

FORMULARIO UNICO DE CORR

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345-00002-0000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345-00002-0000

Fecha: 2009-03-26 17:02:38 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 45

1

SOLICITU

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación de una solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: Bristol-Myers Squibb Company

Dirección: Route 206 and Province Line Road, Prin-
centon, New Jersey 08543-4000, Estados Unidos
de América

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América
Lugar de Constitución: Estados Unidos dde América

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 60.

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: patents.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 79.143.366

TP 20.281

4

Numero de expediente

09'020.345

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada

Presento a su despacho nuevo capítulo reivin-
dicatorio compuesto por 15 reivindicaciones.

6

Comprobante de Pago No. 09-18609, 09-2313, 09-18591

Fecha marzo 6/09, enero 13/09

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

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

8

NOMBRE ALVARO CORREA ORDOÑEZ

FIRMA

C.C. 79.143.366

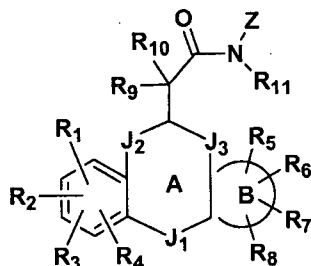
T.P. 20.281

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

REIVINDICACIONES ENMENDADAS

1. Un compuesto de conformidad con la fórmula (I),

5



4

10

un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

15 Z se selecciona de heterociclo, heteroarilo y ciano;

A se selecciona de un anillo carbocíclico de 5 hasta 8 elementos y un anillo heterocíclico de 5 hasta 8 elementos;

B es un anillo de fenilo, piridinilo o pirazinilo;

J_1 es O, S, SO, y SO_2 , un enlace, CH_2 , o CH_2CH_2 ; y

20 J_2 y J_3 cada uno son un enlace;

R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, y R₈ son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, alcoxi, alcoxi sustituido, nitro,

ciano, OR_{12} , $-NR_{12}R_{13}$, $-C(=O)R_{12}$, $-CO_2R_{12}$, $-C(=O)NR_{12}R_{13}$,

$-OC(=O)NR_{12}, R_{13}$, $\begin{array}{c} \text{---}NC(=O)NR_{12}R_{13} \\ | \\ R_d \end{array}$, $-OC(=O)R_{12}$, $-NR_{12}C(=O)R_{13}$, -

$NR_{12}C(O)OR_{13}$, $-NR_{12}C(S)OR_{13}$, $S(O)_pR_{16}$, $NR_{12}SO_2R_{16}$,

5 dialquilaminoalcoxi, alcoxialquiloxialquiloxi,

$SO_2NR_{12}R_{13}$, cicloalquilo, cicloalquenilo,

cicloalquinilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; y/o

(ii) donde sea posible, cada uno de R_1-R_8 se toma junto con cualquiera de R_1-R_8 localizado en un átomo
10 adyacente para formar un anillo fusionado; y/o (iii) donde sea posible cualquiera de R_1-R_8 se toma junto con cualquiera de R_1-R_8 localizado en el mismo átomo para formar un grupo oxo, alquenilo, alquenilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo;

15 R_9 y R_{10} son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, nitro, ciano, OR_{14} , $NR_{14}R_{15}$, $C(=O)R_{14}$, CO_2R_{14} , $C(=O)NR_{14}R_{15}$, -O-
20 $C(=O)R_{14}$, $NR_{14}C(=O)R_{15}$, $NR_{14}C(=O)OR_{15}$, $NR_{14}C(=S)OR_{15}$, $S(O)_pR_{17}$, $NR_{14}SO_2R_{17}$, $SO_2NR_{14}R_{15}$, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; o (ii) junto con el átomo al cual se enlazan, R_9 y R_{10} se toman juntos para formar un grupo carbonilo, alquenilo, alquenilo sustituido,

25 cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo;

R₁₁ se selecciona de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, C(=O)alquilo, CO₂(alquilo), SO₂alquilo, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo, heterociclo, y cicloalquilo;

5 R₁₂, R₁₃, R₁₄, y R₁₅, son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heteroarilo, y heterociclo; o (ii) en donde sea posible R₁₂ se toma
10 junto con R₁₃, y/o en donde sea posible R₁₄ se toma junto con R₁₅ para formar un anillo heteroarilo o heterociclo;

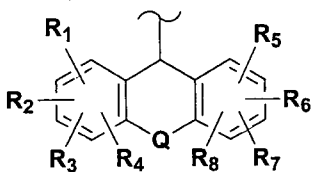
R₁₆ y R₁₇, son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido,
15 cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heteroarilo, y heterociclo;

R_d es H, alquilo o arilo; y

p es 0, 1 ó 2,

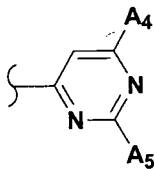
con la condición de que

(1) en donde la porción tricíclica en la fórmula I el
20 compuesto es



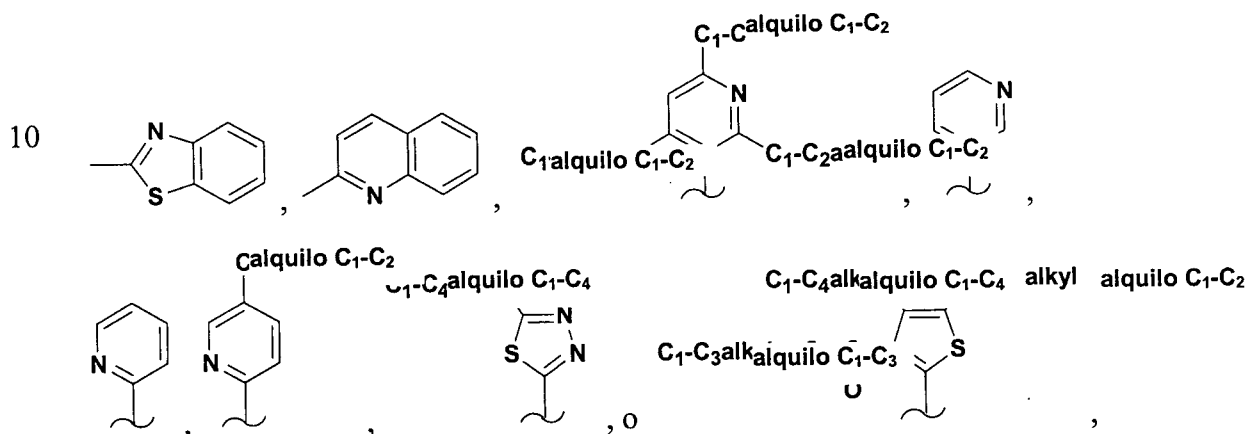
25 en donde Q es O y R₁ hasta R₈ son cada uno H, entonces

(a) Z es diferente de

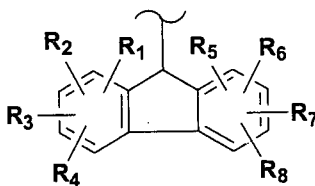


5 en donde A_4 y A_5 son los mismos o diferentes y son independientemente H o alquilo C_1-C_2 ; o

(b) Z es diferente de

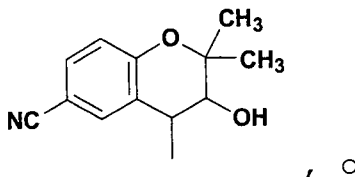


(2) en donde la porción tricíclica es

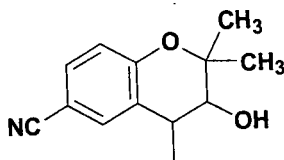


20 en donde R_1 hasta R_8 son cada uno H, entonces

(a) Z es diferente de

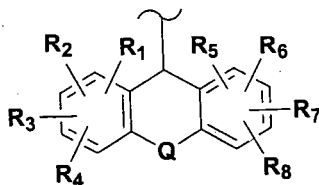


(b) en donde Z es



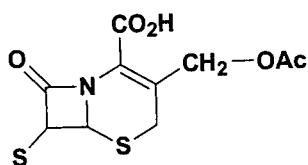
5 entonces R_{11} es diferente de un alquileo C_1-C_2 substituido;

(3) donde la porción tricíclica es



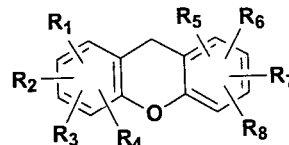
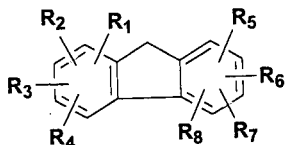
10

en donde Q es S o SO_2 , y R_1 hasta R_8 son cada uno H, entonces Z es diferente de



15

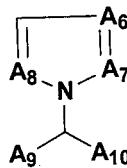
(4) en donde la porción tricíclica es



o

20

en donde R_1 hasta R_8 son cada uno H, entonces Z es diferente de



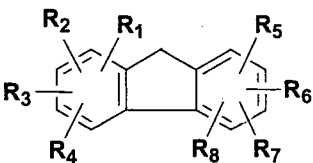
25

en donde A_6 , A_7 y A_8 son independientemente N o CH,

A₉ es -(CH₂)_d-A₁₁ en donde d es 0 hasta 4;
A₁₁ es OH, CO₂H, 5-tetrazolilo, -COO(alquilo C₁-C₄)_{n_a} o CN-
;

