

Señor Director

NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 15-269914- -00004-0000

Fecha: 2016-05-02 16:12:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 31

Trámite: 011 Evento: 378 Actuación: 523

Referencia: Expediente No. 15.269.914

Asunto: Solicitud de patente para: "NUEVOS COMPUESTOS POLICÍCLICOS
ANTIBACTERIALES QUE SE UNEN SELECTIVAMENTE A ENZIMAS
BACTERIANAS".

Solicitante: PTC THERAPEUTICS, INC.

Fecha de solicitud: 11 de Noviembre de 2015

RESPUESTA A PRIMER EXAMEN DE PATENTABILIDAD

ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI, identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, doy respuesta al Oficio 15281, notificado por fijación en lista el 22 de Diciembre de 2015, para lo cual pedí plazo adicional el 16 de Marzo de 2016.

I. MODIFICACIONES AL PLIEGO REIVINDICATORIO

En respuesta al examen de patentabilidad el solicitante decide aportar un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones en las que se han incluido las siguientes modificaciones:

1. Se ha modificado la reivindicación 1 de manera que el compuesto de fórmula (II) corresponde a la estructura del compuesto de fórmula (II) como originalmente se presenta en el capítulo descriptivo.

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel. (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 652 - Tel. (57-4) 604 4794 Ext. 6729 / 6731 - Fax: (57-4) 604 4731 - COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

2. El título fue modificado de la siguiente forma: *"NUEVOS COMPUESTOS POLICÍCLICOS ANTIBACTERIALES QUE SE UNEN SELECTIVAMENTE A ENZIMAS BACTERIANAS"* de manera que ahora hace referencia directa al alcance de la invención.

3. Se ha modificado la reivindicación 4 de manera que se menciona "en donde en cada instancia de alquilo C_{1-8} en cada R_1 anterior se selecciona de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo o n-octilo" y por tanto se limita selectivamente el sustituyente "alquilo".

4. Se ha modificado la reivindicación 7 de manera que los compuestos allí nombrados cumplen con las normas IUPAC.

5. Se ha eliminado la reivindicación 8, de manera que el nuevo pliego reivindicatorio no contiene materia que pueda no estar soportada en la descripción de la presente solicitud.

6. Se ha modificado la reivindicación 9 de manera que el excipiente ha sido definido como "el excipiente se selecciona del grupo que consiste en un transportador, un solvente, un estabilizante, un adyuvante, un diluyente, un agente desintegrante, un agente de unión, un agente lubricante o una combinación de los mismos.

7. Se ha adicionado la reivindicación 11 (dependiente de la 1) que contiene compuesto que previamente hacían parte de la reivindicación 1 y que por tanto, está debidamente soportada.

8. Se ha adicionado la reivindicación 12 (dependiente de la 1) que contiene compuesto que previamente hacían parte de la reivindicación 1 y que por tanto, está debidamente soportada.

Estas modificaciones se ajustan al artículo 34 de la Decisión 486 de 2000 y no constituyen una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

A pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud

II. EN CUANTO A LA SUPUESTA FALTA DE CLARIDAD

1. Con respecto a la objeción formulada a la reivindicación 4 por falta de concisión, manifestamos nuestro desacuerdo dado que dicha reivindicación incluye la definición de los sustituyentes de manera apropiada dado que incluye la lista de posibles compuestos para grupo químico y por tanto es clara. Adicionalmente, la reivindicación 4 ha sido modificada, de manera que ahora es más clara y más selectiva con respecto al uso del término “alquilo”.
2. Con respecto a la objeción formulada a la reivindicación 9 por falta de claridad en la definición de las características técnicas de la composición farmacéutica, se aclara en primer lugar que de los términos señalados por el Examinador sólo “excipiente” se utiliza. Sin embargo, el término “excipiente” es normalmente bien conocido por una persona versada en la materia y así mismo, fue definido en el capítulo descriptivo al igual que lo recita la publicación internacional PCT/US2012/052882. De igual manera cabe resaltar que la reivindicación 9 fue modificada de manera que se ha limitado el alcance del excipiente contenido en la composición farmacéutica reivindicada.
3. Con respecto a la objeción formulada a las reivindicaciones 1 a 3 por falta de concisión, manifestamos nuestro desacuerdo ya que como se puede observar en el nuevo pliego reivindicatorio, la reivindicación 1 ha sido modificada con el fin de darle mayor claridad y precisión al grupo tipo Markush que conforman la lista de posibles sustituyentes. Adicionalmente, es importante recordar que como lo menciona la GUÍA PARA EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTE DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD “los ejemplos están meramente a ser destinados a describir las realizaciones preferidas y no deben ser considerados como limitativos de la invención”. Finalmente, cabe resaltar que dichas reivindicaciones se encuentran debidamente soportadas en la descripción y en la solicitud internacional WO’228, como se muestra a continuación:

