno de R^1 y R^2 se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo (C_1-C_7), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_7)-alquilo (C_1-C_4), cicloalcoxi (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), arilo, arilalquilo (C_1-C_4), ariloxialquilo (C_1-C_4), ariltioalquilo (C_1-C_4), arilsufinilalquilo (C_1-C_4), arilsulfonilalquilo (C_1-C_4), y -O-alquilo (C_1-C_7), o

10 R^1 y R^2 tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, O y S; y

15 donde cada resto alquilo, cicloalquilo, alcoxi y cicloalcoxi en los grupos representados por R^1 y R^2 y cada heterociclo representado por NR^1R^2 tomados conjuntamente están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, -OH, alcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquilsulfinilo (C_1-C_4), alquilsulfonilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), y

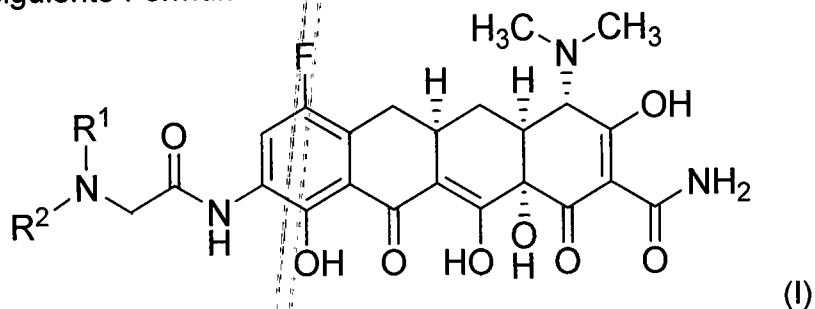
20 - $N(R^3)(R^4)$; y cada resto arilo, ariloxi, ariltio, arilsufinilo y arilsulfonilo en los grupos representados por R^1 y R^2 y cada heteroarilo representado por NR^1R^2 tomados conjuntamente están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que

25 consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, -OH, alcoxi (C_1-C_4), -S-alquilo (C_1-C_4), -S(O)-alquilo (C_1-C_4), -S(O)₂alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), - $N(R^3)(R^4)$, -CN, haloalquilo (C_1-C_4), y haloalcoxi (C_1-C_4), y

30 cada uno de R^3 y R^4 se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en -H y alquilo (C_1-C_4), donde el alquilo (C_1-C_4) representado por R^3 y R^4 está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, -OH, alcoxi (C_1-C_4), y alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4).

35 6. El compuesto de la reivindicación 5, donde el compuesto está representado

por la siguiente Fórmula Estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. donde

5 cada uno de R^1 y R^2 se selecciona independientemente entre hidrógeno, alquilo (C_1 - C_7), cicloalquil (C_3 - C_6)-alquilo (C_1 - C_4), alcoxi (C_1 - C_7)-alquilo (C_1 - C_4), cicloalcoxi (C_3 - C_6)-alquilo (C_1 - C_4), cicloalquilo (C_3 - C_6), arilo, arilalquilo (C_1 - C_4), ariloxialquilo (C_1 - C_4), ariltioalquilo (C_1 - C_4), arilsufinilalquilo (C_1 - C_4), arilsulfonilalquilo (C_1 - C_4); o

10 R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, O y S.

15 7. El compuesto de la reivindicación 6, donde R¹ es hidrógeno o un alquilo (C₁-C₄).

8. El compuesto de las reivindicaciones 6 o 7, donde R² se selecciona entre alquilo (C₁-C₇), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₇)-alquilo (C₁-C₄), fenilo, fenilalquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆) y haloalquilo (C₁-C₄), donde cada resto alquilo, alcoxi y cicloalquilo en los grupos representados por R² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄) y halo; y cada resto fenilo en los grupos representados por R² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄), halo, alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), -CN, haloalquilo (C₁-C₄), y haloalcoxi (C₁-C₄).

9. El compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 6-8, donde R¹ se
30 selecciona entre hidrógeno, metilo y etilo.

10. El compuesto de la reivindicación 9, donde R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, fenilo, bencilo, $-(CH_2)_2-O-CH_3$, $-(CH_2)_3-OCH_3$, $-C(CH_3)_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2C(CH_3)_3$, $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CF_3$, $-(CH_2)_2-CH_2F$, y $-(CH_2)_nCH_3$; n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6; y donde el grupo fenilo o bencilo representado por R^2 está

opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄), halógeno, alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), -CN, haloalquilo (C₁-C₄), y haloalcoxi (C₁-C₄).

5

11. El compuesto de la reivindicación 10, donde R² se selecciona entre ciclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, -(CH₂)₂-O-CH₃, -C(CH₃)₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂-CF₃, -CH₂CH(CH₃)₂, -CH₃ y -CH₂CH₃.

- 10 12. El compuesto de la reivindicación 6, donde R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre N, O y S; y el heterociclo está
- 15 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄), halo, -OH, alcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquilsulfínilo (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), y -N(R³)(R⁴); y el heteroarilo está opcionalmente sustituido
- 20 que consiste en alquilo (C₁-C₄), halo, -OH, alcoxi (C₁-C₄), -S-alquilo (C₁-C₄), -S(O)-alquilo (C₁-C₄), -S(O)₂alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), N(R³)(R⁴), -CN, haloalquilo (C₁-C₄), y haloalcoxi (C₁-C₄).

13. El compuesto de la reivindicación 12, donde R¹ y R² tomados junto con el
- 25 átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo seleccionado entre el grupo que consiste en azetidina, pirrolidina, morfolina, piperidina, octahidrociclopenta[c]pirrol, isoindolina, y azabicyclo[3.1.0]hexano, donde el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C₁-C₄),
- 30 halógeno, -OH, alcoxi (C₁-C₄), -S-alquilo (C₁-C₄), -S(O)-alquilo (C₁-C₄), -S(O)₂alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), y -N(R³)(R⁴).