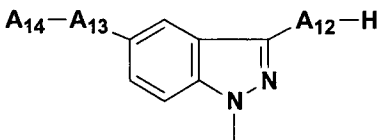
n_a es 0 hasta 4; y

5 A₁₀ es alquilo de cadena recta C₄-C₇;
(5) en donde la porción tricíclica es

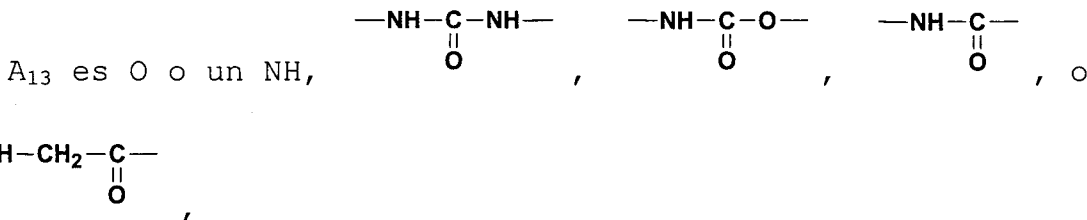


10

entonces Z es diferente de



15 en donde A₁₂ es O o S; y



20 en donde los 3 últimos grupos se unen al anillo
aromático a través del átomo N;

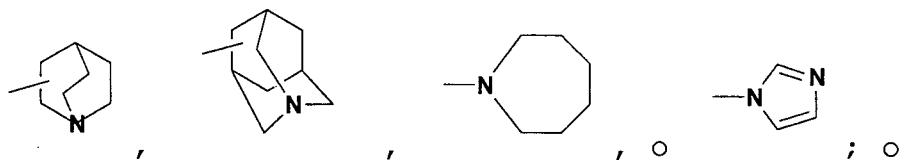
A₁₄ es H,
alquilo,
cicloalquilo C₃-C₇,
25 fenilo, naftilo, antranilo o fluorenilo opcionalmente

substituido, o

un quinolin-2-ilmetoxi o piridin-ilmetoxi; o

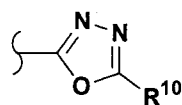
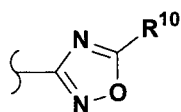
Z es diferente de

5



Z es diferente de

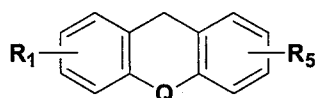
10



en donde R^{10} es un sistema de anillo azacíclico no aromático o azabíciclico no aromático;

15

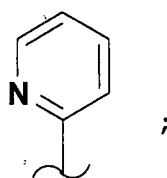
(6) donde la porción tricíclica es



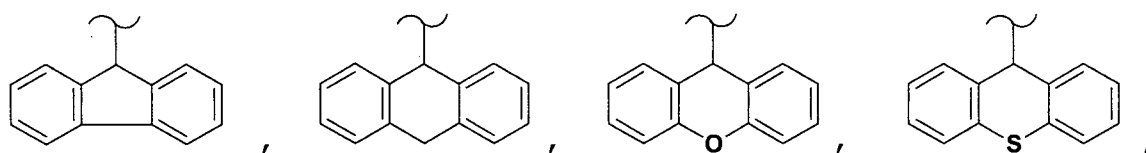
Q es $-O-$, $-S-$, $-C(R^3R^4)-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH=CH-CH_2-$, $-CH_2-$, $CH=CH-$, $-CH_2-(C=O)-$, $-(C=O)-CH_2-$, $CH_2CH_2CH_2-$, $-CH=CH-$, $-O-CH_2-$, $-CH_2-O-$, $-O-CH_2-O-$, $-CH_2-O-CH_2-$, $-S-CH_2-$, $-CH_2-S-$, $-CH(R^5)CH_2-$, $-CH_2CH(R^5)-$, $-(C=O)-$, o $-(S=O)-$ donde R^3 y R^4 independientemente son hidrógeno o alquilo C_{1-7} ; y en donde R^5 es alquilo C_{1-7} o fenilo;

25

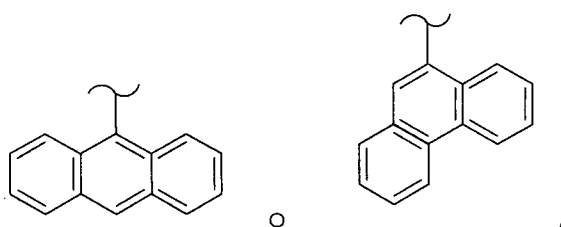
entonces Z es diferente de



5 (7) en donde la porción tricíclica es

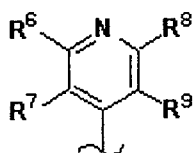


10



entonces Z es diferente de

15



en donde:

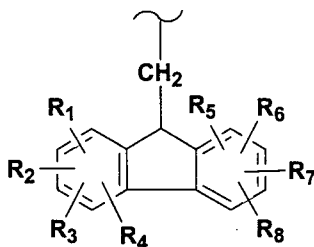
R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente seleccionados de alquilo C₁-C₆, halo-alquilo C₁-C₆ que contiene 1 hasta
20 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, nitro-alquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alcanilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alcansulfinilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alcansulfonilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, halo-
25 alqueno C₂-C₆ que contiene 1-5 átomos de halógeno,

alquinilo C_2-C_6 , halo-alquinilo C_2-C_6 que contiene 1-5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3-C_7 y halógeno; o

R^6 y R^7 , tomados juntos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 hasta 7 elementos saturado o no saturado el cual puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de O y S; y

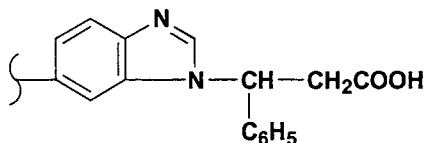
R^8 y R^9 son cada uno independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y halógeno;

(8) en donde la porción tricíclica es



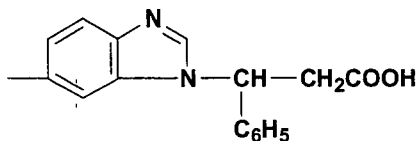
entonces

a) Z es diferente de



o un homólogo del mismo,

b) si Z es

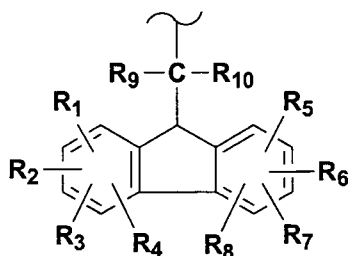


o un homólogo del mismo, entonces R_{11} es diferente de H;

o

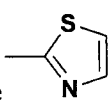
(9) en donde la porción tricíclica es

5

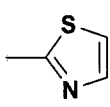


entonces

10

a) Z es diferente de  substituido o no substituido,

o

b) en donde Z es  substituido o no substituido,

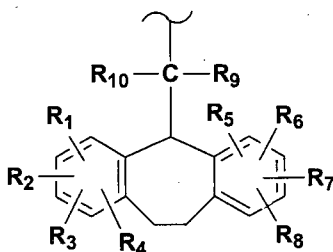
entonces al menos uno o R₉ y R₁₀ es diferente de H y/o R₁₁ es

15

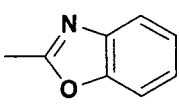
diferente a H;

(10) en donde la porción tricíclica es

20



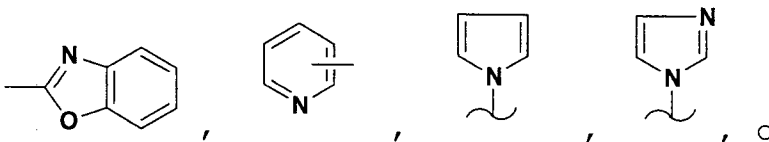
entonces

a) Z es diferente de ,

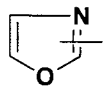
25

12

b) donde Z es



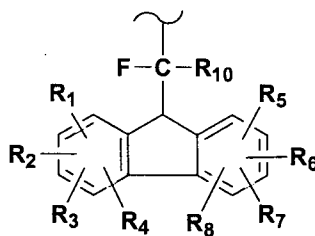
5



, entonces R_{11} es diferente de H y/o al menos uno de R_9 y R_{10} es diferente de H;

(11) en donde la porción tricíclica es

10



entonces

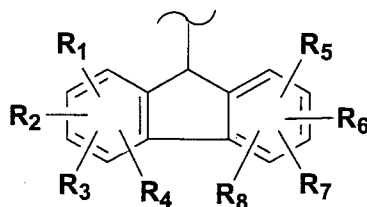
a) Z es diferente de heteroarilo, o

b) en donde Z es heteroarilo, entonces R_{11} es diferente de H y/o R_{10} es diferente de H; o

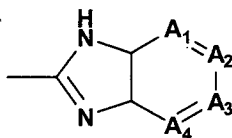
15

(12) en donde la porción tricíclica es

20



entonces $R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7$ y R_8 es diferente de

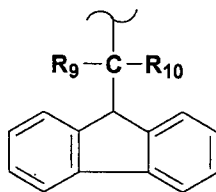


25 en donde A_1, A_2, A_3 y A_4 son seleccionados de CR_a o N, donde R_a

es H o un substituyente; o

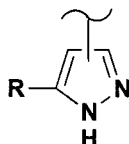
(13) en donde la porción tricíclica es

5



entonces Z es diferente a

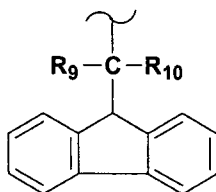
10



en donde R es cicloalquilo C_3-C_6 opcionalmente substituido por alquilo C_1-C_6 o arilalquilo o un homólogo del mismo;

(14) en donde la porción tricíclica es

15

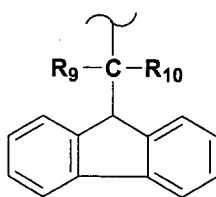


y Z es heteroarilo que contiene o heterociclilo que contiene un átomo de N en el anillo, entonces el heteroarilo o heterociclilo Z no pueden substituirse con un grupo $R'A$ donde R' es heterocíclico o fenilo opcionalmente substituido y A es $(CH_2)_{0-2}(O)_{0-1}$ o $(CR^3R^4)_{0-1}NR^5(CO)_{0-1}$ donde $R^3, R^4 = H$ o $R^3 + R^4$ -imino y $R^5 = H$ o alquilo;