	Sustituyente	Soporte sobre el documento WO 228
Reivindicación 1	X	Página 8, líneas 15-23
	Y ₁	Página 8, línea 24
	Y ₂	Página 8, líneas 25-26
	Z	Página 9, línea 1
	R ₁	Página 9, línea 2- página 10,

		línea 22
	R ₃	Página 10, líneas 29-30
	R ₄	Página 10, líneas 31-33
	R ₅	Página 11, líneas 1-2
	R ₆	Página 11, línea 3
	R ₇	Página 11, líneas 4-5
	R ₈	Página 11, líneas 6-7
	R ₉	Página 11, líneas 8-9
	R ₁₀	Página 11, líneas 10-11
	R ₁₁	Página 11, líneas 12-13
	R ₁₂	Página 11, líneas 14-16
	R ₁₃	Página 11, línea 17
	R ₁₄	Página 11, líneas 18-21
	R ₁₅	Página 11, líneas 22-30
	R ₁₆	Página 11, línea 31 – página 12, línea 8
	R ₁₈	Página 12, líneas 19-20
	R ₁₉	Página 12, línea 21
Reivindicación 3	R ₃	Página 10, líneas 29-30
	R ₄	Página 10, línea 31, página 17 líneas 9 y 14

Adicionalmente, cabe resaltar que las nuevas reivindicaciones 10 y 12 son dependientes de la reivindicación 1, con algunos sustituyentes indicados anteriormente como permitidos otros que están debidamente soportados en el capítulo descriptivo de la presente invención.

III. EN CUANTO A LA SUPUESTA FALTA DE SOPORTE EN LA DESCRIPCIÓN

1. Es importante destacar que la tabla anteriormente divulgada muestra el suficiente soporte para cada uno de los sustituyentes mostrados en la estructuras de los compuestos de las reivindicaciones 1 y 3. Adicionalmente, se puede encontrar abundantes datos experimentales en las tablas 1 a 9 del capítulo descriptivo que muestran la eficacia de varios compuestos frente a varias infecciones bacterianas. Con base en el soporte directo de la descripción y la gran cantidad de datos experimentales, una persona normalmente versada en la materia podría entender fácilmente el alcance de la presente invención. Más aún, una persona versada en la materia estaría en la capacidad de extender los ejemplos específicos (y

sus resultados de la prueba) para abarcar todos los compuestos que caen dentro del alcance de las reivindicaciones sin una carga excesiva. Por lo tanto, el pliego reivindicatorio se encuentra enteramente soportado en la descripción de la presente solicitud.

