

OLARTE RAISBECK



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-108182- -00001-0000

Fecha: 2008-11-10 16:12:20 Dep: 2020 NUECREACION
Tra: 11 PATENTE IYI Eje: 378 FASE NACIONAL I
Act: 329 C/O INFORMACION Folios: 46

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2008/000172

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: NOVARTIS AG

Dirección: Lichtstrasse 35, CH-4056 Basel

Nacionalidad o Domicilio: Suiza

Lugar de Constitución: Suiza

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A

Calle 100 No. 8A-37 Piso 10. Bogotá

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otr

☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:

08-108.182

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se eliminaron las antiguas
Reivindicaciones 3 a 5, 7, 8 a 11, 15, 16, 19, 20, 22, 26, 32 a 39, 42, 44 a 53, 55, 57, 58, 61 a
69, 71 y 72

6

Comprobante de pago No. 08-88110

Fecha 10 Noviembre de 2008

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa y Capítulo Reivindicatorio Modificado.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-108182- -00001-0000

Fecha: 2008-11-10 16:12:20 Dep: 2020 NUECREACION
Tra: 11 PATENTEIYII Evt: 378 FASENACIONALI
Act: 329 CTOINFORMACION Folios: 46

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 88,110
FECHA : NOVIEMBRE 10 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	81247003	07/11/2008	4,926,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

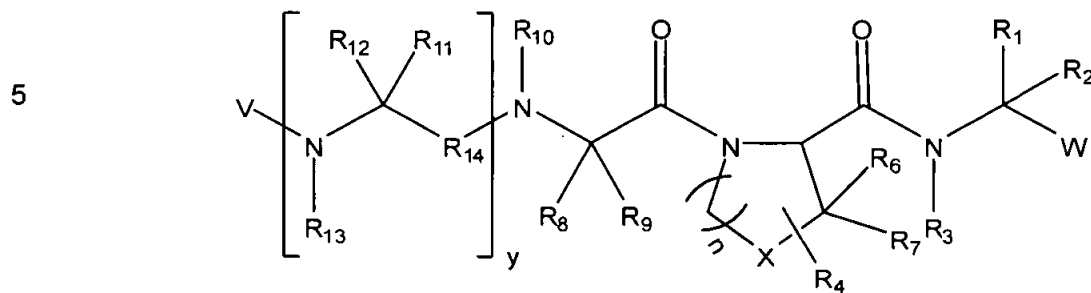
SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de la Fórmula I:



10 y las sales farmacéuticamente aceptables y
estereoisómeros del mismo;
en donde:

y es 0 ó 1;

n y p se seleccionan cada uno independientemente a
partir de 0, 1, ó 2;

15 R₁₄ es C(O) ó SO₂;

R₁, R₂, W, R₁₃, y V se seleccionan cada uno
independientemente a partir de hidrógeno o a partir del grupo que
consiste en alquilo, alquil-arilo, heteroalquilo, heterociclilo,
heteroarilo, aril-heteroarilo, alquil-heteroarilo, cicloalquilo,
20 alquiloalquilo, alquil-ariloalquilo, ariloalquilo, heteroariloalquilo, heterocicliloalquilo,
cicloalquiloalquilo, amino, alquil-amino, aril-amino, alquil-aril-amino,
aril-amino, heteroaril-amino, cicloalquil-amino, carboxi-alquil-amino,
mono- y di-alquil-carboxamida, aril-alquiloalquilo, y heterocicliloalquilo;
cada uno de los cuales puede estar además independientemente
25 sustituido una o más veces por X¹ y X²; en donde X¹ es alquilo,

alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, heterociclilo, heterociclil-alquilo, arilo, alquil-arilo, aralquilo, ariloxilo, tioarilo, aril-heteroarilo, heteroarilo, heterociclil-amino, alquil-heteroarilo, o heteroaralquilo; en donde X^1 puede estar independientemente sustituido con una o más fracciones X^2 , las cuales pueden ser iguales o diferentes, y se seleccionan de una manera independiente; en donde X^2 es hidroxilo, oxo, alquilo, cicloalquilo, espiro-cicloalquilo, heterociclo-alquilo, arilo, heteroarilo, alcoxilo, ariloxilo, tio, tioalquilo, amino, mono- y di-alquil-amino, aril-amino, alquil-sulfonilo, aril-sulfonilo, alquil-sulfonamido, aril-sulfonamido, carboxilo, carbalcoxilo, carboxamido, alcoxi-carbonil-amino, alcoxi-carbonilo, alcoxi-carboniloxilo, alquil-ureido, aril-ureido, halógeno, ciano, o nitro; en donde cada residuo X^2 seleccionado como alquilo, alcoxilo, y arilo puede estar insustituido o de manera opcional independientemente sustituido con una o más fracciones, las cuales pueden ser iguales o diferentes, y se seleccionan independientemente a partir de alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, heterociclilo, heterociclil-alquilo, arilo, alquil-arilo, aralquilo, aril-heteroarilo, heteroarilo, heterociclil-amino, alquil-heteroarilo, y heteroaralquilo;

W también se selecciona a partir del grupo que consiste en $C(O)-C(O)H$, $C(=N-O-R_{24})-C(O)-amina$, $C(O)-C(O)-amina$, $C(O)NR_{24}S(O)_pR_{24}$, $C(O)NR_{24}S(O)_pN(R_{24})_2$ y $C(O)-[C(O)]_a-heterociclo$, en donde el heterociclo puede estar independientemente sustituido una o más veces con arilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,

9

alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por uno o más átomos de halógeno, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, en donde a es 0 ó 1, en donde cada R_{24} se selecciona independientemente a partir de hidrógeno o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo sustituido o insustituido, y heterociclo sustituido o insustituido, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

10 V también se selecciona a partir del grupo que consiste en $-Q^1-Q^2$, en donde Q^1 está ausente, o es $C(O)$, $N(H)$, $N(\text{alquilo de 1 a 4 átomos de carbono})$, $C=N(CN)$, $C=N(SO_2CH_3)$, $C=N-COH$ -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o $C=N-COH$, y Q^2 es hidrógeno, o se selecciona a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, O-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, NH_2 , $N(H)$ -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $N(\text{alquilo de 1 a 4 átomos de carbono})_2$, SO_2 -arilo, SO_2 -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo, heteroarilo, y heterociclo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por uno o más átomos de halógeno, o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

25 o R_1 y R_2 pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o

más heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces;

R_3 se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

X es O, S, N, NR^5 , CR^5 , ó CR^5R^{5a} ;

R_4 representa de 0 a 4 sustituyentes, cada uno de los cuales se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, arilo, heterociclo, y heteroarilo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^5 se selecciona a partir de hidrógeno u oxo, o a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heterociclo-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, cicloalquiloxilo de 3 a 8 átomos de carbono, ariloxilo, y hetero-ariloxilo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{5a} es hidrógeno, o se selecciona a partir del grupo que

consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

o R_4 y R^5 pueden formar juntos un anillo de dimetil-ciclopropilo fusionado, un anillo de ciclopentano fusionado, un anillo de fenilo fusionado, o un anillo de piridilo fusionado, cada uno de los cuales puede estar sustituido con un átomo de halógeno, arilo, trihalometilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

o R^5 y R_6 pueden formar juntos un anillo de dimetil-ciclopropilo fusionado, un anillo de ciclopentano fusionado, un anillo de fenilo fusionado, o un anillo de piridilo fusionado, cada uno de los cuales puede estar sustituido con un átomo de halógeno, arilo, trihalometilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

o R^5 y R^{5a} pueden formar juntos un anillo espirocíclico que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo, y que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo, el cual está opcionalmente sustituido por 0 a 4 sustituyentes seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos

de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-

5 alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-

10 sulfonamida, o dos de estos 0 a 4 sustituyentes, tomados juntos, forman un anillo fusionado o espirocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de ciano,

15 halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8

20 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo

25 de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono,

heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂,
mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y
di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos
de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de
5 carbono-sulfonamida;

R₆ y R₇ se seleccionan cada uno independientemente a
partir del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilo
de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y
mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, y cicloalquilo
10 de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

R₈, R₉, R₁₀, R₁₁ y R₁₂ se seleccionan cada uno
independientemente a partir del grupo que consiste en hidrógeno,
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de
carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

15 o R₆ y R₇ pueden formar juntos un anillo espirocíclico que
tiene entre 3 y 7 átomos del anillo, y que tiene 0, 1, ó 2
heteroátomos del anillo, el cual está opcionalmente sustituido por 0 a
4 sustituyentes seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo,
amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8
20 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de
1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono,
haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8
átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono,
haloalcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos
25 de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de

10

1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-sulfonamida, o dos sustituyentes, tomados juntos, forman un anillo fusionado o espirocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanóilo de 1 a 4 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo, y fenilo;

o R₃ y W pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o más heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces; y

o cuando y es 0, R₁₀ y V pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o más heteroátomos, en donde el anillo puede

estar adicionalmente sustituido una o más veces.

2. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde:

y es 0 ó 1;

n es 0 ó 1;

5 R_{14} es C(O) ó SO₂;

R_1 se selecciona a partir del grupo que consiste en H y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_2 se selecciona a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, C(O)-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, C(O)O-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

o R_1 y R_2 forman juntos un anillo de ciclopropano;

W también se selecciona a partir del grupo que consiste en C(O)-C(O)H, C(=N-O- R_{24})-C(O)-amina, C(O)-C(O)-amina, 15 C(O)NR₂₄S(O)_pR₂₄, C(O)NR₂₄S(O)_pN(R₂₄)₂ y C(O)-[C(O)]_a-heterociclo, en donde el heterociclo puede estar independientemente sustituido una o más veces con arilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por uno o más átomos de halógeno, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, en donde a 20 es 0 ó 1, en donde cada R_{24} se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo sustituido o insustituido, y heterociclo sustituido o insustituido, cada uno de los cuales puede 25 estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo

de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

p es 0, 1, ó 2;

R₃ se selecciona a partir del grupo que consiste en H y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

5 X es O, NR⁵ o CR⁵R^{5a};

R₄ se selecciona a partir del hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, arilo, heterociclo, y heteroarilo, cada uno de los cuales puede estar independientemente
10 sustituido una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R⁵ se selecciona a partir de hidrógeno u oxo, o del grupo que consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de
15 carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heterociclo-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de
20 halógeno, arilo, trihalo-metilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{5a} se selecciona a partir de hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de
25 carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y



heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

o R_4 y R^5 pueden formar juntos un anillo de dimetil-
ciclopropilo fusionado, un anillo de ciclopentano fusionado, un anillo
de fenilo fusionado, o un anillo de piridilo fusionado, cada uno de los
5 cuales puede estar sustituido con un átomo de halógeno, arilo,
trihalo-metilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

o R^5 y R^{5a} pueden formar juntos un anillo espirocíclico
que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo, y que tiene 0, 1, ó 2
heteroátomos del anillo, el cual está opcionalmente sustituido por 0 a
10 4 sustituyentes seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo,
amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8
átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de
1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono,
haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8
15 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono,
haloalcóxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos
de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de
1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanoílo de 1 a 8 átomos de
carbono, alcóxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo
20 de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-
alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4
átomos de carbono, COOH , C(O)NH_2 , mono- y di-alquilo de 1 a 4
átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos
de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO_3H ,
25 SO_2NH_2 , y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-



sulfonamida, o dos sustituyentes, tomados juntos, forman un anillo fusionado o espirocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes
5 independientemente seleccionados a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanóilo de 1 a 4 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo, y fenilo;

R_8 , R_{10} , y R_{11} se seleccionan cada uno independientemente a partir del grupo que consiste en H y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_6 y R_7 se seleccionan cada uno independientemente a
15 partir del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino;

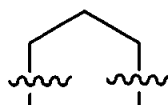
R_{13} es H;

R_9 y R_{12} se seleccionan cada uno independientemente a
20 partir del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; y

V también se selecciona a partir del grupo que consiste en $-Q^1-Q^2$, en donde Q^1 está ausente, o es C(O), N(H), N(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono), C=N(CN), C=N(SO₂CH₃), C=N-COH-alquilo
25 de 1 a 4 átomos de carbono, o C=N-COH, y Q^2 es hidrógeno, o se

selecciona a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, O-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, NH_2 , N(H)-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $\text{N}(\text{alquilo de 1 a 4 átomos de carbono})_2$, SO_2 -arilo, SO_2 -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo, heteroarilo, y heterociclo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por uno o más átomos de halógeno, o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

o R_3 y W pueden formar juntos un anillo de 6 miembros de la fórmula II:



15

II

en donde la fórmula II puede estar adicionalmente sustituida;

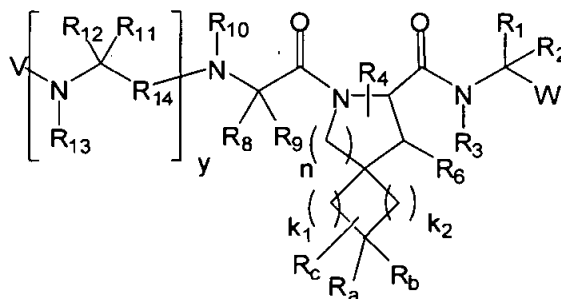
o cuando y es 0, R_{10} y V pueden formar un anillo de ciclopropilo que puede estar adicionalmente sustituido o un grupo amida.

3. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde R_1 y R_2 se seleccionan independientemente a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, cicloalquenilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de

carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y hetero-cicloalquil-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, cada uno de los cuales está insustituido o sustituido con uno o más grupos seleccionados a partir de flúor, cloro, hidroxilo, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono-S, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono-S(O), y alquilo de 1 a 2 átomos de carbono-S(O)₂, y en donde el hetero-cicloalquilo es un anillo de 3 a 6 miembros que tiene uno o dos átomos de N, O, ó S del anillo.

4. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde X es CR⁵R^{5a}, R^{5a} es hidrógeno, y R⁵ se selecciona a partir del grupo que consiste en piperidina, fenilo, piridinilo, piridiniloxilo, y piridinil-metilo, en donde los grupos fenilo y piridinilo pueden estar independientemente sustituidos una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

5. Un compuesto de la Reivindicación 1, de acuerdo con la fórmula:



en donde:

k₁ y k₂ son 0 ó 1, de tal manera que la suma de k₁ y k₂ es igual a 1 ó 2;

R_a es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o fenilo;

R_b es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, alcanoílo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo, o fenilo;

o R_a y R_b , tomados juntos, forman un anillo espirocíclico de 3 a 6 miembros que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanoílo de 1 a 4 átomos de carbono, y fenilo;

R_c representa de 0 a 4 sustituyentes, los cuales se seleccionan independientemente en cada presentación de R_c , a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y fenilo, o dos sustituyentes R_c *geminales*, tomados en combinación, forman un anillo espirocíclico de 3 a 6 miembros;

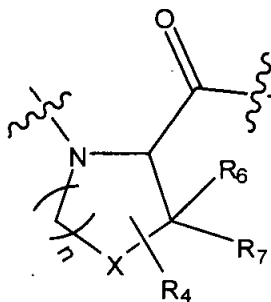
R_4 representa 0, 1, ó 2 sustituyentes, cada uno de los cuales se selecciona independientemente a partir de H y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R_6 es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

6. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde el residuo

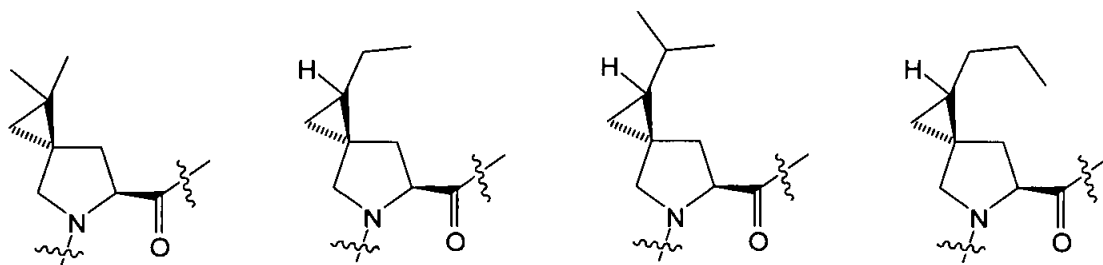
divalente:

5

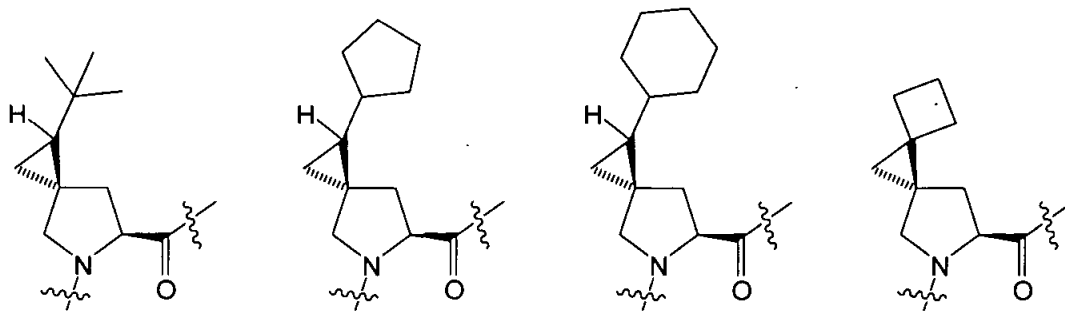


se selecciona a partir del grupo que consiste en:

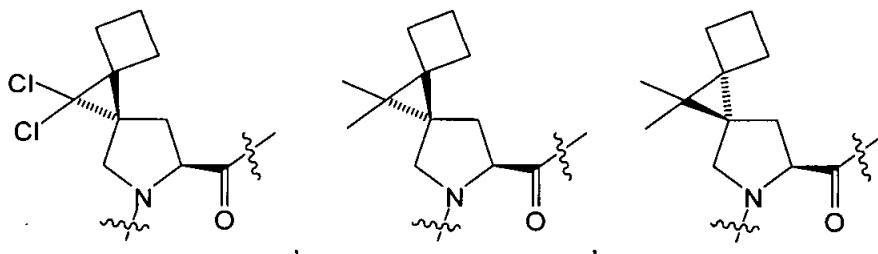
10



15



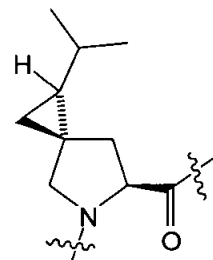
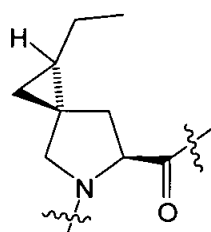
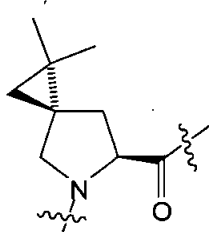
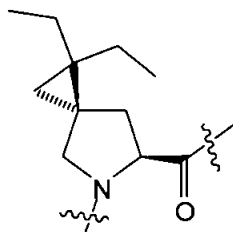
20



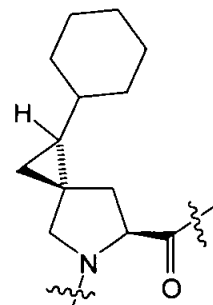
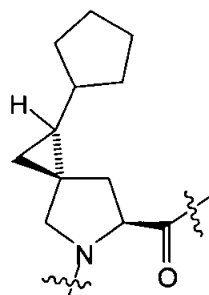
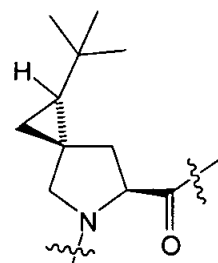
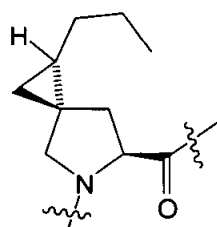
25