25

(15) en donde la porción tricíclica es

A



5 y Z es diferente a un anillo heterocíclico de 5-7 elementos que contiene N, O y/o S, tal anillo

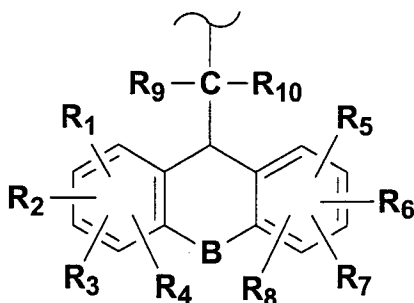
heterocíclico está substituido por —D—A—C(=O)—R^1 donde D es alquilenos ^{1-4}C , O o S,

10 A es un anillo carbocíclico de 3 hasta 7 elementos o un anillo heterocíclico de 5 hasta 7 elementos que contiene N, O y/o S, y

R^1 es OH, alcoxi, o $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ donde R^{10} y R^{11} pueden ser H o alquilo, tal Z y/o también puede ser opcionalmente substituido por 1-3 grupos los cuales pueden ser alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , halo, trihalometilo, CN, o NO_2 ; o

(16) donde la porción tricíclica es

20



en donde B es O u S, entonces

25 a) Z es diferente de dihidrofurilo opcionalmente

substituido o dihidrotienilo opcionalmente substituido,

b) o sí Z es dihidrofurilo opcionalmente substituido o dihidrotienilo opcionalmente sustituido, entonces

1) al menos uno de R_9 y/o R_{10} es diferente de H, o

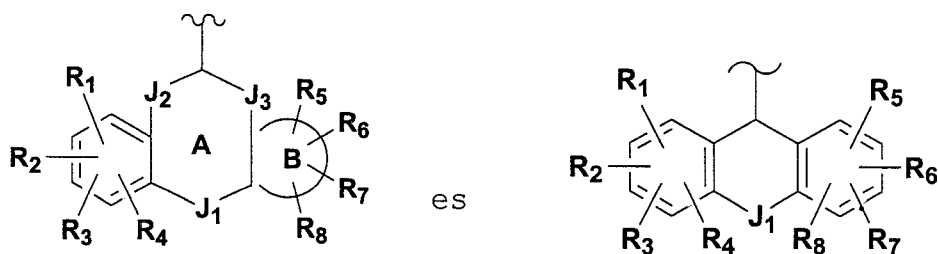
5 2) R_{11} es diferente de H o alquilo inferior.

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque J_1 es O, S, SO, SO_2 , o un enlace.

10 3. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-2, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque B es un anillo piridinilo substituido con arilo o arilo substituido.

15 4. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-2, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque la porción tricíclica:

20



5 25 5. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-4, o un enantiómero, diastereómero,

5

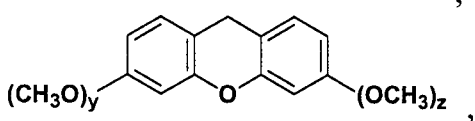
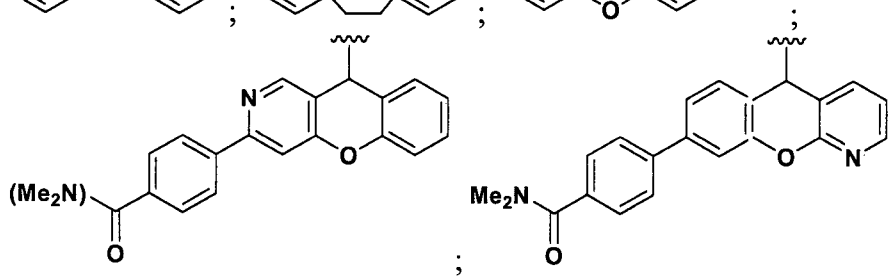
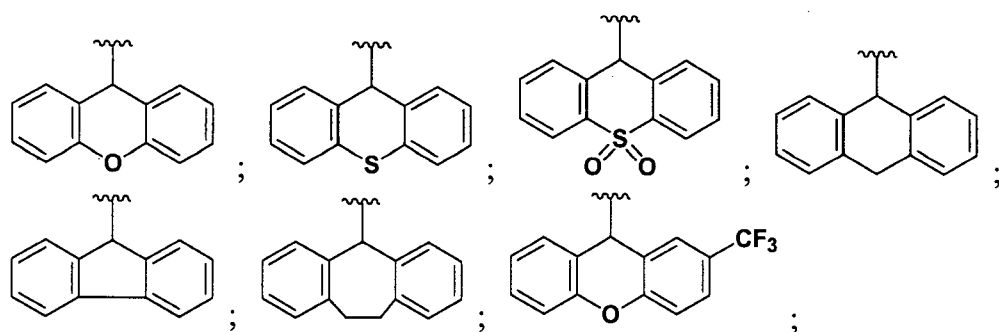


10

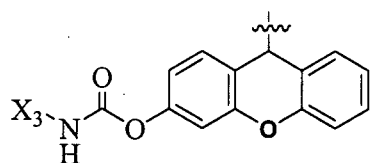
15



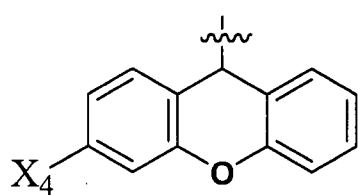
25



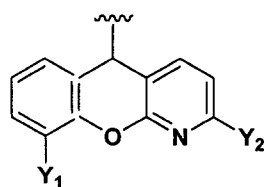
donde z es 0 ó 1 e y es 0 ó 1;



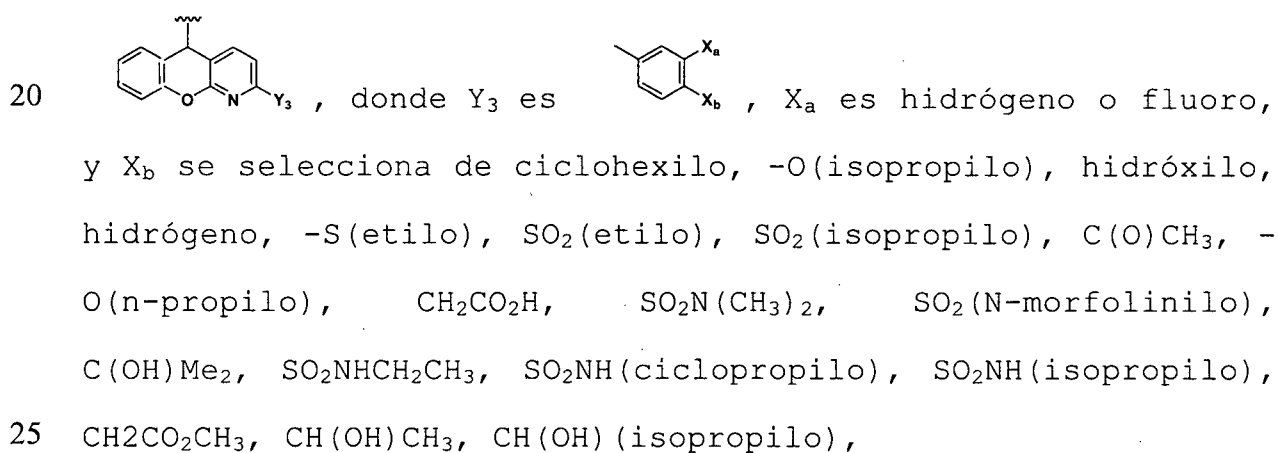
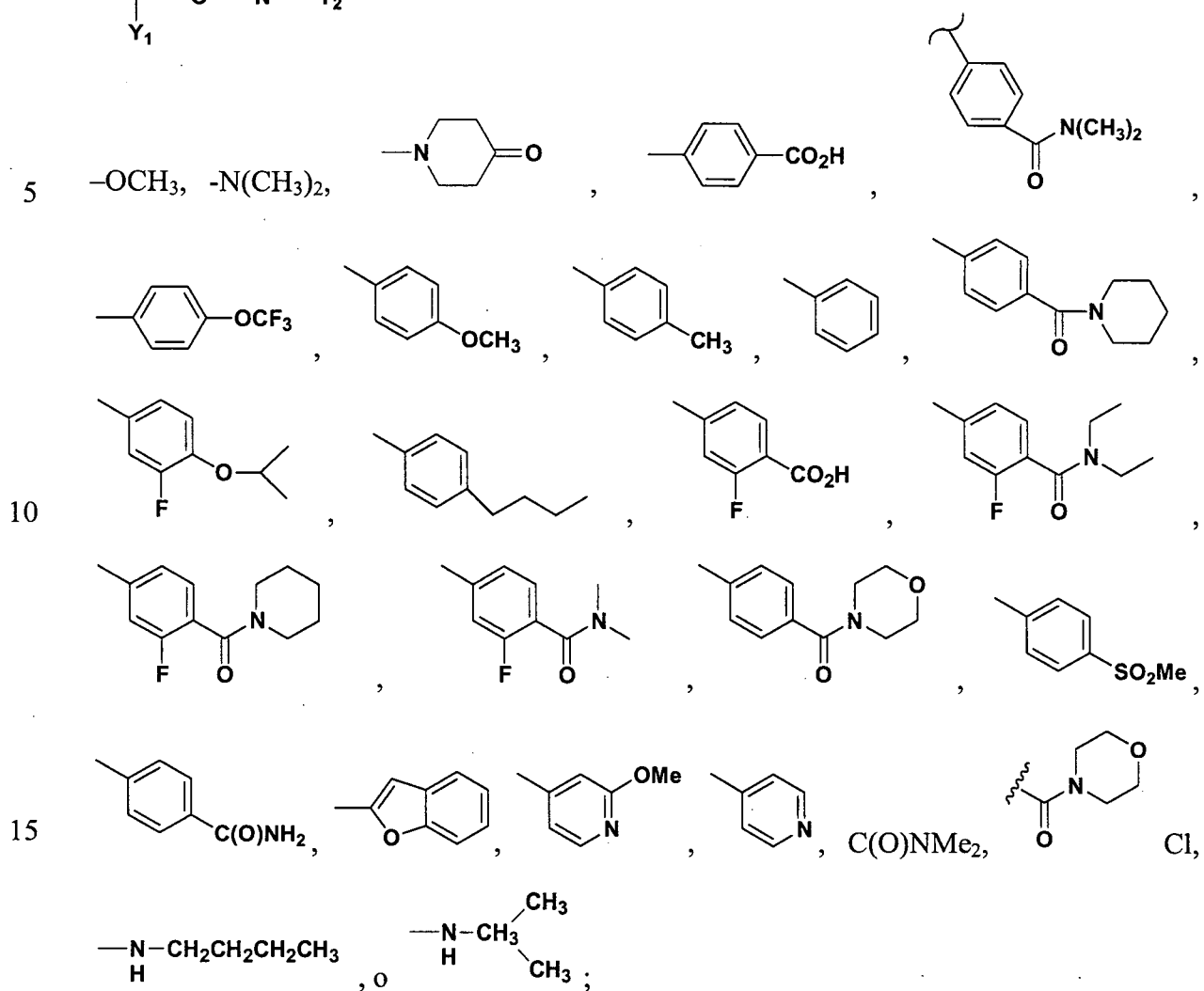
, donde X_3 es bencilo, $(CH_2)_3CH_3$, etilo, $CH_2(2\text{-furilo})$, ciclohexilo, $(CH_2)_7CH_3$, $(CH_2)_2(\text{fenilo})$, $CH_2(2\text{-tienilo})$, $CH_2(4\text{-fluorofenilo})$, terc-butilo, $CH(CH_3)\text{etilo}$, $(CH_2)_2(4\text{-metoxifenilo})$, 4-metoxifenilo, o $CH_2(\text{ciclohexilo})$;