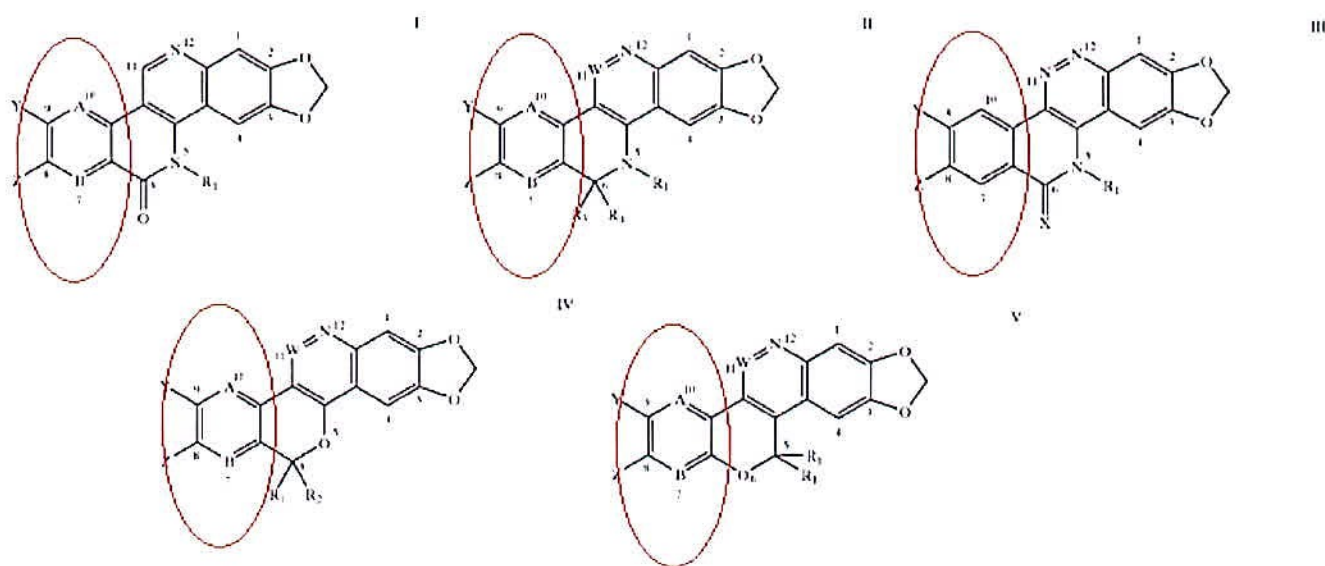
IV. ESTADO DE LA TÉCNICA

Su despacho determinó dos documentos como relevantes para realizar el análisis de patentabilidad de la presente patente de invención:

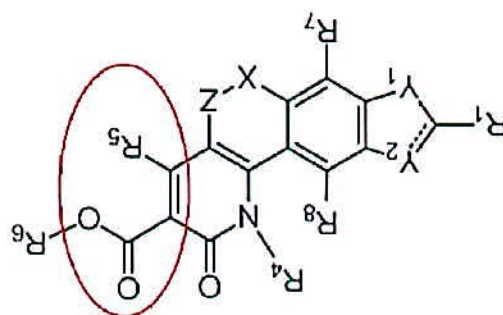
1. D1, referido al documento US 20050009825 titulado *"Cytotoxic agents"* que se relaciona con compuestos inhibidores de la topoisomerasa I y/o II, que muestran actividad citotóxica.
2. D2, referido al documento Ramesh, D et al. Indian Journal of Chemistry-Section B Vol.47B(05), titulado *"Synthesis of novel naphtho[2,1-b]furo[3,2-b]pyridine derivatives as potential antimicrobial agents"* que divulga la síntesis y caracterización de compuestos derivados de nafto[2,1-b]furo[3,2-b]piridina útiles como agentes antimicrobianos.

EN CUANTO A LA SUPUESTA FALTA DE NIVEL INVENTIVO

1. Las estructuras base de los compuestos discutidos en D1 y aquellos incluidos en la reivindicación 1 son ampliamente diferentes. Por ejemplo, todos los compuestos de las fórmulas I a V de D1 requieren una estructura de anillo fusionado que simplemente no está presente en las estructuras de las reivindicaciones de esta invención. Específicamente, los compuestos de las fórmulas I a V de D1 presentan la siguiente estructura:

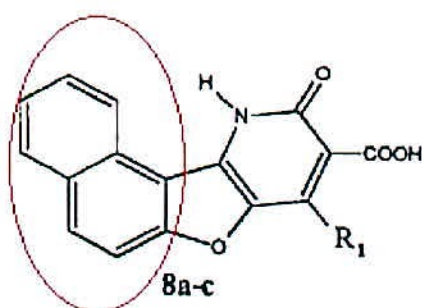


En contraste, la reivindicación 1 de la presente invención no incluye una estructura de anillos fusionados en una ubicación similar dentro de la molécula, como se puede ver a continuación (se rota la molécula de la fórmula II de la reivindicación 1 para ilustrar dicha diferencia)