9

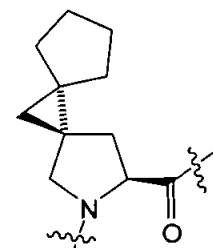
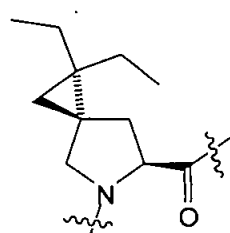
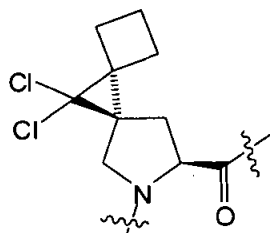
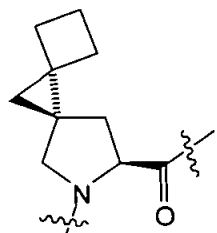
5



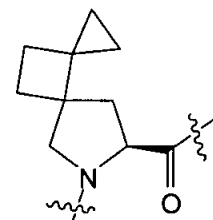
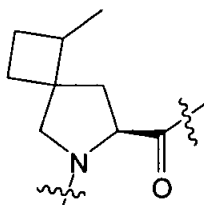
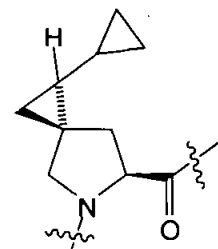
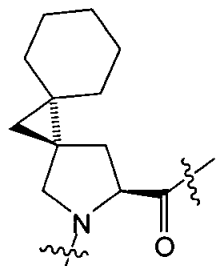
10



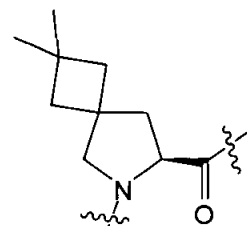
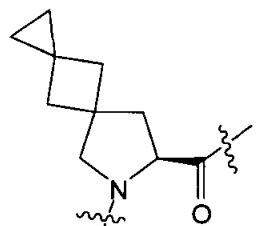
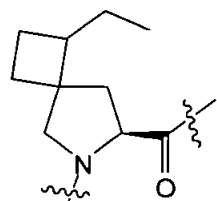
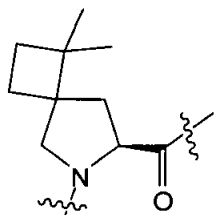
15



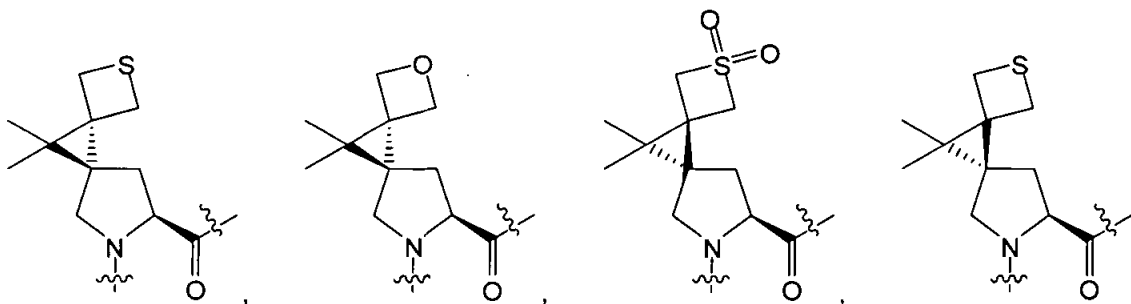
20



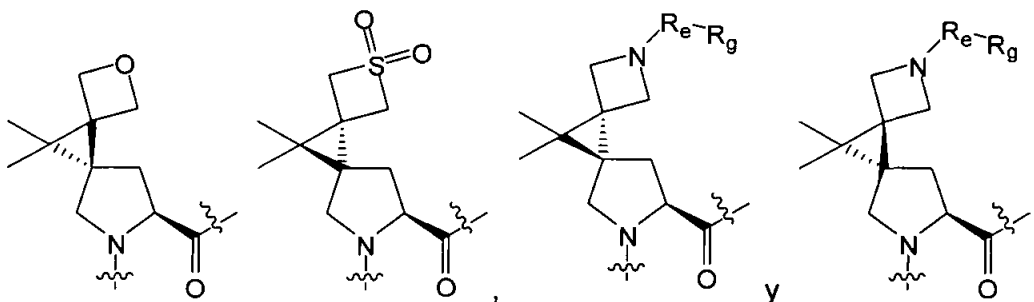
25



5



10



15

20

25

en donde R_3 está ausente, o es $C(O)$ o $S(O)_2$; y R_g se
 selecciona a partir de hidrógeno, o se selecciona a partir del grupo
 que consiste en alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, aril-alquilo de 0
 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de
 carbono, heterociclil-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y
 cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de
 carbono, cada uno de los cuales está sustituido con 0 a 4
 sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo
 que consiste en ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a
 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono,
 alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de
 carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8
 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono,
 haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 8

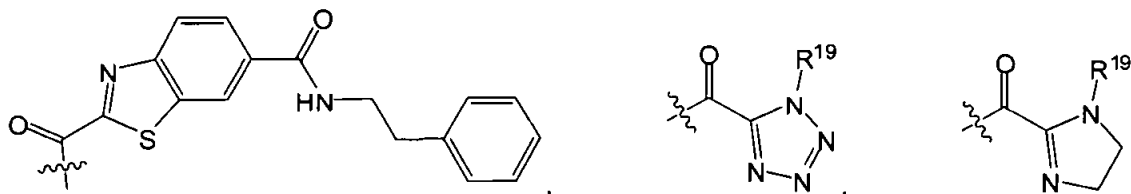


átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanoílo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-sulfonamida.

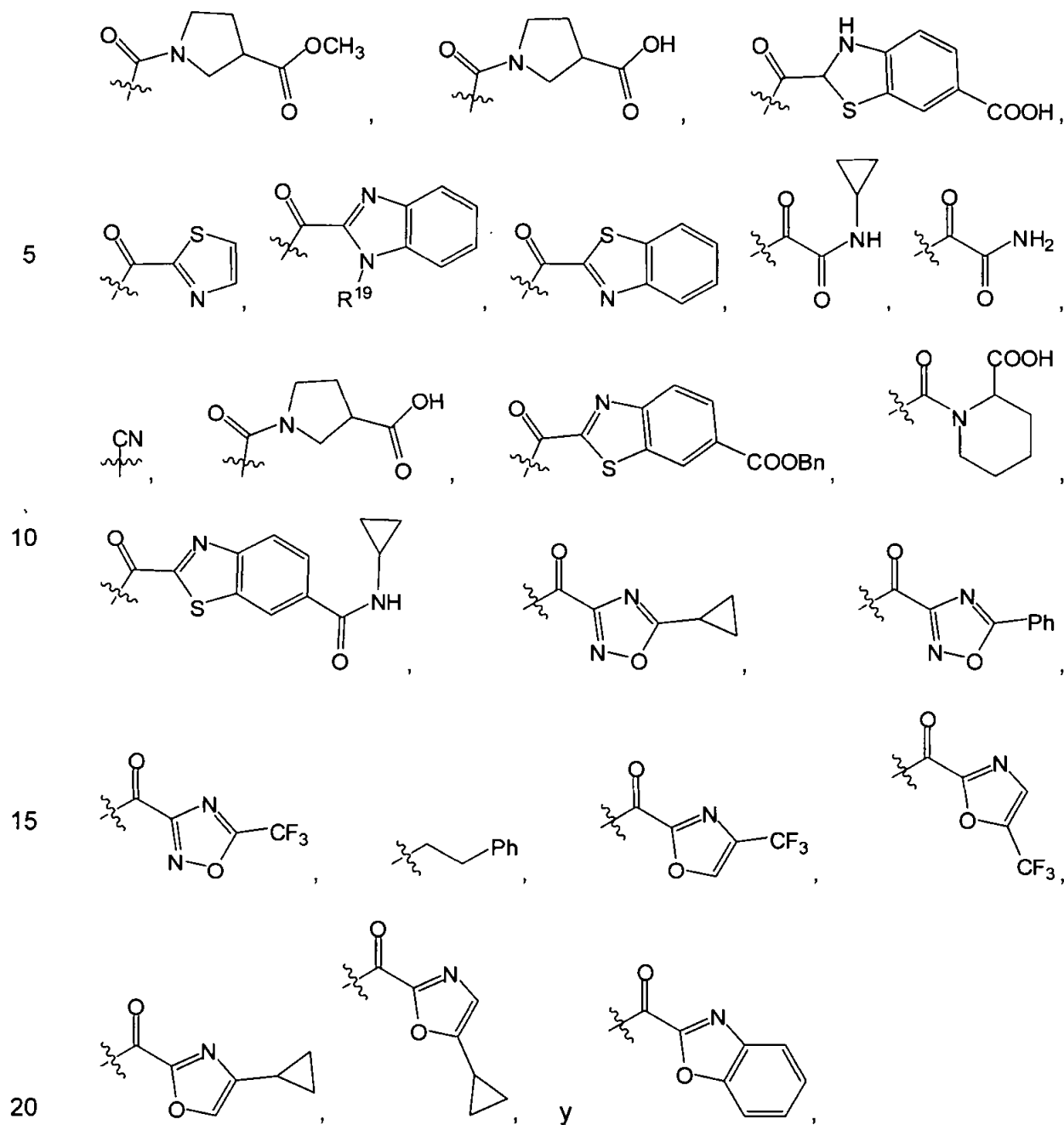
7. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde W se selecciona a partir del grupo que consiste en C(O)-C(O)NH₂, C(O)-C(O)N(H)-ciclopropilo, C(O)-benzotiazol, C(O)-benzoimidazol, C(O)-oxazol, C(O)-imidazol, y C(O)-oxadiazol, en donde los grupos benzotiazol, benzoimidazol, oxazol, y oxadiazol pueden estar independientemente sustituidos una o más veces con un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o

W se selecciona a partir del grupo que consiste en:

20



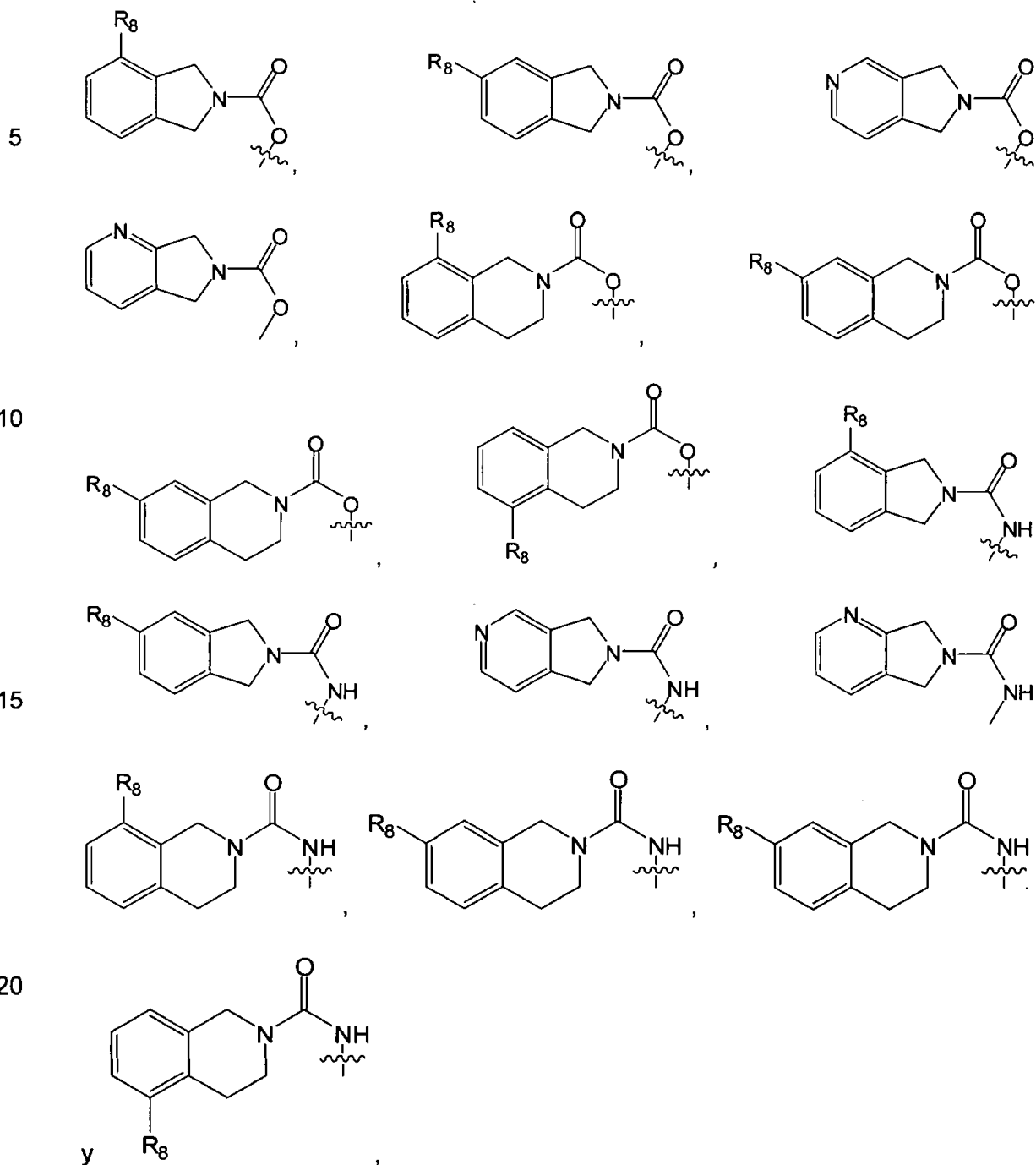
25



en donde R^{19} se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, arilo, trihalo-metilo, y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

8. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde X es

CR₅R_{5a}, R_{5a} es hidrógeno o metilo, y R₅ es un residuo seleccionado a partir del grupo que consiste en:



en donde R₈ se selecciona a partir de hidrógeno, metilo,
etilo, mono-, di-, o tri-fluoro-metilo, mono-, di-, o tri-fluoro-metoxilo,

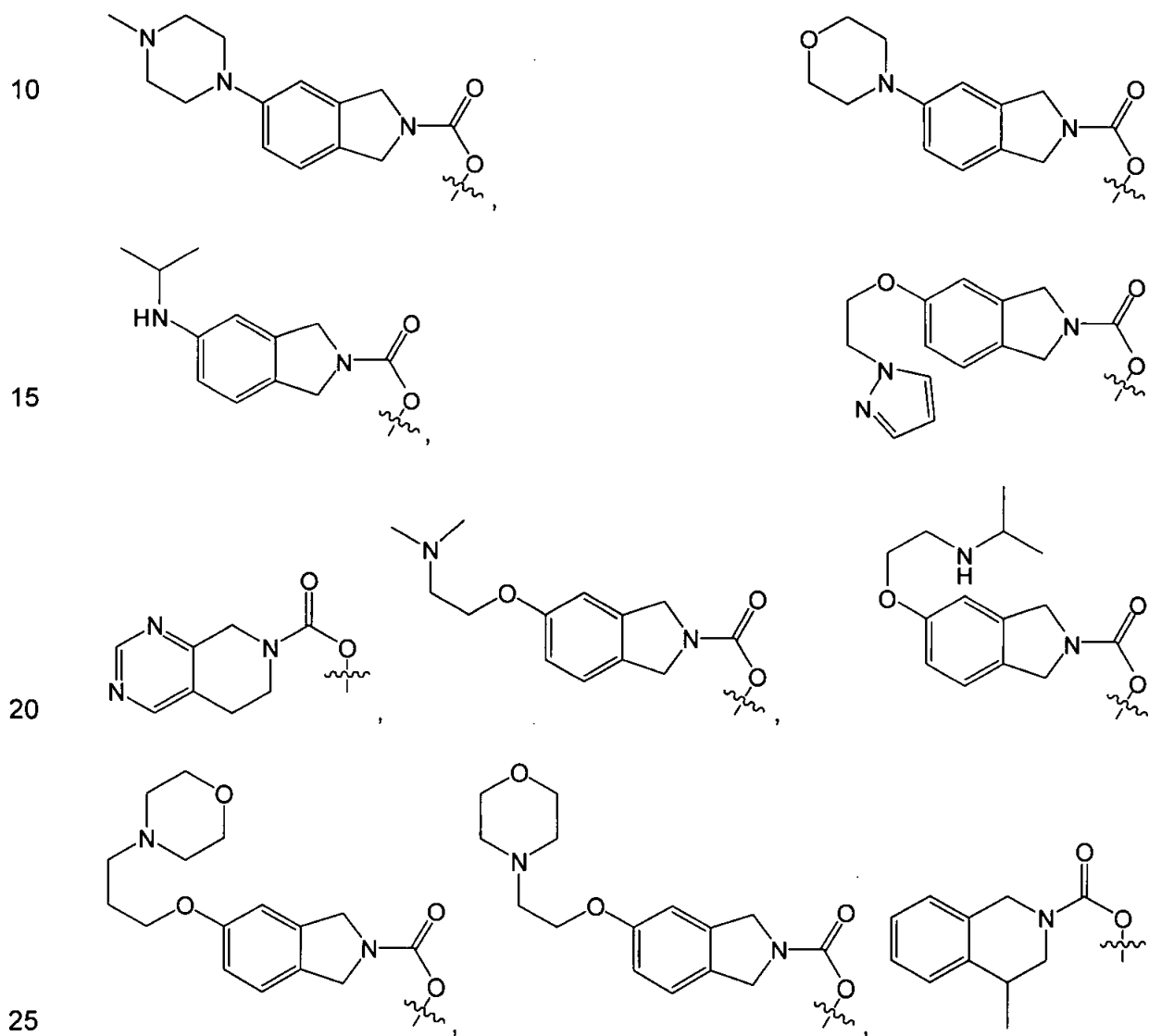
flúor, y cloro.

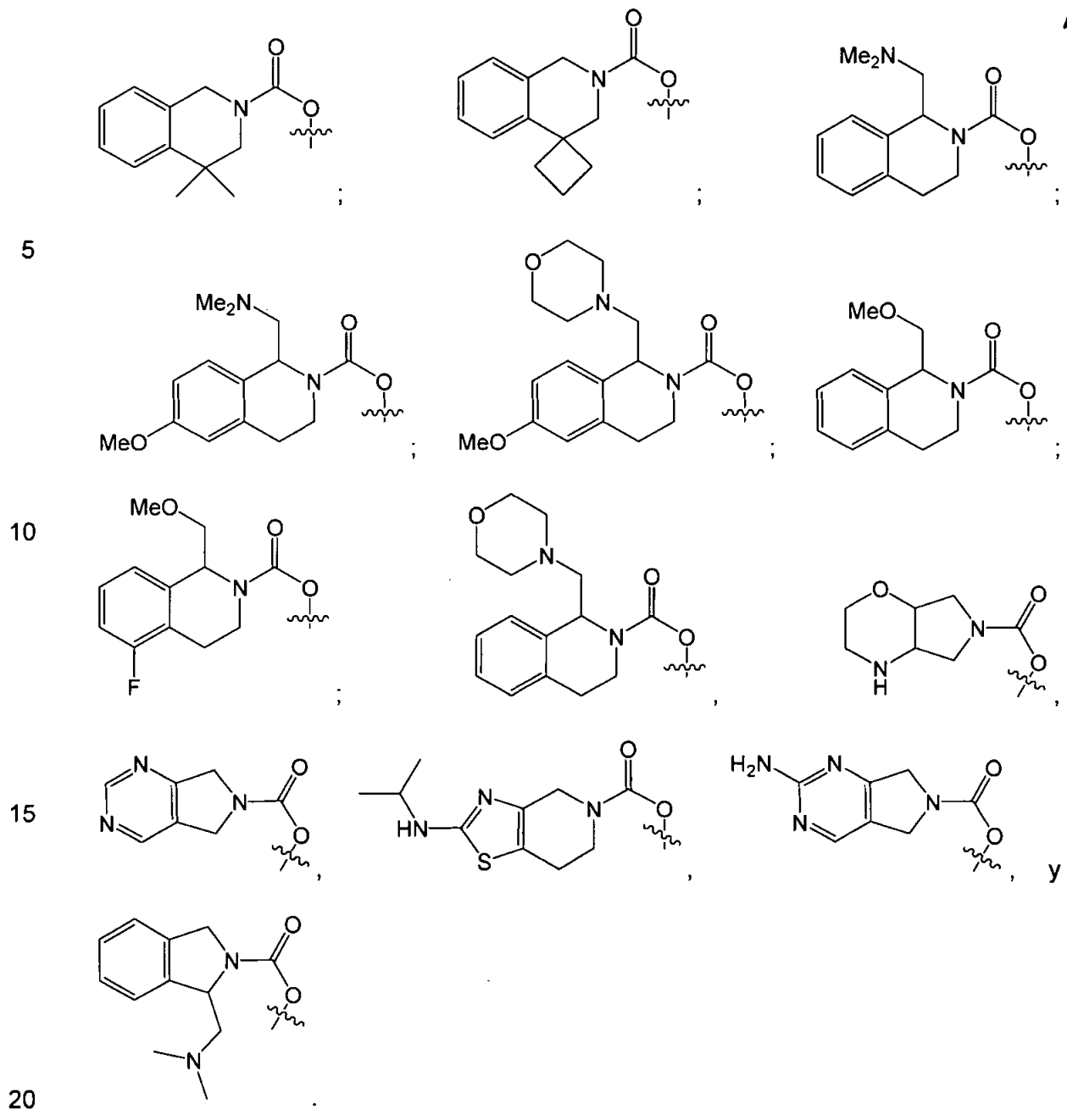
9. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde X es CR_5R_{5a} ;