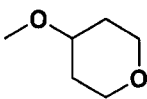
, donde X_4 es $NHC(O)O(\text{ciclohexilo})$, $NHC(O)O(\text{metilo})$, $-C\equiv C-(CH_2)_2CH_3$, $C(O)NHCH_2(\text{fenilo})$, $C(O)CH_3$, $-NHC(O)NH(CH_2)(O)N(Me)_2$, $-NHC(O)NH(CH_2)(N\text{-pirrolidinilo})$,

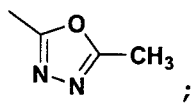


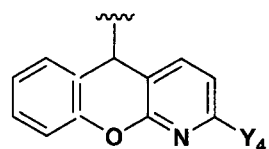
, donde Y_1 es hidrógeno o halógeno; e Y_2 es

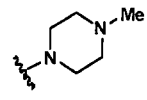


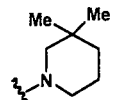
22

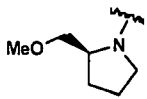
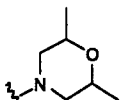
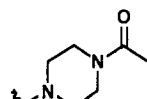
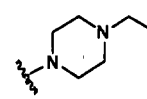
$S(O)CH_3$, , $O(\text{ciclohexilo})$, $O(\text{ciclopentilo})$, y

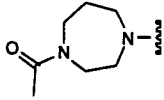
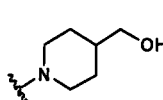
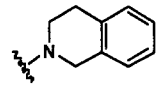
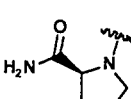
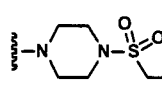
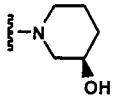
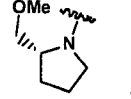


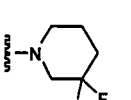
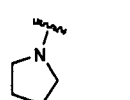
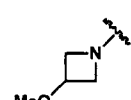
5 , donde Y_4 es NR_aR_b , NEt_2 , piperidina, NMe_2 ,

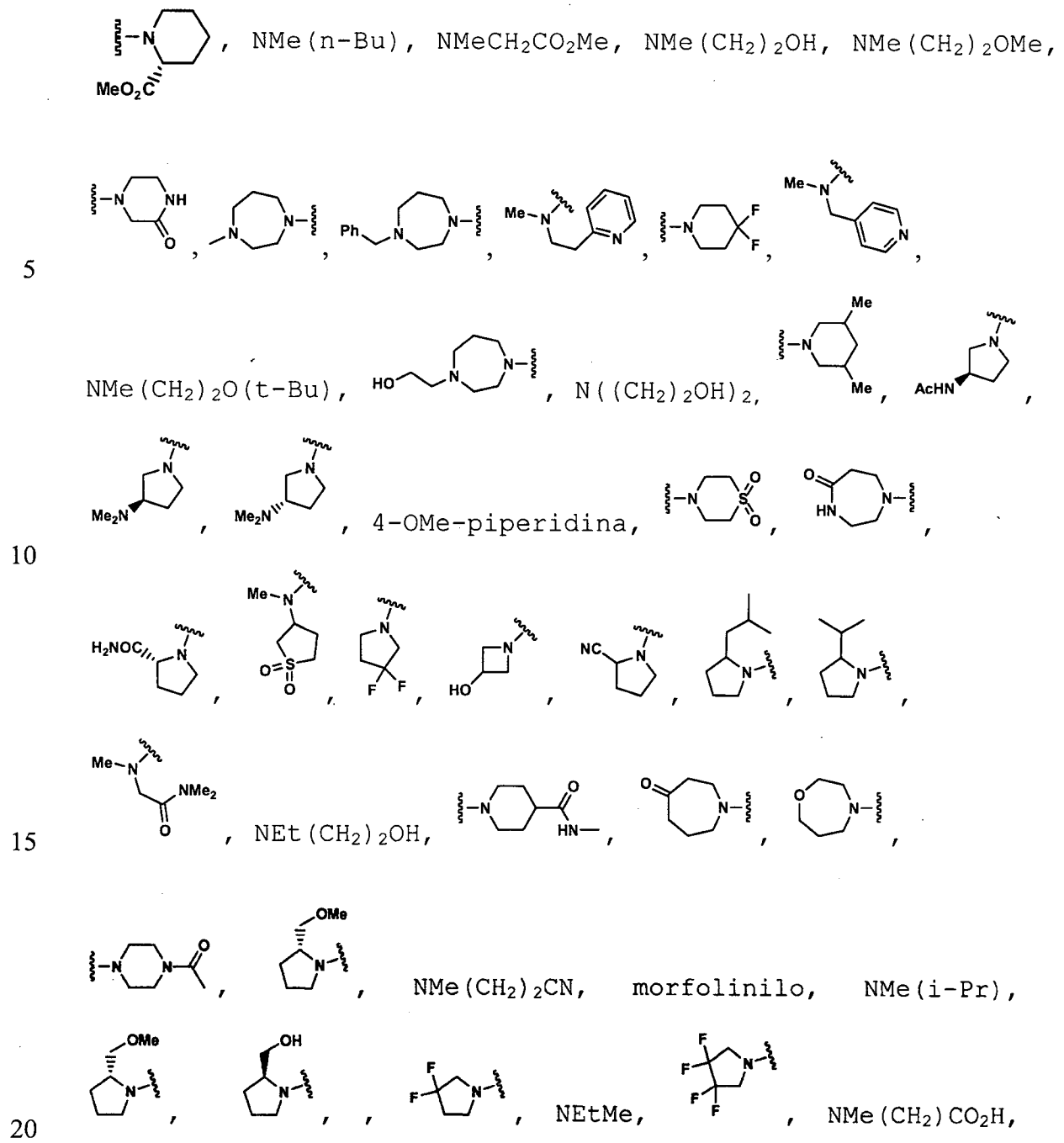
$NMeEt$, pirrolidina, $NHMe$, $NMe(n-Pr)$, $NMe(Bn)$, ,
10 morfolina, $NMe(i-Pr)$, NEt_2 , NMe_2 , piperidina, NEt_2 , NEt_2 ,
piperidina, piperidina, piperidina, $NMe(CH_2)_2CN$, 4-Me-