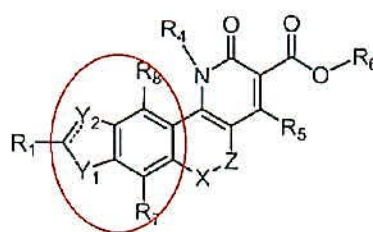


2. Una persona normalmente versada en la materia podría entender que al modificar esta porción básica de la estructura del compuesto divulgado en D1, podría indudablemente resultar en un diferente efecto sobre la actividad biológica *in vivo*. Incluso, a pesar de que el documento D1 no discute ningún resultado biológico, una persona versada en la materia hubiera esperado que sin importar los resultados de actividad biológica, dichos resultados cambiarían cuando se realice dicha modificación tan drástica en la estructura de los compuestos discutidos en D1. Por lo tanto, una persona versada en la materia, no se habría visto motivada a realizar dichas modificaciones sobre los compuestos de D1 para obtener los compuestos reivindicados considerando que D1 no sugiere dichas modificaciones.

3. D2 no cubre las deficiencias de D1, ya que los compuestos de D2 requieren un anillo de naftaleno no-sustituido fusionado con un anillo carboxílico en contraste con el anillo heterosustituido de la reivindicación independiente 1. Una persona versada en la materia no habría podido esperar que compuestos con esta estructura presentaran dianas biológicas similares o actividad similar.



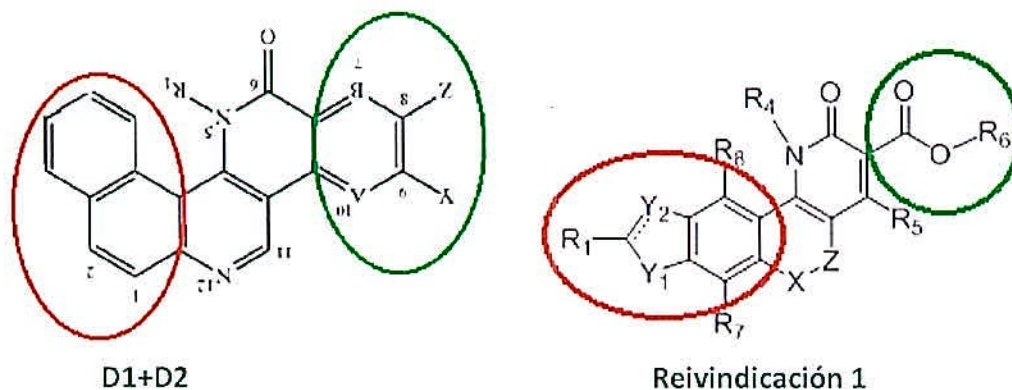
Compuesto de D2



Compuesto de reivindicación 1

4. Si una persona versada en la materia tomara la iniciativa de modificar los compuestos de D1 de acuerdo con las enseñanzas de D2 (para lo cual no tendría ninguna motivación), el

resultado sería una estructura completamente diferente a la estructura mostrada de los compuestos reivindicados en la presente invención. A continuación se muestra la comparación de la estructura obtenida por la combinación de los documentos D1 y D2 en contraste con la estructura de los compuestos que hacen parte de la reivindicación independiente 1.



Como se puede observar, el resultado anterior muestra que la modificación de la estructura del compuesto divulgado en D1 con base en D2 conlleva a un compuesto diferente del aquel mencionado en las reivindicaciones de la presente invención. Una persona versada en la materia hubiese podido entender que tal molécula resultante tendría efectos impredecibles. Por tanto, una persona normalmente versada en la materia no se habría visto motivada a modificar las estructuras de D1 con base en las enseñanzas de D2 con una expectativa razonable de obtener compuestos de la misma estructura como los que se divulgan en la presente invención.

V. PETICIÓN

1. Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por la Dirección de Nuevas Creaciones, se solicita proceder al otorgamiento de la solicitud de patente.
2. De manera subsidiaria, y en caso de que la Dirección de Nuevas Creaciones tenga observaciones adicionales a la patentabilidad del invento, solicito emitir un nuevo requerimiento en el marco del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000.

VI. ANEXOS

1. Sustitución de poder otorgada por LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ a ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI.

2. Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones.