R_{5a} es hidrógeno o metilo;

5 R_6 es hidrógeno, metilo, etilo, y mono-, di-, y tri-fluoro-
metilo;

R_5 es un residuo seleccionado a partir del grupo que
consiste en:

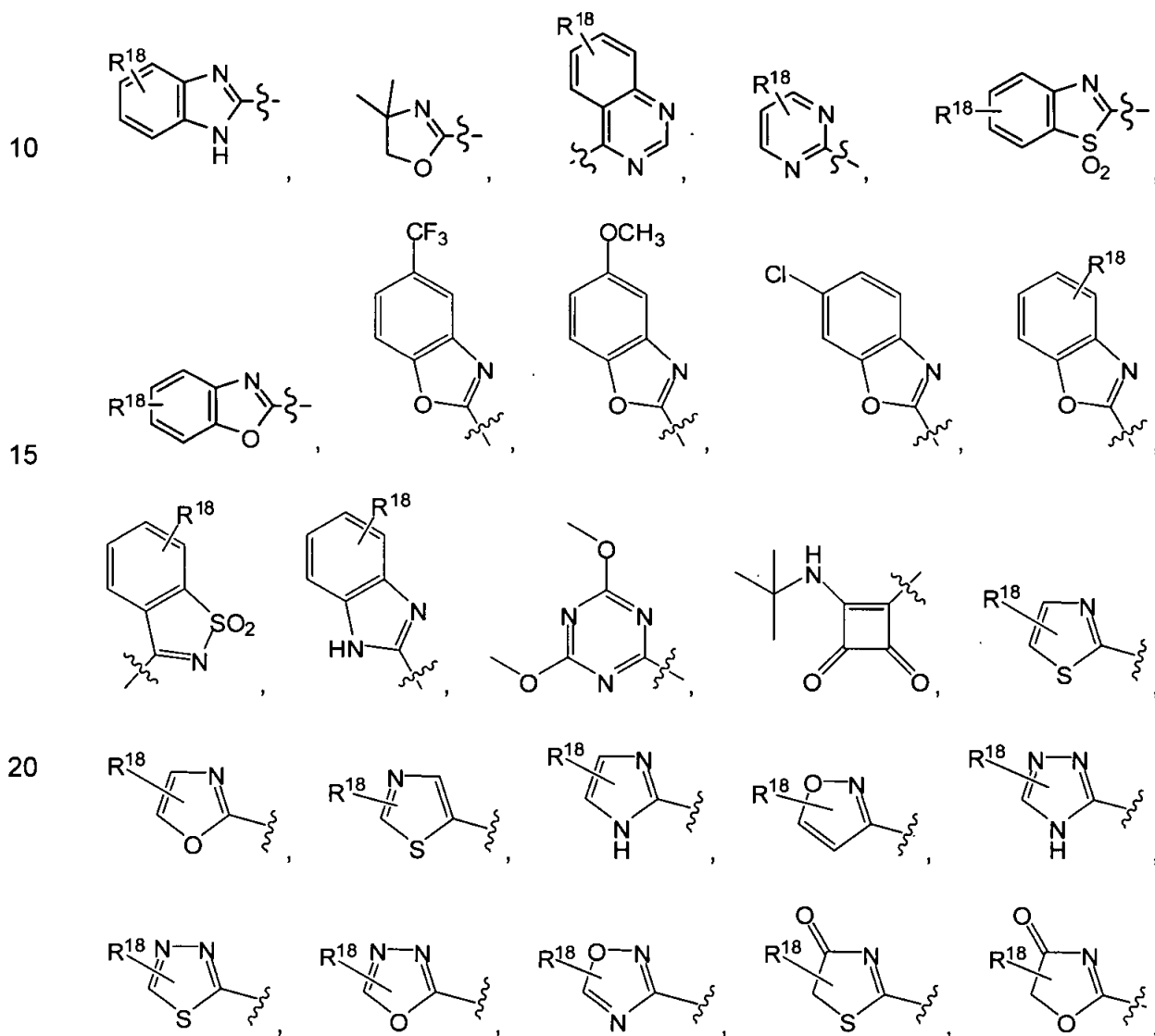


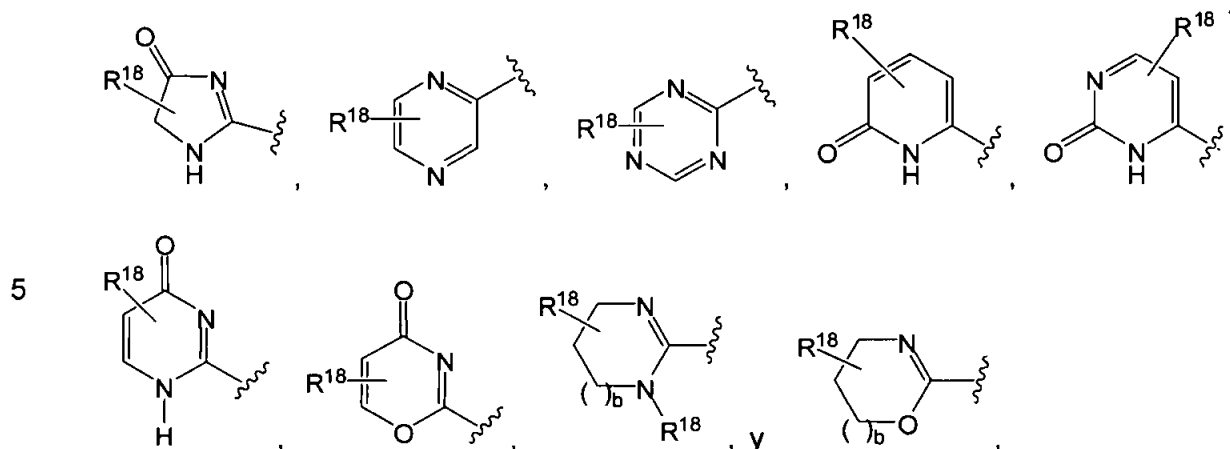


10. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde V se selecciona a partir de R^{20} o $C(O)-R^{20}$, en donde R^{20} se selecciona a partir del grupo que consiste en cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino,

fenilo, pirazina, benzo-oxazol, 4,4-dimetil-4,5-dihidro-oxazol, benzoimidazol, pirimidina, 1,1-dióxido de benzotiazol, y quinazolina, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido con un átomo de halógeno, CF_3 , alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; o

R^{20} se selecciona a partir del grupo que consiste en:

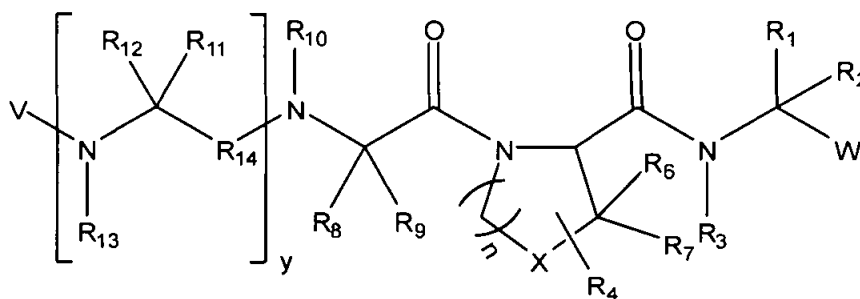




10 en donde b es 0, 1, ó 2; y R^{18} se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

11. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde W se selecciona a partir del grupo que consiste en $C(O)-C(O)N(R^{23})_2$, en donde R^{23} se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo, y heterociclo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

12. Un compuesto de la fórmula III:



III

y sales farmacéuticamente aceptables y estereoisómeros
de los mismos;

en donde:

y es 0 ó 1;

5 n es 0, 1, ó 2;

R₁₄ es C(O) ó SO₂;