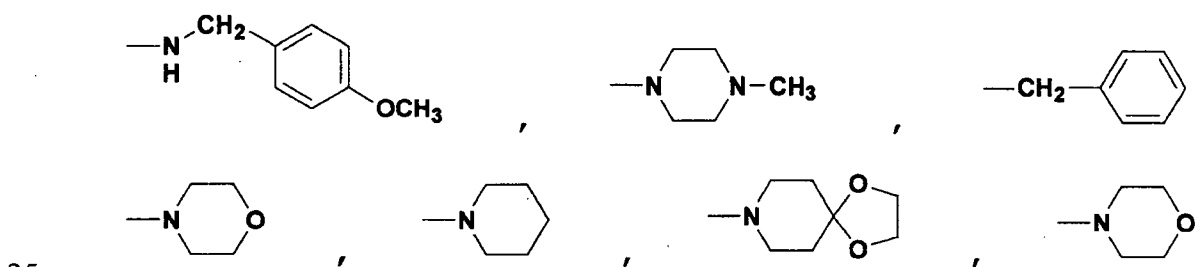
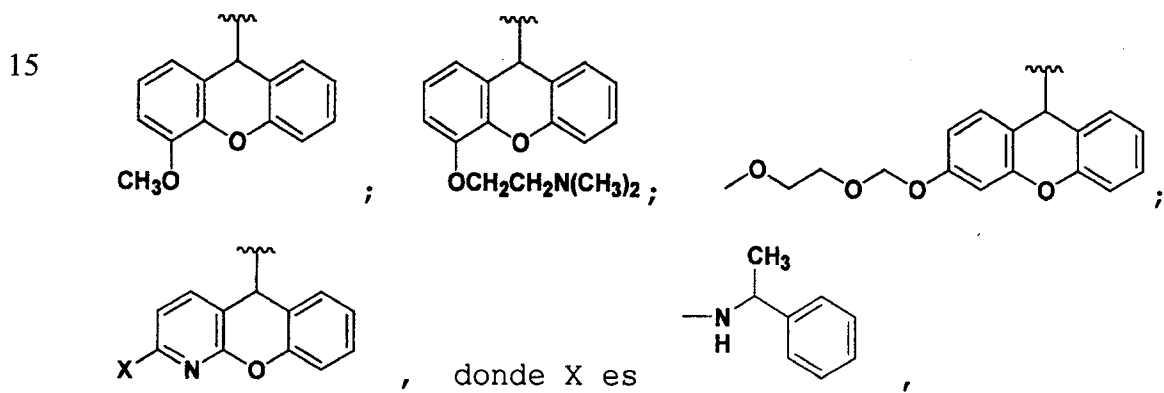
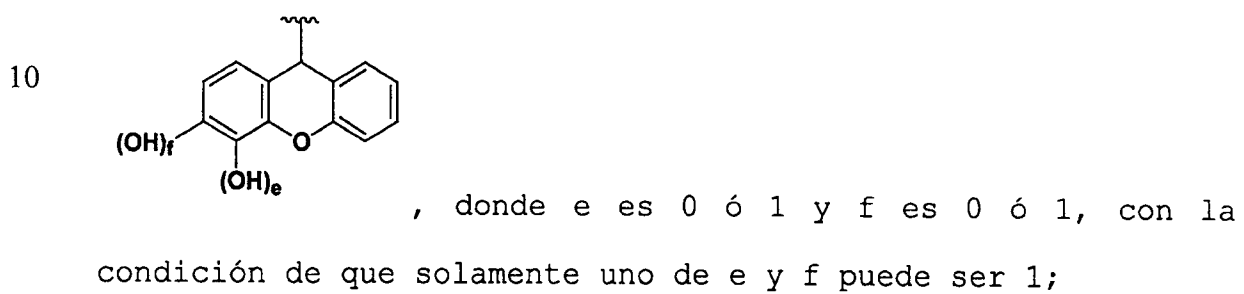
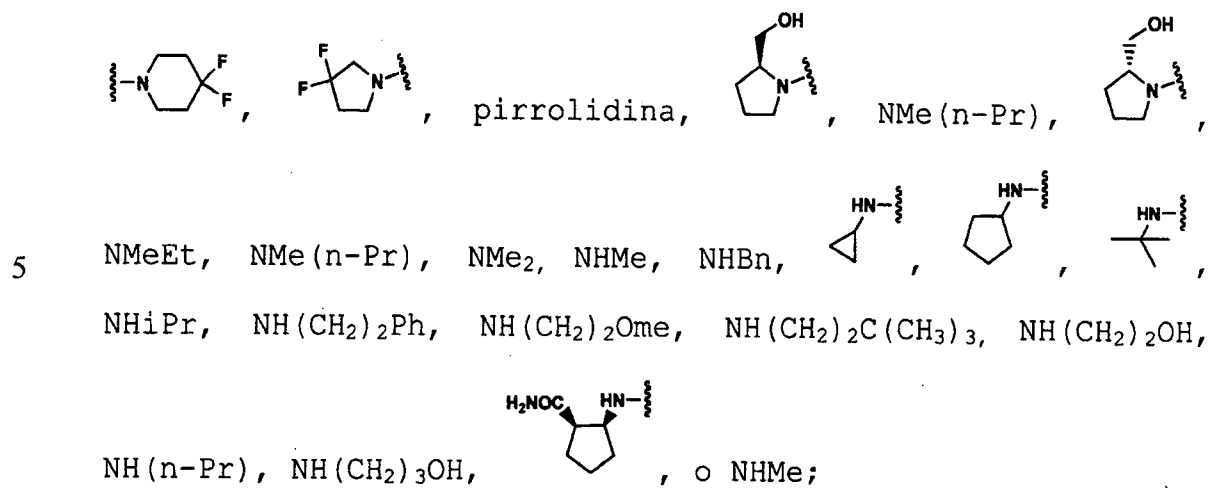
piperidina, 4-OH-piperidina, $NMe(CH_2)_2CH(CH_3)_2$, ,

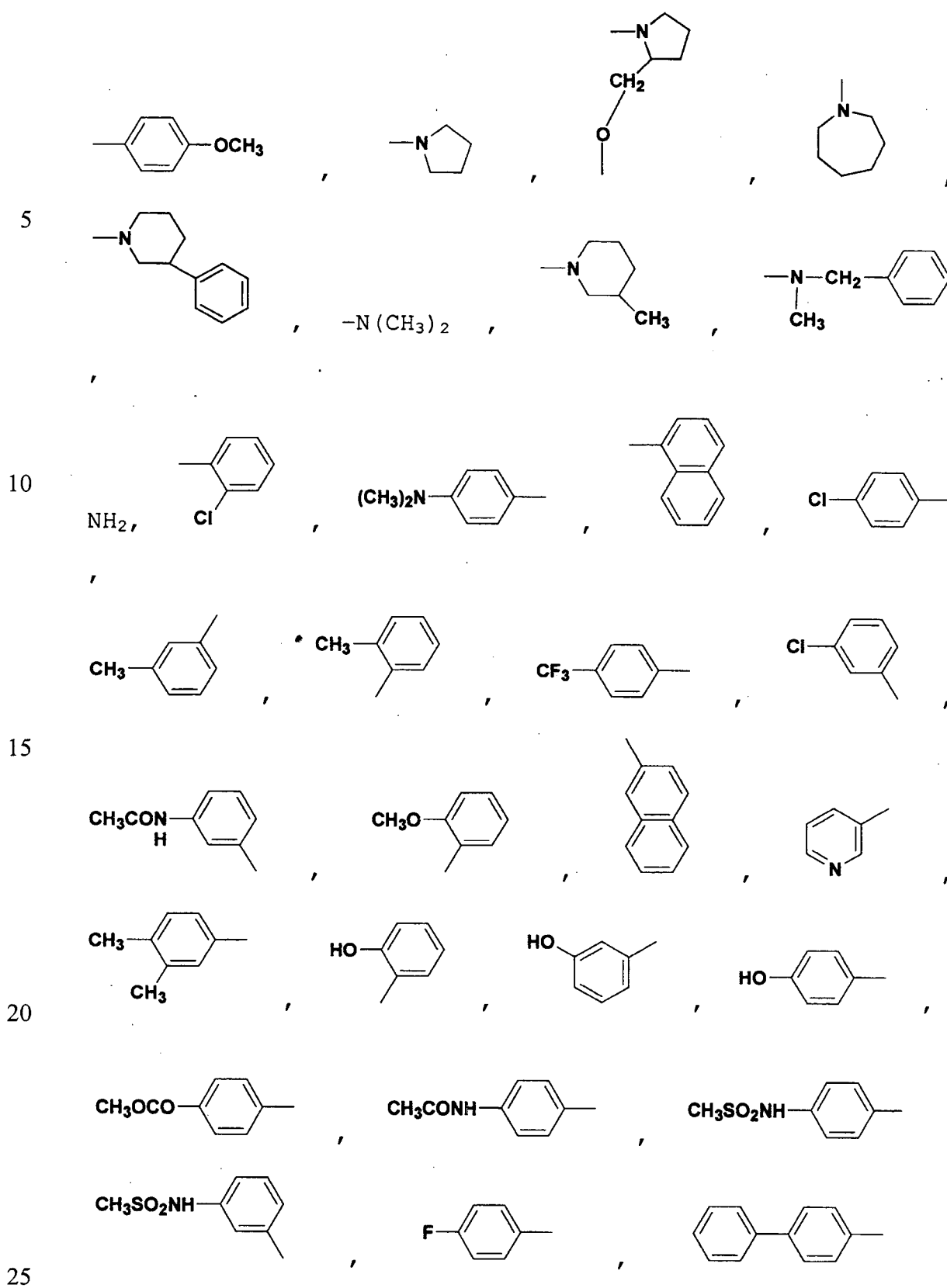
15 , , , , $N(Me)(CH_2)_2Ph$,

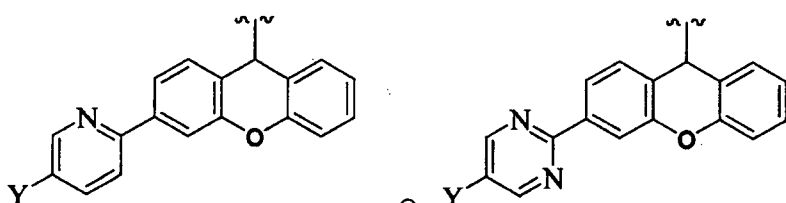
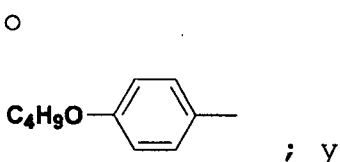
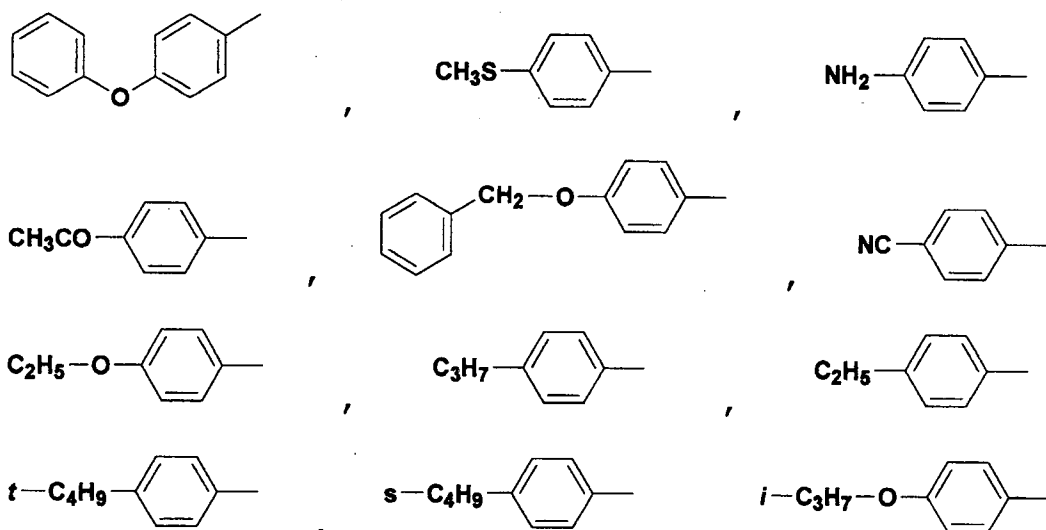
, 4-Bn-piperidina, , , 4-Ph-
20 piperidina, , , , ,

, , , $4-(CF_3)\text{-piperidina}$,









, donde Y es alquilo C₁₋₆, C(O)N(alquilo C₁₋₆)₂, COOH, y Oalquilo C₁₋₆.

7. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-6, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

R₉ y R₁₀ son cada uno independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo, y alquilo sustituido; o junto con el átomo al cual se enlazan, R₉ tomado junto con R₁₀ forman un cicloalquilo C₃₋₆; y

R_{11} es hidrógeno.

8. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-7, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

Z es un grupo heteroarilo o heterociclo de 5 hasta 6 elementos, cada grupo substituido con uno, dos o tres grupos los cuales son los mismos o diferentes y son independientemente seleccionados de hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo substituido, alquenilo, alquenilo substituido, alquinilo, alquinilo substituido, nitro, ciano, OR^c , NR^aR^b , $C(=O)R^a$, CO_2R^a , $C(=O)NR^aR^b$, $-O-C(=O)R^a$, $NR^aC(=O)R^b$, $NR^aC(=O)OR^b$, $NR^aC(=S)OR^b$, $S(O)_pR^c$, $NR^aSO_2R^c$, $SO_2NR^aR^b$, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo;

R^a y R^b son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, alquilo, alquilo substituido, alquenilo, alquenilo substituido, alquinilo, alquinilo substituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heteroarilo, y heterociclo; o (ii) en donde sea posible junto con los átomos a los cuales se enlaza, R^a se toma junto con R^b para formar un anillo de heteroarilo o heterociclo; y

R^c cada que se presenta es independientemente

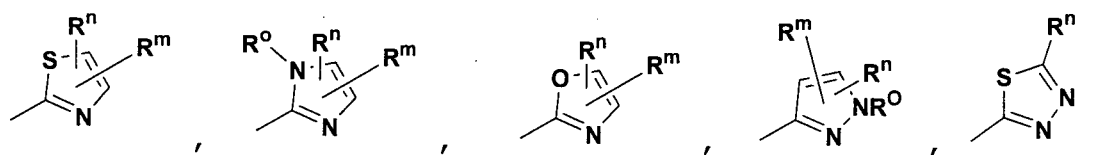
26

seleccionado de alquilo, alquilo sustituido, alqueno, alqueno sustituido, alquino, alquino sustituido, cicloalquilo, cicloalqueno, arilo, heteroarilo, y heterociclo.

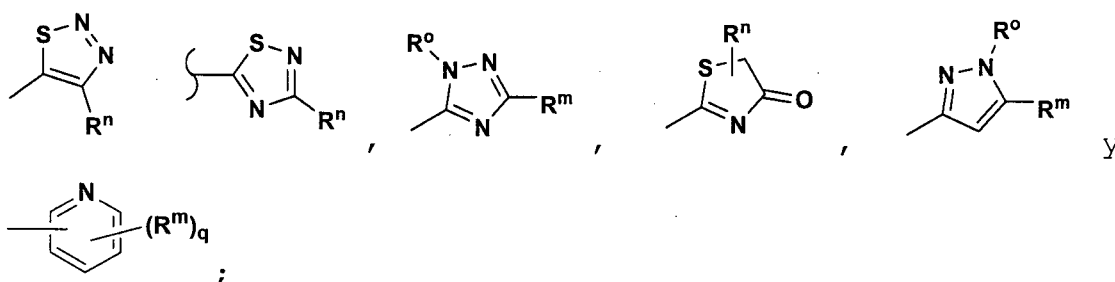
- 5 9. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-8, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

Z se selecciona de:

10



15



- R^m y R^n son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de
- 20 hidrógeno, halógeno, alcoxi, $-\text{COR}_1^a$, $-\text{CO}_2\text{R}_1^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_1^a)(\text{R}_1^b)$, alquilo C_{1-6} , CF_3 , alquilo sustituido, aril- $\text{NHC}(\text{O})$ -arilo, arilo, arilalquilo, CH_2OH , $-\text{SR}_1^a$, $\text{S}(\text{O})_{1-2}\text{R}_1^c$, $\text{N}(\text{R}_1^a)(\text{R}_1^b)$, CH_2F , ciano, cicloalquilo C_{3-6} , y un heteroarilo de 5 hasta 7
- 25 elementos con un heteroátomo seleccionado de N, O o S;

27

R^o es hidrógeno o alquilo C₁₋₆;

R₁^a y R₁^b son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, C(=O)alquilo, CO₂(alquilo), SO₂alquilo, alquenilo, alquenilo sustituido, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo, heterociclo, y cicloalquilo, siempre que R₁^a y R₁^b ambos no son alcoxi, amino, o amino sustituido;

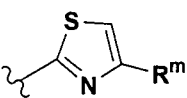
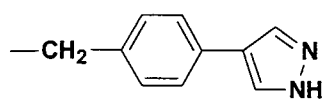
10 o R₁^a y R₁^b, en donde sea posible pueden tomarse junto con el nitrógeno al cual se enlazan los mismos para formar un anillo heteroarilo o cicloheteroalquilo de 5, 6 ó 7 elementos el cual contiene 1, 2 ó 3 heteroátomos los cuales pueden ser N, O, o S;

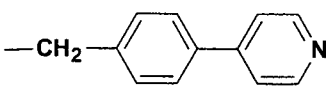
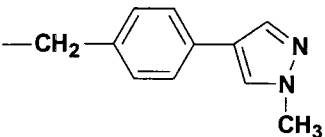
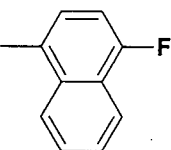
15 R₁^c se selecciona de alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, alcoxi, amino, amino sustituido, heteroarilo, heterociclo, cicloalquilo, y arilo; y

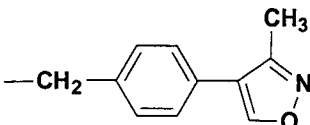
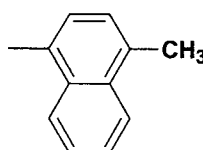
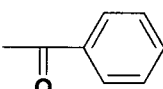
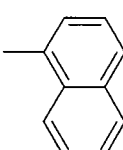
q es 1 ó 2.

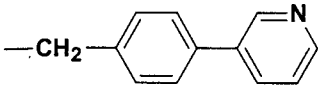
20 10. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-9, o un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

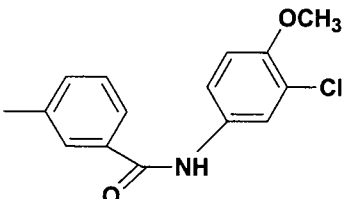
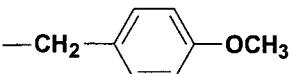
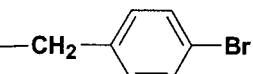
28

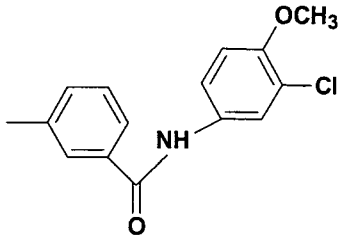
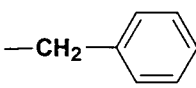
Z es , donde R^m es ,

5 , , ,

, , , ,

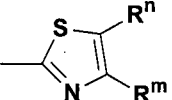
10 , H, CH₃, -CO₂C₂H₅, -CO₂CH₃,

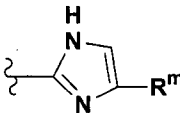
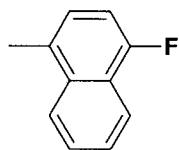
, , ,

15 , ,

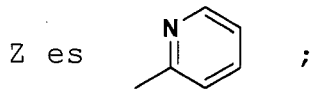
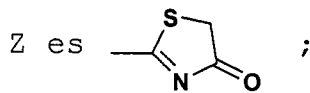
en donde R^n es S(CH₃), S(O)(CH₃), S(O)₂CH₃, y CH₃;

20

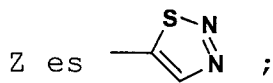
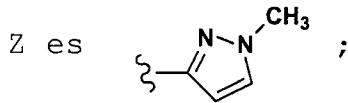
Z es , donde R^n es CH₃, R^m es CH₃;

Z es , donde R^m es  o H;

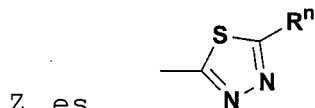
25



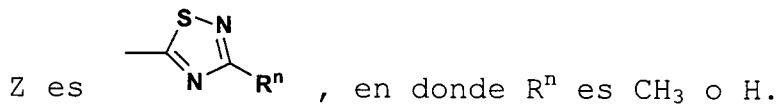
5



10



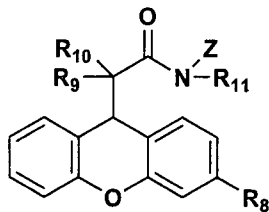
C(O)NH₂, C(O)NH(ciclopropilo), C(O)NHCH₃, C(O)NH₂Et, CH₂OH, S(metilo), N(metilo)₂, CH₂F, ciano, etilo, o ciclopropilo; o