Señor Director,



ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI
C.C. 79.780.910 de Bogotá
T.P. 114.908

Señor Director

NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria Y Comercio

E. S. D.

Asunto : Solicitud de patente para: **COMPUESTOS ANTIBACTERIANOS Y MÉTODOS PARA SU USO**
Expediente : **15.269.914**
Solicitante : **PTC THERAPEUTICS, INC.**

Yo, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, mayor de edad, domiciliada en Bogotá, D.C., identificada con la cédula de ciudadanía No. 35.456.344 de Usaquén y Tarjeta Profesional de Abogado número 23.555 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando como apoderada de la sociedad **PTC THERAPEUTICS, INC**, mediante el presente escrito sustituyo el poder a ANDRES RINCON USCATEGUI, identificado con cédula de ciudadanía No. 79.780.910 de Bogotá, y Tarjeta Profesional No. 114.908 del Consejo Superior de la Judicatura, para que en nombre de la sociedad **PTC THERAPEUTICS, INC**, continúe con el trámite de la solicitud de patente indicada en la referencia.

ANDRÉS RINCON USCATEGUI, queda facultado para interponer recursos, transigir, conciliar, desistir, cancelar, recibir, renunciar, sustituir y revocar las sustituciones, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

Sírvase reconocerle personería en los términos y para los fines del presente mandato judicial.

Señor Director,

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
T.P.A. No. 23.555 del C.S. de la J
C.C. No. 35.456.344 de Usaquén

Acepto:

ANDRES RINCON USCATEGUI
ANDRES RINCON USCATEGUI
T.P.A. No. 114.908 del C.S. de la J
C.C. No. 79.780.910 de Bogotá

NCA/SGD/COLO-15565-841-007-3

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

BOGOTÁ - Edificio Sisko - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 652 - Tel (57-4) 604 4794 Ext. 6729 / 6731 - Fax: (57-4) 604 4731 - COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com





NOTARIA SEXTA DE BOGOTA

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogotá, D.C.

Ante el

29 ABR 2016

NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE
BOGOTÁ D.C.

Compareció (aron)

*Luz Clemencia
Gonzalez de Perez*

Quien(es) exhibió(eron) la(s) C.C.

*CC + 35.456.344
TP + 23.555*

Y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparece(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que al contenido del mismo es cierto.

En constancia se firma esta diligencia.

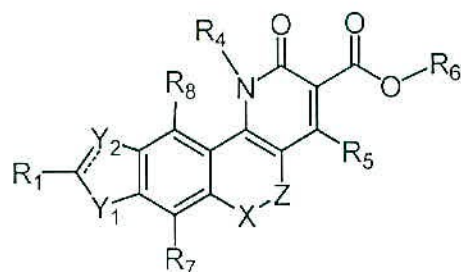
*Luz Clemencia Gonzalez
TP + 23555 255*



8

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

1. Un compuesto de Fórmula (II):



(II)

en el cual

x es un enlace, N(R₁₄), S, O, -CH(R₉)-, -CH(R₉)-CH(R₁₀)-, -CH(R₉)-CH(R₁₀)-CH(R₁₁)-, -C(R₉)=C(R₁₀)-, -C(R₉)=C(R₁₀)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-C(R₁₀)=C(R₁₁)-, -O-CH(R₁₀)-, -CH(R₉)-O-, -N(R₁₄)-CH(R₁₀)-, -CH(R₉)-N(R₁₄)-, -S-CH(R₁₀)-, -CH(R₉)-S-, -O-CH(R₁₀)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-O-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-CH(R₁₀)-O-, -N(R₁₄)-CH(R₁₀)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-N(R₁₄)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-CH(R₁₀)-N(R₁₄)-, -S-CH(R₁₀)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-S-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-CH(R₁₀)-S-, -O-C(O)-CH(R₁₁)-, -C(O)-O-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-O-C(O)-, -CH(R₉)-C(O)-O-, -N(R₁₄)-C(O)-CH(R₁₁)-, -C(O)-N(R₁₄)-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-N(R₁₄)-C(O)-, -CH(R₉)-C(O)-N(R₁₄)-, -S-C(O)-CH(R₁₁)-, -C(O)-S-CH(R₁₁)-, -CH(R₉)-S-C(O)- o -CH(R₉)-C(O)-S-;