14. El compuesto de la reivindicación 13, donde el heterociclo está
- 35 opcionalmente sustituido con halógeno, metoxi, hidroxilo, un grupo metoximetilo o dimetilamino.

15. El compuesto de la reivindicación 6, donde:
- a) R¹ es metilo, y R² es ciclopropilo;
- b) R¹ es hidrógeno, y R² es ciclopropilo;
- 40 c) R¹ es hidrógeno, y R² es ciclobutilo;

- 5 d) R¹ es metilo, y R² es ciclobutilo;
 e) R¹ es hidrógeno, y R² es ciclopropilmetilo;
 f) R¹ es hidrógeno, y R² es ciclobutilmetilo;
 g) R¹ es hidrógeno, y R² es bencilo;
 h) R¹ es hidrógeno, y R² es metoxipropilo;
 i) R¹ es hidrógeno, y R² es metoxietilo;
 j) R¹ es hidrógeno, y R² es fenilo;
 k) R¹ es metilo, y R² es t-butilo;
 l) R¹ es hidrógeno, y R² es t-butilo;
 10 m) R¹ es hidrógeno, y R² es metilo;
 n) R¹ es hidrógeno, y R² es etilo;
 o) R¹ es hidrógeno, y R² es propilo;
 p) R¹ es hidrógeno, y R² es butilo;
 q) R¹ es hidrógeno, y R² es pentilo;
 15 r) R¹ es hidrógeno, y R² es hexilo;
 s) R¹ es hidrógeno, y R² es heptilo;
 t) R¹ es metilo, y R² es metilo;
 u) R¹ es hidrógeno, y R² es isopropilo;
 v) R¹ es hidrógeno, y R² es 2,2-dimetilpropilo;
 20 w) R¹ es hidrógeno, y R² es trifluoroetilo;
 x) R¹ es hidrógeno, y R² es 2-metilpropilo;
 y) R¹ es hidrógeno, y R² es 3-fluoropropilo;
 z) R¹ es etilo, y R² es etilo;
 a1) R¹ es metilo, y R² es metilo;
 25 b1) R¹ es hidrógeno, y R² es hidrógeno;
 c1) R¹ es hidrógeno, y R² es ciclopentilo;
 d1) R¹ es metilo, y R² es ciclopentilo; o
 e1) R¹ es metilo, y R² es propilo,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

- 30 16. El compuesto de la reivindicación 6, donde R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un grupo seleccionado entre:
- 35 a) azetidin-1-ilo;
 b) 3-fluoroazetidin-1-ilo;
 c) 3-metilazetidin-1-ilo;
 d) 3-metoxiazetidin-1-ilo;
 f) morfolin-4-ilo;
 g) 3-fluoropirrolidin-1-ilo;
 h) 3-hidroxipirrolidin-1-ilo;
 40 i) 3-N,N-dimetilaminopirrolidin-1-ilo;

- j) 2-metoximetilpirrolidin-1-ilo;
- k) piperidin-1-ilo;
- l) octahidrociclopenta[c]pirrol-2-ilo;
- m) isoindolin-2-ilo; y
- n) 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-ilo,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

17. El compuesto de la reivindicación 6, donde

R^1 es hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4); y

R^2 se selecciona entre alquilo (C_1-C_7), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_7)-alquilo (C_1-C_4), fenilo, fenilalquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6) y haloalquilo (C_1-C_4), donde cada resto alquilo, alcoxi y cicloalquilo en los grupos representados por R^2 está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4) y halo; y cada resto fenilo en los grupos representados por R^2 está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, alcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), -CN, haloalquilo (C_1-C_4), y haloalcoxi (C_1-C_4); o

R^1 y R^2 tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroarilo monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico puenteado o espirobicíclico, donde el heteroarilo o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre N, O y S; y el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, -OH, alcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquilsulfinilo (C_1-C_4), alquilsulfonilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), y -N(R^3)(R^4); y el heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en alquilo (C_1-C_4), halo, -OH, alcoxi (C_1-C_4), -S-alquilo (C_1-C_4), -S(O)-alquilo (C_1-C_4), -S(O)₂alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), N(R^3)(R^4), -CN, haloalquilo (C_1-C_4), y haloalcoxi (C_1-C_4).

18. El compuesto de la reivindicación 5, donde

R^1 es hidrógeno, metilo, etilo, metoxi o terc-butoxi;

R^2 se selecciona entre alquilo (C_1-C_7), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_7)-alquilo (C_1-C_4), fenilo, cicloalquilo (C_3-C_6), y fluoroalquilo (C_1-C_4); o

R^1 y R^2 tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo seleccionado entre pirrolidinilo, morfolinilo, azetidinilo,

piperidinilo, octahidrociclopenta[c]pirrolilo, isoindolinilo, indazolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, y tetrazolilo, donde el anillo formado por R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos está opcionalmente sustituido con fluoro, -OH, -OCH₃, o N(CH₃)₂.

5

19. El compuesto de la reivindicación 6, donde:

R¹ es hidrógeno, metilo, o etilo

R² se selecciona entre metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2,2-dimetilpropilo, t-butilo, isobutilo, n-pentilo, cicloalquilo (C₄-C₆), cicloalquilmetilo (C₃-C₅), metoxietilo, y 2-fluoroetilo; o

10

R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo seleccionado entre azetidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, tetrazolilo, u octahidrociclopenta[c]pirrolilo, y donde el anillo formado por R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos está opcionalmente sustituido con fluoro.

15

20. Una composición farmacéutica que comprende un vehículo o diluyente farmacéuticamente aceptable y un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1-19 o una sal del mismo.