15

11. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 4, o 5-10, caracterizado porque tiene la estructura

20



o un enantiómero, diastereómero, tautómero o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde:

R₈ es hidroxilo, ciano, -C(=O)NR₁₄R₁₅, -CO₂R₁₄, -C(NH₂)=NOH, -NR₁₄C(=O)OR₁₅, -OC(O)NR₁₄R₁₅, -NHC(O)NR₁₄R₁₅, o -NHC(O)R₁₅;

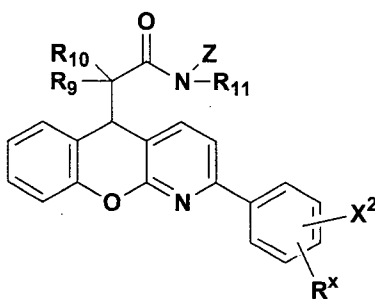
25

R_9 y R_{10} son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, 5 nitro, ciano, $-OR_{14}$, $-NR_{14}R_{15}$, $-C(=O)R_{14}$, $-CO_2R_{14}$, $-C(=O)NR_{14}R_{15}$, $-O-C(=O)R_{14}$, $-NR_{14}C(=O)R_{15}$, $-NR_{14}C(=O)OR_{15}$, $-NR_{14}C(=S)OR_{15}$, $-S(O)_pR_{17}$, $-NR_{14}SO_2R_{17}$, $-SO_2NR_{14}R_{15}$, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; o (ii) junto con el átomo al cual se enlazan, R_9 y R_{10} se toman juntos para formar un 10 grupo carbonilo, alquenilo, alquenilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo;

R_{11} se selecciona de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, $C(=O)$ alquilo, CO_2 (alquilo), SO_2 alquilo, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo, heterociclo, y 15 cicloalquilo; y

Z es un anillo heteroarilo el cual se liga por medio de un átomo de carbono al átomo N.

12. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, o 5-10, caracterizado porque tiene 20 la estructura



un enantiómero, diastereómero, tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde:

X^2 es halógeno, alcoxi, H, o alquilo;

5 R^x es H, $C(O)NR_2^aR_2^b$, OR_2^c , R_2^a , $COOH$, CF_3 , $\begin{array}{c} \text{---NHCR}_2^c \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$, $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---OC---R}_2^c \end{array}$, $\text{---NHSO}_2R_2^c$, arilo, ariloxi, alquilthio, amino, acilo o ciano;

10 R_2^a y R_2^b son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, $C(=O)$ alquilo, CO_2 (alquilo), SO_2 alquilo, hidrógeno, alquenilo, alquenilo sustituido, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo, heterociclo, y
15 cicloalquilo;

o R_2^a y R_2^b , en donde sea posible pueden tomarse junto con el nitrógeno al cual se enlazan para formar un anillo heteroarilo o cicloheteroalquilo de 5, 6 ó 7 elementos el cual contiene 1, 2 ó 3 heteroátomos los
20 cuales pueden ser N, O, o S;

R_2^c se selecciona de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, alcoxi, amino, amino sustituido, heteroarilo, heterociclo, cicloalquilo, y
25 arilo;

R_9 y R_{10} son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, nitro, ciano, OR_{14} , $NR_{14}R_{15}$, $C(=O)R_{14}$, CO_2R_{14} , $C(=O)NR_{14}R_{15}$, $-O-C(=O)R_{14}$, $NR_{14}C(=O)R_{15}$, $NR_{14}C(=O)OR_{15}$, $NR_{14}C(=S)OR_{15}$, $S(O)_pR_{17}$, $NR_{14}SO_2R_{17}$, $SO_2NR_{14}R_{15}$, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; o (ii) junto con el átomo al cual se enlazan, R_9 y R_{10} se toman juntos para formar un grupo carbonilo, alquenilo, alquenilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo; y

R_{11} se selecciona de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, $C(=O)$ alquilo, CO_2 (alquilo), SO_2 alquilo, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo, heterociclo, y cicloalquilo.

13. El uso de un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-12 para la manufactura de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad o trastorno seleccionado de un trastorno endocrino, trastorno reumático, enfermedad del colágeno, enfermedad dermatológica, enfermedad alérgica, enfermedad oftálmica, enfermedad respiratoria, enfermedad hematológica, enfermedad gastrointestinal, enfermedad inflamatoria, enfermedad

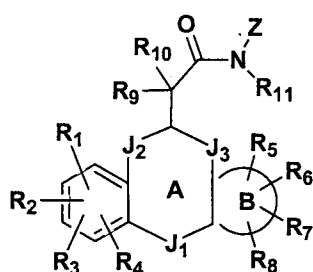
33

inmunitaria, enfermedad neoplásica y enfermedad metabólica.

14. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-12 y un portador farmacéuticamente aceptable para el mismo.

15. Un compuesto de conformidad con la fórmula (I),

10



I

15 un enantiómero, diastereómero, o tautómero del mismo, o un profármaco éster del mismo, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque:

Z se selecciona de heterociclo y heteroarilo;

20 A se selecciona de un anillo carbocíclico de 5 hasta 8 elementos y un anillo heterocíclico de 5 hasta 8 elementos;

B se selecciona de un anillo cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heterociclo, y anillo heteroarilo, en donde el anillo B se fusiona al anillo

A, y el anillo B está opcionalmente substituido por uno hasta cuatro grupos los cuales son los mismos o diferentes y son independientemente seleccionados de R_5 , R_6 , R_7 , y R_8 ;

5 J_1 , J_2 , y J_3 son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente $-A_1QA_2-$;

Q es seleccionado independientemente, cada que se presenta, de un enlace, O, S, S(O), y S(O)₂;

10 A_1 y A_2 son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de un enlace, alquileo C_{1-3} , alquileo C_{1-3} substituido, alquienilo C_{2-4} , y alquienilo C_{2-4} substituido, con la condición de que A_1 y A_2 se eligen de manera que el anillo A sea un anillo carbocíclico de 5 hasta 8
15 elementos o un anillo heterocíclico de 5 hasta 8 elementos;

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , y R_8 son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno,
20 halógeno, alquilo, alquilo substituido, alquienilo, alquienilo substituido, alquinilo, alquinilo substituido, alcoxi, alcoxi substituido, nitro, ciano, OR_{12} , $NR_{12}R_{13}$, $C(=O)R_{12}$, CO_2R_{12} , $C(=O)NR_{12}R_{13}$, $-O-C(=O)R_{12}$, $NR_{12}C(=O)R_{13}$, $NR_{12}C(O)OR_{13}$, $NR_{12}C(S)OR_{13}$, $S(O)_pR_{16}$,
25 $NR_{12}SO_2R_{16}$, dialquilaminoalcoxi,

alcoxialquiloalquiloalquilo, $\text{SO}_2\text{NR}_{12}\text{R}_{13}$, cicloalquilo, cicloalquenilo, cicloalquinilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; y/o (ii) donde sea posible cada uno de $\text{R}_1\text{-R}_8$ se toma junto con cualquiera de $\text{R}_1\text{-R}_8$ localizado en un átomo adyacente para formar un anillo fusionado; y/o (iii) donde sea posible cualquiera de $\text{R}_1\text{-R}_8$ se toma junto con cualquiera de $\text{R}_1\text{-R}_8$ localizado en el mismo átomo para formar un grupo oxo, alquenilo, alquenilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo;

R_9 y R_{10} son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, halógeno, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, nitro, ciano, OR_{14} , $\text{NR}_{14}\text{R}_{15}$, $\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$, CO_2R_{14} , $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{15}$, $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$, $\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{15}$, $\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{15}$, $\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{S})\text{OR}_{15}$, $\text{S}(\text{O})_p\text{R}_{17}$, $\text{NR}_{14}\text{SO}_2\text{R}_{17}$, $\text{SO}_2\text{NR}_{14}\text{R}_{15}$, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo, arilo, y heteroarilo; o (ii) donde sea posible R_9 y R_{10} se toman juntos para formar un grupo oxo, alquilo, alquilo sustituido, alquenilo, alquenilo sustituido, cicloalquilo, cicloalquenilo, o heterociclo;

R_{11} se selecciona de hidrógeno, alquilo, alquilo sustituido, $\text{C}(=\text{O})\text{alquilo}$, $\text{CO}_2(\text{alquilo})$, $\text{SO}_2\text{alquilo}$, alcoxi, amino, amino sustituido, arilo, heteroarilo,

heterociclo, y cicloalquilo;

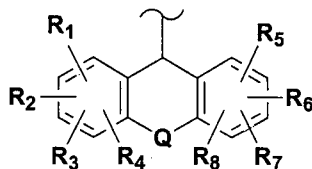
R_{12} , R_{13} , R_{14} , y R_{15} , son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de (i) hidrógeno, alquilo, alquilo
5 sustituido, alqueniilo, alqueniilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido, cicloalquilo, cicloalqueniilo, arilo, heteroarilo, y heterociclo; o (ii) donde sea posible R_{12} se toma junto con R_{13} , y/o donde sea posible R_{14} se toma junto con R_{15} para formar
10 un anillo heteroarilo o heterociclo;

R_{16} y R_{17} , son los mismos o diferentes y cada que se presentan son independientemente seleccionados de alquilo, alquilo sustituido, alqueniilo, alqueniilo sustituido, alquinilo, alquinilo sustituido,
15 cicloalquilo, cicloalqueniilo, arilo, heteroarilo, y heterociclo; y

p es 0, 1 ó 2,

con la condición de que

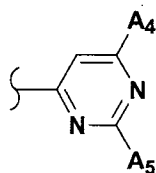
(1) en donde la porción tricíclica en la fórmula I del
20 compuesto es