Y₁ es -N(R₁₂)- o -O-;

Y₂ es -C(R₁₃)-, -N(R₁₂)- o -O-; en el que la línea discontinua representa un doble enlace que está presente cuando Y₂ es -C(R₁₃)- y ausente cuando Y₂ es -N(R₁₂)- o -O-;

Z es N(R₁₄), S, O, C(O) o -CH(R₃)-;

R₁ es hidrogeno, halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, C₁₋₈alquilo, hidroxilo-C₁₋₈alquilo, halo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi, halo-C₁₋₈alcoxi, C₁₋₈alquilo-tio, carboxilo, C₁₋₈alquilo-carbonilo, C₁₋₈alcoxi-carbonilo, amino-carbonilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino, (C₁₋₈alquilo)₂-amino, C₂₋₈alquenilo-amino, (C₂₋₈alquenilo)₂-amino, C₂₋₈alquinilo-amino, (C₂₋₈alquinilo)₂-amino, amino-C₁₋₈alquilo, C₁₋₁₀alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, C₂₋₈alquenilo-amino-C₁₋₈alquilo, (C₂₋₈alquenilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, C₂₋₈alquinilo-amino-C₁₋₈alquilo, (C₂₋₈alquinilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, halo-C₁₋₈alquilo-amino, (halo-C₁₋₈alquilo)₂-amino, halo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (halo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo-amino, (C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)-amino,

$(C_{1-8} \text{alcoxi}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}$, $C_{1-8} \text{alcoxi}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{1-8} \text{alcoxi}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{1-8} \text{alcoxi}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $(\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$, $C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $[(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo}]\text{amino}$,
 $\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $[(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo}]\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, hidroxilo-amino ,
 $\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$, $(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$,
 $(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}$, $\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$,
 $(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $[(\text{hidroxilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo}]\text{amino}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo-carbonilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $C_{1-8} \text{alquilo-amino-carbonilo}$,
 $(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino-carbonilo}$, $(C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino-carbonilo}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $C_{3-14} \text{cicloalquilo}$, $C_{3-14} \text{cicloalquilo}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $C_{3-14} \text{cicloalquilo-oxi}$, $C_{3-14} \text{cicloalquilo}-C_{1-8} \text{alcoxi}$, $C_{3-14} \text{cicloalquilo-amino}$,
 $C_{3-14} \text{cicloalquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{3-14} \text{cicloalquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{3-14} \text{cicloalquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $C_{3-14} \text{cicloalquilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{3-14} \text{cicloalquilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(C_{3-14} \text{cicloalquilo}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, arilo , $\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $\text{arilo}-C_{1-8} \text{alcoxi}$, arilo-amino , $(\text{arilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$, $(\text{arilo})_2\text{-amino}$,
 $\text{arilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $(\text{arilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(\text{arilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}$,
 $(\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}$, $(\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}$,
 $\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, $(\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo}, C_{1-8} \text{alquilo})\text{amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$,
 $(\text{arilo}-C_{1-8} \text{alquilo})_2\text{-amino}-C_{1-8} \text{alquilo}$, heteroarilo , $\text{heteroarilo}-C_{1-8} \text{alquilo}$,

heteroarilo-amino, heteroarilo-C₁₋₈alquilo-amino,
(heteroarilo-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino, (heteroarilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino,
heteroarilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo,
(heteroarilo-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, heterociclilo,
heterociclilo-C₁₋₈alquilo, heterociclilo-oxi, heterociclilo-C₁₋₈alcoxi,
heterociclilo-amino, (heterociclilo,C₁₋₈alquilo)amino, (heterociclilo)₂-amino,
heterociclilo-amino-C₁₋₈alquilo, (heterociclilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo,
(heterociclilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo,
(heterociclilo,C₃₋₁₄cicloalquilo-C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo,
heterociclilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo,
(heterociclilo-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo,
(heterociclilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, heterociclilo-oxi-amino,
(heterociclilo-oxi,C₁₋₈alquilo)amino, (heterociclilo-oxi)₂-amino,
(heterociclilo-oxi-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino, heterociclilo-carbonilo o
heterociclilo-carbonilo-oxi;

en donde cada instancia de C₃₋₁₄ cicloalquilo, arilo, heterocíclico y heteroarilo es no
sustituida o sustituida con uno, dos o tres sustituyentes cada uno seleccionado de
R₁₅; y,

en donde cada instancia de arilo, heterociclilo o heteroarilo es no sustituido o sustituido con
un sustituyente adicional seleccionado entre R₁₆;