R₁, R₂, W, R₁₃, y V se seleccionan cada uno
independientemente a partir de hidrógeno o a partir del grupo que
consiste en alquilo, alquil-arilo, heteroalquilo, heterociclilo,
10 heteroarilo, aril-heteroarilo, alquil-heteroarilo, cicloalquilo,
alquiloxilo, alquil-ariloxilo, ariloxilo, heteroariloxilo, heterocicliloxilo,
cicloalquiloxilo, amino, alquil-amino, aril-amino, alquil-aril-amino,
aril-amino, heteroaril-amino, cicloalquil-amino, mono- y di-alquil-
carboxamida, carboxi-alquil-amino, aril-alquiloxilo, y heterociclil-
15 amino; cada uno de los cuales puede estar además
independientemente sustituido una o más veces por X¹ y X²; en
donde X¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-
alquilo, heterociclilo, heterociclil-alquilo, arilo, alquil-arilo, aralquilo,
ariloxilo, tioarilo, aril-heteroarilo, heteroarilo, heterociclil-amino,
20 alquil-heteroarilo, o heteroaralquilo; en donde X¹ puede estar
independientemente sustituido con una o más fracciones X², las
cuales pueden ser iguales o diferentes, y se seleccionan de una
manera independiente; en donde X² es hidroxilo, oxo, alquilo,
cicloalquilo, espiro-cicloalquilo, heterociclo-alquilo, arilo, heteroarilo,
25 alcóxilo, ariloxilo, tio, tioalquilo, amino, mono- y di-alquil-amino, aril-

amino, alquil-sulfonilo, aril-sulfonilo, alquil-sulfonamido, aril-sulfonamido, carboxilo, carbalcoxilo, carboxamido, alcoxi-carbonil-amino, alcoxi-carbonilo, alcoxi-carboniloxilo, alquil-ureido, aril-ureido, halógeno, ciano, o nitro; en donde cada residuo X^2 seleccionado como alquilo, alcoxilo, y arilo puede estar insustituido o de manera opcional independientemente sustituido con una o más fracciones, las cuales pueden ser iguales o diferentes, y se seleccionan independientemente a partir de alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, heterociclilo, heterociclil-alquilo, arilo, alquil-arilo, aralquilo, aril-heteroarilo, heteroarilo, heterociclil-amino, alquil-heteroarilo, y heteroaralquilo;

W también se selecciona a partir del grupo que consiste en $C(O)OH$, $C(O)OR_{24}$, $C(O)$ -amina, $P(O)(OR_{24})_2$, $C(O)-C(O)OH$, $C(=N-O-R_{24})-C(O)$ -amina, $C(O)NHS(O)_2R_{24}$, $C(O)NHS(O)_pN(R_{24})_2$, $C(O)NR_{24}S(O)_pN(R_{24})_2C(O)-C(O)$ -amina, $CON(H)SO_2$ -amina, y $C(O)-[C(O)]_a$ -heterociclo, en donde el heterociclo puede estar sustituido o insustituido, en donde a es 0 ó 1, en donde cada R_{24} se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, formilo, carboxilato, amida, amino, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, alcanóilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo sustituido o insustituido, alcanoiloxilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino sustituido o insustituido, cicloalquilo de

10

3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido, y heterociclo-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono sustituido o insustituido;

5 V también se selecciona a partir del grupo que consiste en $-Q^1-Q^2$, en donde Q^1 está ausente, o es $C(O)$, $N(H)$, $N(\text{alquilo de 1 a 4 átomos de carbono})$, $C=N(CN)$, $C=N(SO_2CH_3)$, o $C=N-COH$, y Q^2 es hidrógeno, o se selecciona a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, O-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, NH_2 , $N(H)$ -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $N(\text{alquilo de 1 a 4 átomos de carbono})_2$, SO_2 -arilo, SO_2 -alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, arilo, heteroarilo, y heterociclo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces
10 con un átomo de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por uno o más átomos de halógeno, o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

o R^1 y R^2 pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o
20 más heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces;

R^3 se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

25 X es CR^5R^{5a} ;

R⁴ representa de 0 a 4 sustituyentes, cada uno de los cuales se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, o a partir del grupo que consiste en alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, arilo, heterociclo, y heteroarilo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R⁵ se selecciona a partir de hidrógeno u oxo, o a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heterociclo-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, cicloalquiloxilo de 3 a 8 átomos de carbono, ariloxilo, y hetero-ariloxilo, cada uno de los cuales puede estar independientemente sustituido una o más veces con un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{5a} se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, y heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

o R⁴ y R⁵ pueden formar juntos un anillo de dimetil-ciclo-



propilo fusionado, un anillo de ciclopentano fusionado, un anillo de fenilo fusionado, o un anillo de piridilo fusionado, cada uno de los cuales puede estar sustituido con un átomo de halógeno, arilo, trihalometilo, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

- 5 o R^5 y R^{5a} pueden formar juntos un anillo espirocíclico que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo, o R^5 y R^{5a} pueden formar juntos un anillo espirocíclico que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo y que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo, el cual está opcionalmente sustituido por 0 a 4 sustituyentes seleccionados a
- 10 partir de ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono- alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de
- 15 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo
- 20 de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH , C(O)NH_2 , mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO_3H , SO_2NH_2 , y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de
- 25 carbono-sulfonamida, o dos de estos 0 a 4 sustituyentes, tomados

juntos, forman un anillo fusionado o espirocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-sulfonamida;

R⁶ y R⁷ se seleccionan cada uno independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, amino, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} y R^{12} se seleccionan cada uno independientemente a partir del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono;

5 o R^6 y R^7 pueden formar juntos un anillo espirocíclico que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo, y que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo, el cual está opcionalmente sustituido por 0 a 4 sustituyentes seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8
10 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos
15 de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanoílo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4
20 átomos de carbono, COOH , C(O)NH_2 , mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO_3H , SO_2NH_2 , y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-sulfonamida, o dos sustituyentes, tomados juntos, forman un anillo
25 fusionado o espirocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 0, 1, ó 2

heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, alcenoílo de 1 a 4 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo, y fenilo;

en donde cuando menos uno de R^5 y R^{5a} , o R_6 y R_7 , tomados en combinación, forman un anillo espirocíclico que tiene cuando menos un sustituyente del anillo espirocíclico;

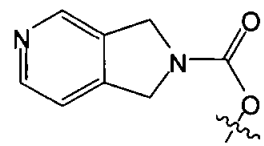
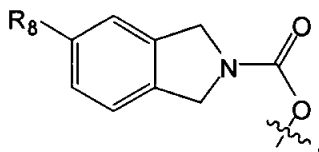
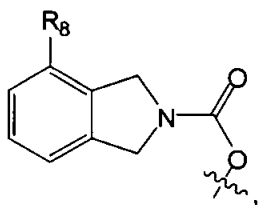
o R^3 y W pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o más heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces; y

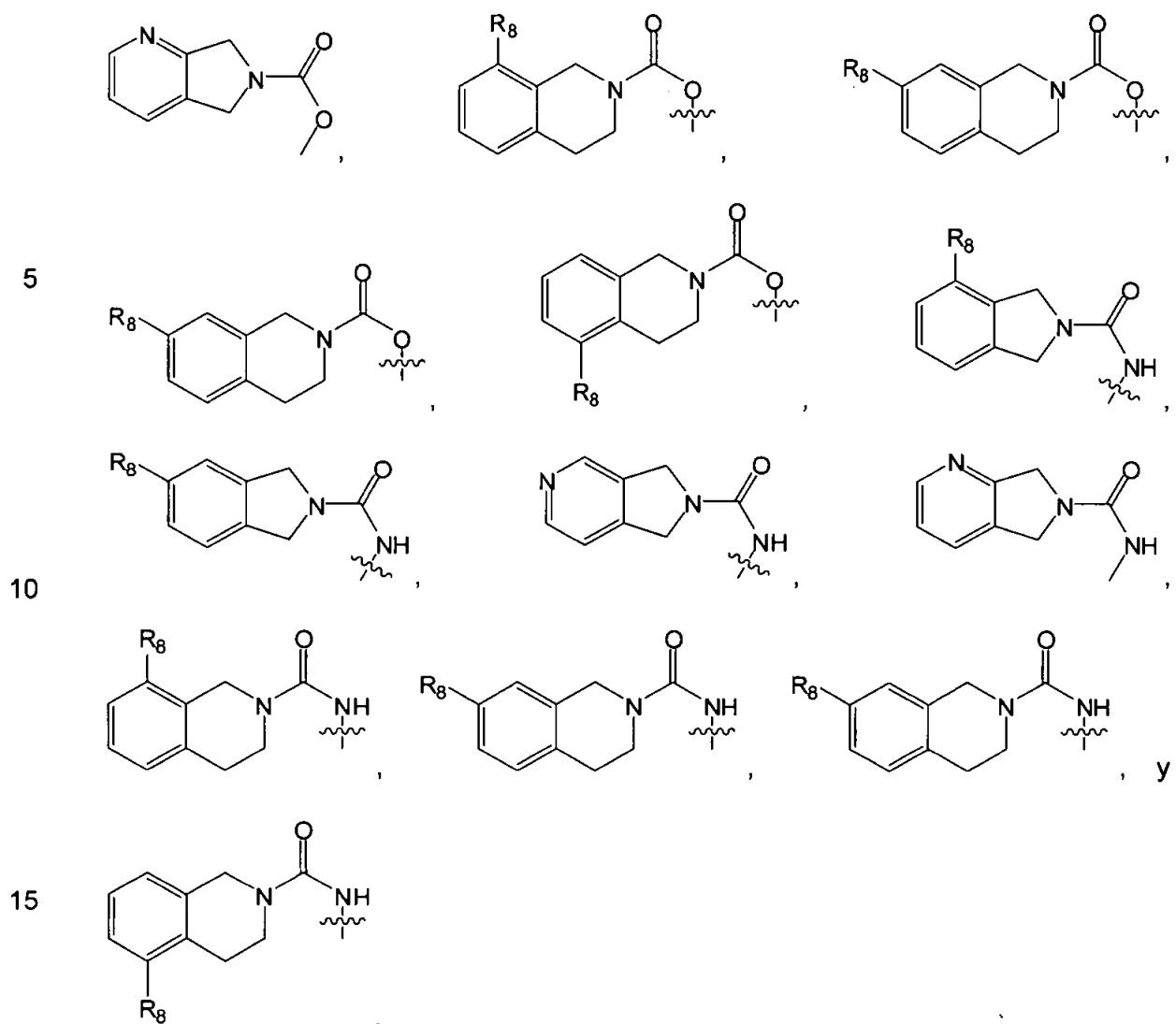
o cuando y es 0, R_{10} y V pueden formar juntos un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o más heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces.

13. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde R^5 y R^{5a} , tomados en combinación, forman un anillo espirocíclico que tiene entre 3 y 7 átomos del anillo y que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo, cuyo anillo espirocíclico está sustituido con un anillo espirocíclico de 3 a 7 miembros y que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, y en donde cada uno

de los anillos espirocíclicos tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de ciano, halógeno, hidroxilo, amino, tiol, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfonilo, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-sulfoxilo, alcanóilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 8 átomos de carbono-carbonilo, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, aril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, heteroaril-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, COOH, C(O)NH₂, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-carboxamida, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino-alquilo de 0 a 4 átomos de carbono, SO₃H, SO₂NH₂, y mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-sulfonamida.

14. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde X es CR₅R_{5a}, R_{5a} es hidrógeno o metilo, y R₅ es un residuo seleccionado a partir del grupo que consiste en:





en donde R_8 se selecciona a partir de hidrógeno, metilo,
 20 etilo, mono-, di-, o tri-fluoro-metilo, mono-, di-, o tri-fluoro-metoxilo,
 flúor, y cloro.

15. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde X es
 CR_5R_{5a} ;

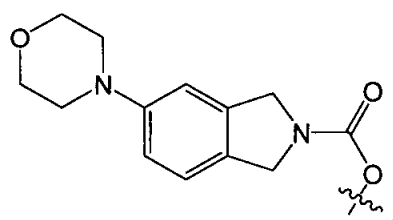
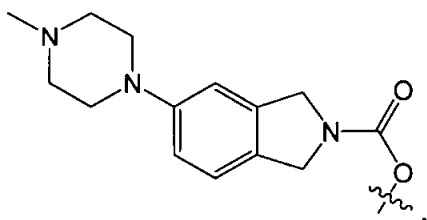
R_{5a} es hidrógeno o metilo;

25 R_6 es hidrógeno, metilo, etilo, y mono-, di-, y tri-fluoro-

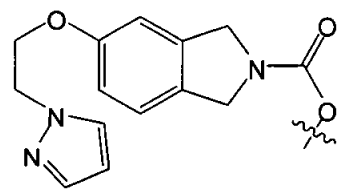
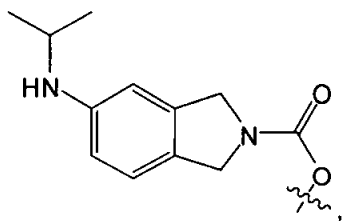
metilo;

R_5 es un residuo seleccionado a partir del grupo que consiste en:

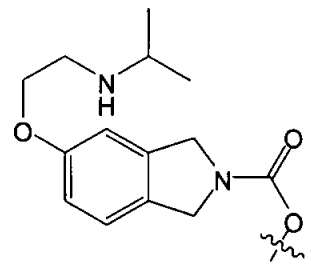
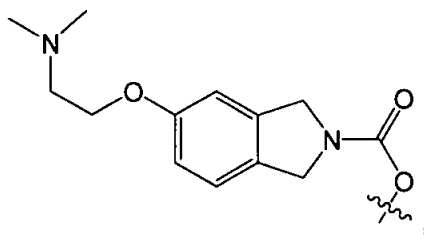
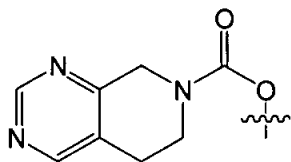
5



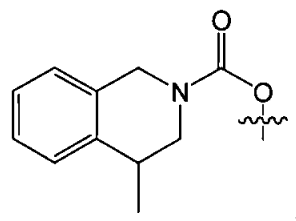
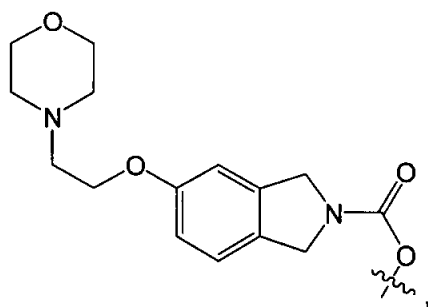
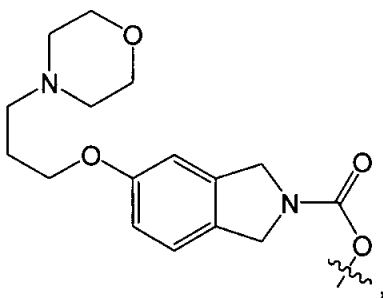
10



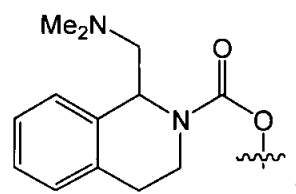
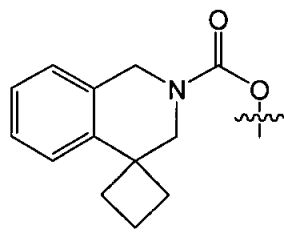
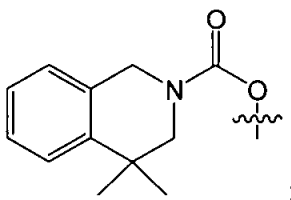
15



20



25





20



en donde:

k_1 y k_2 son 0 ó 1, de tal manera que la suma de k_1 y k_2 es igual a 1 ó 2;

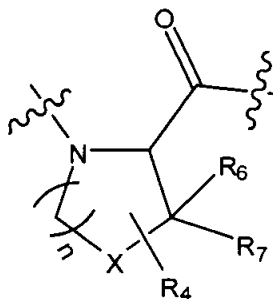
R_a y R_b , tomados juntos, forman un anillo espirocíclico de 3 a 6 miembros, que tiene 0, 1, ó 2 heteroátomos del anillo seleccionados a partir de N, O, y S, cuyo anillo fusionado o espirocíclico tiene de 0 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanoilo de 1 a 4 átomos de carbono, y fenilo;

R_c representa de 0 a 2 sustituyentes, los cuales se seleccionan independientemente en cada presentación de R_c a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y fenilo, o dos sustituyentes R_c *geminales*, tomados en combinación, forman un anillo espirocíclico de 3 a 6 miembros;

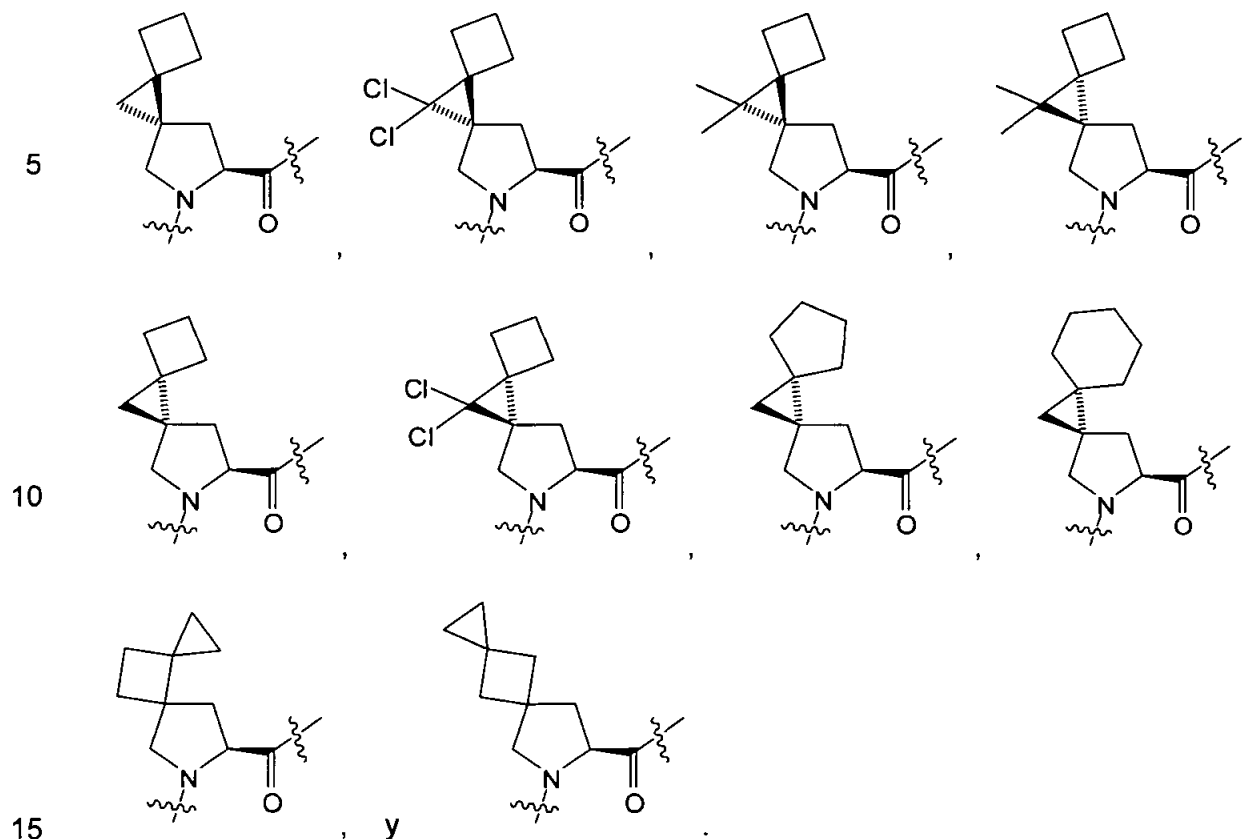
R_4 representa 0, 1, ó 2 sustituyentes, cada uno de los cuales se selecciona independientemente a partir de H y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R_6 es hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

17. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde el residuo divalente:



se selecciona a partir del grupo que consiste en:



18. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde W se selecciona a partir del grupo que consiste en C(O)-C(O)NH₂, C(O)-C(O)N(H)-ciclopropilo, C(O)-benzotiazol, C(O)-benzoimidazol, C(O)-oxazol, C(O)-imidazol, y C(O)-oxadiazol, en donde los grupos benzotiazol, benzoimidazol, oxazol, y oxadiazol pueden estar independientemente sustituidos una o más veces con un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