25 en donde Q es 0 y R_1 hasta R_8 son cada H, entonces

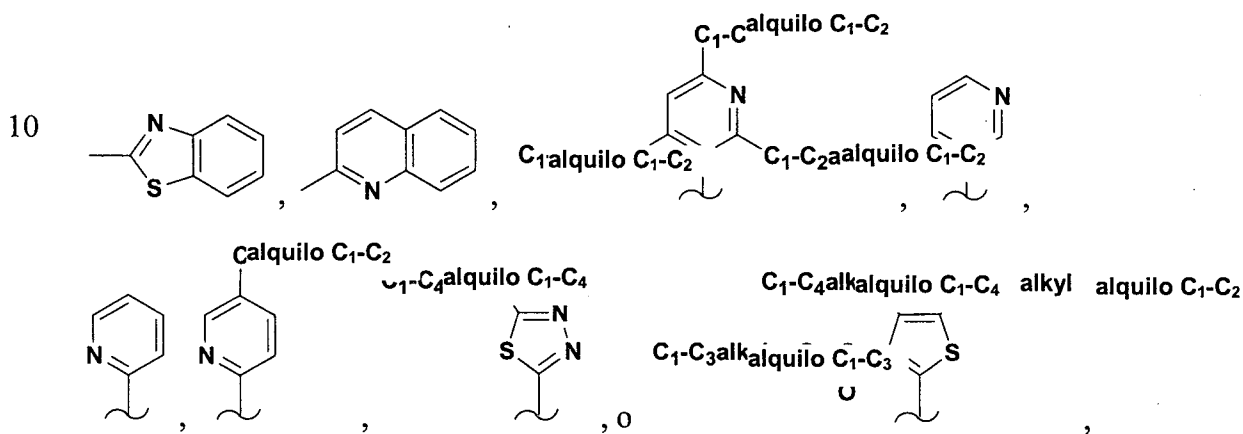
37

(a) Z es diferente de

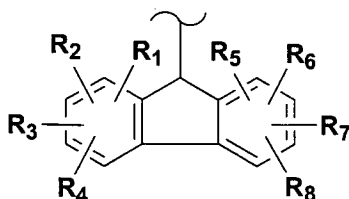


5 en donde A₄ y A₅ son los mismos o diferentes y son independientemente H o alquilo C₁-C₂; o

(b) Z es diferente de



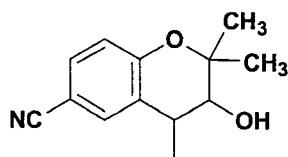
(2) en donde la porción tricíclica es



20 en donde R₁ hasta R₈ son cada uno H, entonces Z es diferente de

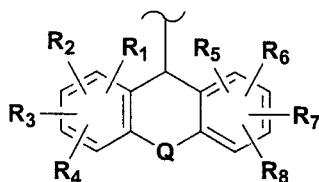
25

38



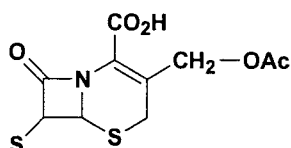
o en donde Z es

- 5 R_{11} es diferente de un alquileo C_1-C_2 substituido;
(3) en donde la porción tricíclica es



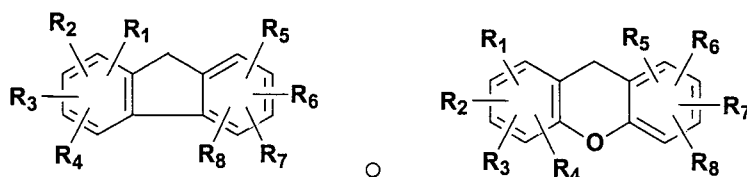
10

en donde Q es S o SO_2 , y R_1 hasta R_8 son cada uno H,
entonces Z es diferente de



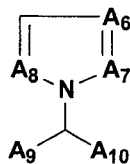
15

- (4) en donde la porción tricíclica es



20

en donde R_1 hasta R_8 son cada uno H,
entonces Z es diferente de



25

en donde A_6 , A_7 y A_8 son independientemente N o CH,

A_9 es $-(CH_2)_d-A_{11}$ en donde d es 0 hasta 4;

A_{11} es OH, CO_2H , 5-tetrazolilo, $-COO(\text{alquilo } C_1-C_4)_{n_a}$ o CN-

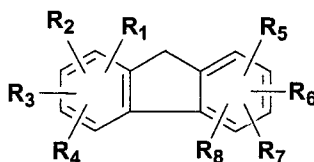
;

5

n_a es 0 hasta 4; y

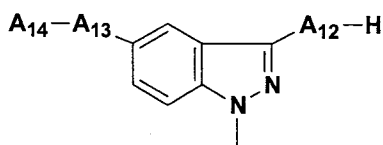
A_{10} es alquilo C_4-C_7 de cadena recta;

(5) en donde la porción tricíclica es



10

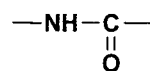
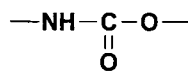
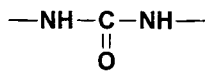
entonces Z es diferente de



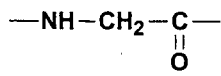
15

en donde A_{12} es O u S; y

A_{13} es O o un NH,



, o



,

en donde los 3 últimos grupos se unen al anillo aromático

20

a través del átomo N;

A_{14} es H,

alquilo,

cicloalquilo C_3-C_7 ,

fenilo, naftilo, antranilo o fluorenilo opcionalmente

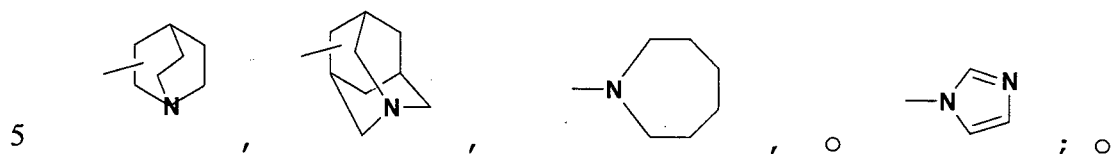
25

substituido, o

40

un quinolin-2-ilmetoxi o piridin-ilmetoxi; o

Z es diferente de

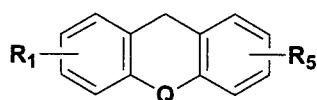


Z es diferente de



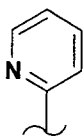
en donde R^{10} es un sistema de anillo azacíclico no aromático o azabiccíclico no aromático;

15 (6) donde la porción tricíclica es



20 Q es -O-, -S-, -C(R^3R^4)-, -CH₂CH₂-, -CH=CH-CH₂-, -CH₂-CH=CH-, -CH₂-(C=O)-, -(C=O)-CH₂-, CH₂CH₂CH₂-, -CH=CH-, -O-CH₂-, -CH₂-O-, -O-CH₂-O-, -CH₂-O-CH₂-, -S-CH₂-, -CH₂-S-, -CH(R^5)CH₂-, -CH₂CH(R^5)-, -(C=O)-, o -(S=O)- en donde R^3 y R^4 independientemente son hidrógeno o alquilo C₁₋₇; y en donde R^5 es alquilo C₁₋₇ o fenilo;

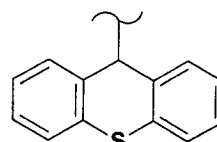
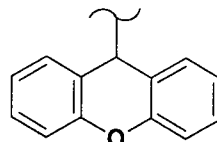
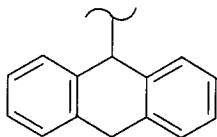
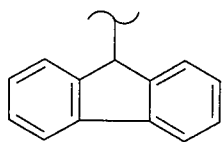
25 entonces Z es diferente de



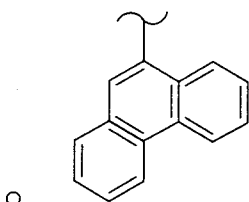
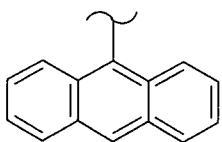
; o

(7) en donde la porción tricíclica es

5



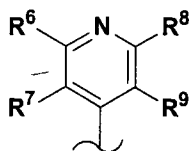
10



o

entonces Z es diferente de

15



en donde:

R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente seleccionados de
 zalquilo C₁-C₆, halo-alquilo C₁-C₆ que contiene 1 hasta 5
 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, nitro-alquilo
 20 C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alcanoilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆,
 alcoxicarbonilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₂-alquilo C₁-
 C₆, alcansulfinilo C₁-C₂-alquilo C₁-C₆, alcansulfonilo C₁-C₂-
 alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, halo-alquenilo C₂-C₆ que
 contiene 1-5 átomos de halógeno, alquinilo C₂-C₆, halo-
 25 alquinilo C₂-C₆ que contiene 1-5 átomos de halógeno,

42

cicloalquilo C₃-C₇ y halógeno; o

R⁶ y R⁷, tomados juntos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 hasta 7 elementos saturado o no saturado el cual puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de O y S; y

R⁸ y R⁹ son cada uno independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y halógeno.

10

15

20

25

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

2009/0004

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 18,609
FECHA : MARZO 6 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345-00002-0000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345-00002-0000

Fecha: 2009-03-26 17:02:38 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 45

***** CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	14472172	06/03/2009	75,329,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	100,000.00
		TOTAL :	\$ 100,000.00

SON: CIENTO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

NIT : 800176089-2

2009/0001

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 2,313
FECHA : ENERO 13 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345- -00002-0000

Fecha: 2009-03-26 17:02:38 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 45

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	RECIBO DE CAJA			2233	09/01/2009	5,904,000.00

***** CONCEPTO *****

CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I 998 VALOR COMPLEMENTO TARIFA A#0 ANTR	10,000.00
TOTAL :	\$ 10,000.00

SON: DIEZ MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

2009/004

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 18,591
FECHA : MARZO 6 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345- -00002-0000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-020345- -00002-0000

Fecha: 2009-03-26 17:02:38 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 45

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	14472172	06/03/2009	75,329,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.