R₃ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o
(C₁₋₈alquilo)₂-amino;

R₄ es hidrógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, arilo-C₁₋₈alquilo, en donde el arilo es no sustituido o
sustituido con un sustituyente adicional seleccionado de C₁₋₈alquilo,
halo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi o C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo;

R₅ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi, carboxilo, amino,
C₁₋₈alquilo-amino, (C₁₋₈alquilo)₂-amino o C₁₋₈alquilo-SO₂-amino;

R₆ es hidrógeno o C₁₋₈alquilo;

R₇ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o
(C₁₋₈alquilo)₂-amino;

R₈ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o
(C₁₋₈alquilo)₂-amino;

R₉ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o
(C₁₋₈alquilo)₂-amino;

R₁₀ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o
(C₁₋₈alquilo)₂-amino;

- R₁₁ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o (C₁₋₈alquilo)₂-amino;
- R₁₂ es hidrógeno, C₁₋₈alquilo, arilo o heteroarilo, en el cual arilo y heteroarilo es opcionalmente sustituido con un sustituyente adicional seleccionado de C₁₋₈alquilo, halo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi o C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo;
- R₁₃ es hidrógeno, ciano, halógeno, hidroxilo o C₁₋₈alquilo;
- R₁₄ es hidrógeno, C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo-carbonilo, C₁₋₈alcoxi-carbonilo, arilo o heteroarilo, en donde arilo y heteroarilo es no sustituido o sustituido con un sustituyente adicional seleccionado de C₁₋₈alquilo, halo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi o C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo;
- R₁₅ es azido, halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, C₁₋₈alquilo, halo-C₁₋₈alquilo, hidroxilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alcoxi, halo-C₁₋₈alcoxi, hidroxilo-C₁₋₈alcoxi, carboxilo, C₁₋₈alquilo-carbonilo, C₁₋₈alcoxi-carbonilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino, (C₁₋₈alquilo)₂-amino, halo-C₁₋₈alquilo-amino, (halo-C₁₋₈alquilo)₂-amino, halo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (halo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, amino-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, [(C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo]amino-C₁₋₈alquilo C₁₋₈alquilo-tio, amino-carbonilo, C₁₋₈alquilo-amino-carbonilo, (C₁₋₈alquilo)₂-amino-carbonilo, C₁₋₈alquilo-carbonilo-amino o (carboxilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)amino-carbonilo-amino;
- R₁₆ es C₃₋₁₄cicloalquilo, C₃₋₁₄cicloalquilo-amino, arilo, arilo-C₁₋₈alquilo, arilo-amino, (arilo, C₁₋₈alquilo)amino, (arilo)₂-amino, arilo-C₁₋₈alquilo-amino, (arilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)amino, (arilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino, arilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (arilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, (arilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, arilo-amino-C₁₋₈alquilo, (arilo, C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, (arilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, arilo-amino-carbonilo, arilo-C₁₋₈alcoxi, arilo-C₁₋₈alcoxi-carbonilo-amino, heteroarilo, heteroarilo-C₁₋₈alquilo, heteroarilo-amino, (heteroarilo)₂-amino, heteroarilo-C₁₋₈alquilo-amino, (heteroarilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)amino, (heteroarilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino, heteroarilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (heteroarilo-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, (heteroarilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁₋₈alquilo, heterociclilo-amino-C₁₋₈alquilo o heterociclilo-oxi;
- en donde cada instancia de C₃₋₁₄ cicloalquilo es no sustituida o sustituida con un sustituyente seleccionado de R₁₈; y

en donde cada instancia de arilo es no sustituida o sustituida con un sustituyente seleccionado de R₁₉;