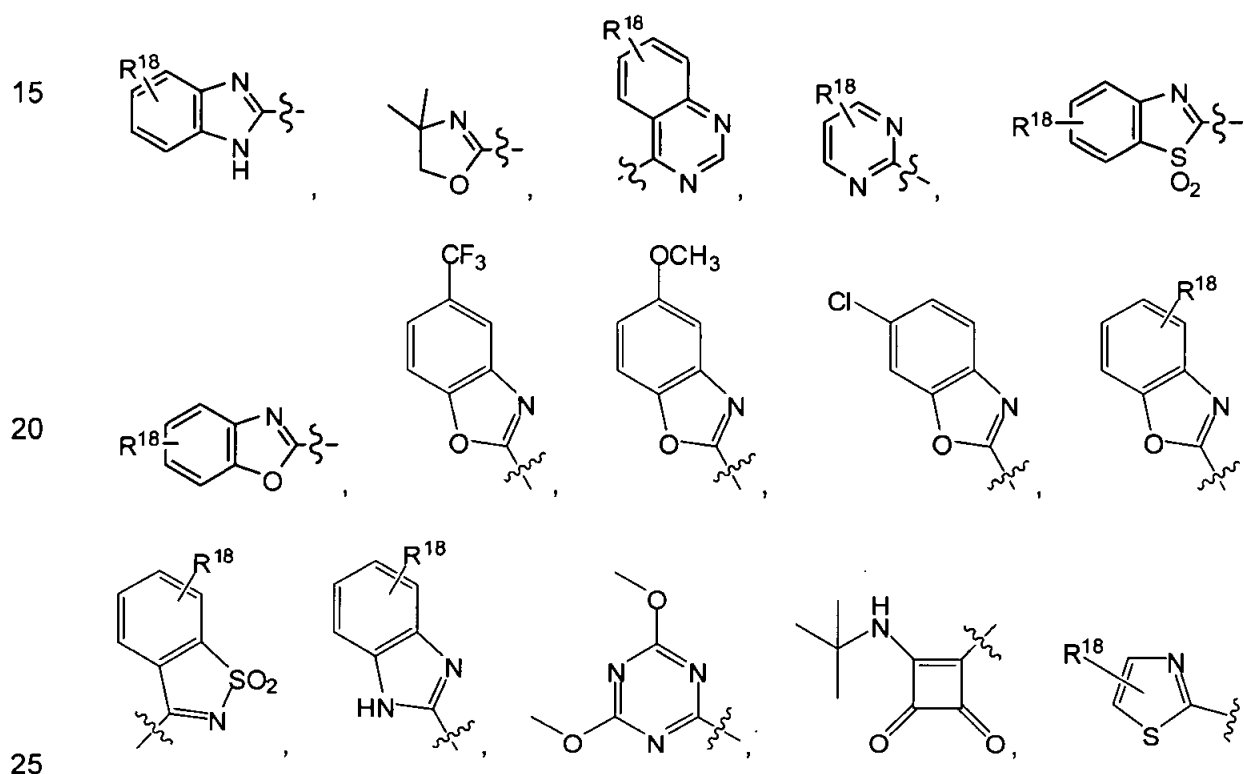
W se selecciona a partir del grupo que consiste en:

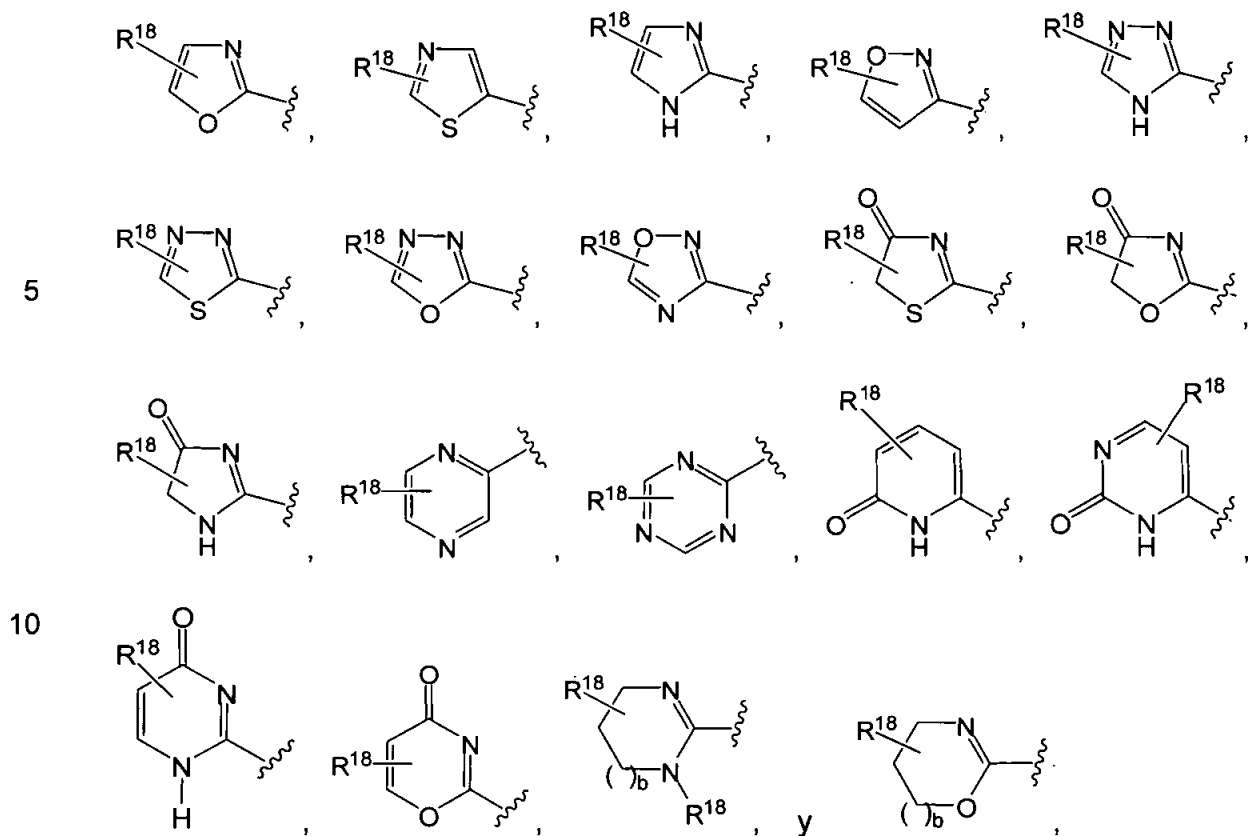


en donde R^{19} se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, arilo, trihalo-metilo, y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

19. El compuesto de la Reivindicación 12, en donde V es R^{20} o $C(O)-R^{20}$, en donde R^{20} se selecciona a partir del grupo que consiste en cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, mono- y di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-amino, fenilo, pirazina, benzoxazol, 4,4-dimetil-4,5-dihidro-oxazol, benzo-imidazol, pirimidina, 1,1-dióxido de benzotiazol, y quinazolina, cada uno de los cuales puede estar además independientemente sustituido con un átomo de halógeno, CF_3 , alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; o

R^{20} se selecciona a partir del grupo que consiste en:





15 en donde **b** es 0, 1, ó 2; y R^{18} se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, un átomo de halógeno, arilo, trihalo-metilo, y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

20 20. Un método para el tratamiento de un trastorno asociado con el virus de hepatitis C, el cual comprende administrar a un sujeto que lo necesite, una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12, de tal manera que se trate el trastorno asociado con el virus de hepatitis C.

25 21. El método de la Reivindicación 40, en donde el trastorno asociado con el virus de hepatitis C se selecciona a partir del grupo que consiste en infección por el virus de hepatitis C, cirrosis

845

hepática, enfermedad crónica del hígado, carcinoma hepatocelular, crioglobulinemia, linfoma que no es de Hodgkin, y una respuesta inmune intracelular innata suprimida.

22. Un método para el tratamiento, la inhibición, o la
5 prevención de la actividad del virus de hepatitis C en un sujeto que lo necesite, el cual comprende administrar al sujeto una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12.

23. Un método para el tratamiento, la inhibición, o la
10 prevención de la actividad del virus de hepatitis C en un sujeto que lo necesite, el cual comprende administrar al sujeto una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12, en donde el compuesto interactúa con cualquier objetivo en el ciclo de vida del virus de hepatitis C.

24. Un método para reducir la carga de ARN del virus de
15 hepatitis C en un sujeto que lo necesite, el cual comprende administrar al sujeto una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12, de tal manera que se reduzca la carga de ARN del virus de hepatitis C en
20 el sujeto.

25. Un método para el tratamiento de un trastorno asociado con el virus de hepatitis C en un sujeto, el cual comprende administrar a un sujeto que lo necesite, una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación
25 1 o de la Reivindicación 12, y un vehículo farmacéuticamente

aceptable, de tal manera que se trate el trastorno asociado con el virus de hepatitis C.

26. Un método para el tratamiento de un trastorno asociado con el virus de hepatitis C, el cual comprende administrar a un sujeto
5 que lo necesite, una cantidad farmacéuticamente efectiva de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12, en combinación con una cantidad farmacéuticamente efectiva de un compuesto modulador del virus de hepatitis C adicional, de tal manera que se trate el trastorno asociado con el virus de hepatitis C.

10 27. Un método para el tratamiento de infección por el virus de hepatitis C, cirrosis hepática, enfermedad crónica del hígado, carcinoma hepatocelular, crioglobulinemia, linfoma que no es de Hodgkin, y/o una respuesta inmune intracelular innata suprimida en un sujeto que lo necesite, el cual comprende administrar al sujeto
15 una cantidad farmacéuticamente aceptable de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 12.

20

25

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
NOVARTIS AG

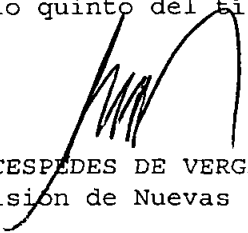
REFERENCIA	Radicación No.	8 108182
	Solicitud internacional	pct/us2007/066204
	Fecha inicio fase nacional	11/11/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	014857

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 21 NOV. 2008
adpall