R₁₈ es amino, C₁₋₈alquilo-amino, (C₁₋₈alquilo)₂-amino, amino-C₁₋₈alquilo, C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, (C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo o arilo-C₁₋₈alquilo-amino;

R₁₉ es halógeno

en donde en cada instancia de alquilo C₁₋₈ en cualquiera de R₁, R₃₋₁₆, o R₁₈ se selecciona de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo o n-octilo;

en donde en cada instancia de cicloalquilo C₃₋₁₄ en cualquiera de R₁₆ o R₁₈ se selecciona de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo;

en donde en cada instancia de arilo en cualquiera de R₁₂, R₁₄, R₁₆, o R₁₈ es fenilo;

en donde en cada instancia de heteroarilo en cualquiera de R₁, R₁₂, R₁₄ o R₁₆ se selecciona de pirrolilo, tiazolilo, 1-H-1,2,3-triazolilo, 1H-tetrazolilo, 2H-tetrazolilo, imidazolilo o piridinilo; y

en donde en cada instancia de heterociclo en cualquiera de R₁ o R₁₆ se selecciona de azetidino, pirrolidino, tetrahydrofurano, piperidino, piperazina, morfolino, 1,4-diazepan, 1,3-dioxolano, 2,5-dihidro-1H-pirrolilo, dihidro-1H-imidazolilo, 1,4,5,6-tetrahidropirimidino, 1,2,3,6-tetrahidropiridinilo, tetrahydro-2H-pirano, 3,4-dihydroisoquinolin- (1H)-il, 1,2,3,4-tetrahydroisoquinolinilo, hexahidropirrol [3,4-b] [1,4] oxazin-(2H)-il, (4aR, 7aS)hexahidropirrol[3,4-b][1,4]oxazin-(4aH)il, (cis)-octahidrociclopenta[c]pirrolilo, hexahidropirrol[3,4-b]pirrol(1H)-il, (3aR,6aR)-hexahidropirrol [3,4-b]pirrol(1H)-il, (3aR, 6aS)hexahidropirrol[3,4-c] pirrol(1H)-il, 5H-pirrol[3,4-b]piridin(7H)-il, 5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, tetrahydro-1H-pirrol [3,4-b] piridin(2H, 7H, 7aH)-il, hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridin(2H)-il, (4aR, 7aR) hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridin(2H)-il, octahidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, (3aR, 6aR)-hexahidrociclopenta[c]pirrol(1H)-il, (3aR, 4R, 6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol (1H)-il, (3aR, 4S, 6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol(1H)-il, (3aR, 5R, 6aS) - hexahidrociclopenta[c]pirrol-2(1H)-il, 1,3-dihidro-2H-isoindolilo, octahidro-2H - isoindolyl, (3aS) -1,3,3a, 4,5,6-hexahidro-2H-isoindolilo, (3aR, 4R, 7aS)-1H-isoindol- (3H, 3aH, 4H, 5H, 6H, 7H, 7aH)-il, (3aR, 7aS)octahidro-2H-isoindolilo, (3aR, 4R, 7aS) octahidro-2H-isoindolilo, (3aR, 4S, 7aS) octahidro-2H-isoindolilo, 2,5-diazabicyclo[2.2.1] heptanilo, 2-azabicyclo[2.2.1] hept-5-enilo, 3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, (1R, 5S, 6S)-3-azabicyclo [3.1.0] hexanilo, (cis, cis)-3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, 3,6-diazabicyclo[3.1.0] hexanilo, (1S, 5R, 6R)-3-azabicyclo[3.2.0]heptanilo, (1S, 5R, 6S)-3-azabicyclo [3.2.0] heptanilo, 5-aza-espiro [2.4] heptanilo, 2,6-diazaespiro [3.3] heptanilo, 2,5-diazaespiro

[3.4]octanilo, 2,6-diazaespiro[3.4] octanilo , 2,7-diazaespiro [3.5] nonanilo, 2,7-diazaespiro [4.4] nonanilo, 2-aza-espiro [4.5] decanilo o 2,8-diazaespiro [4.5] decanilo.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en el que

R₃ es hidrógeno, halógeno, hidroxilo, C₁₋₈alquilo, amino, C₁₋₈alquilo-amino o (C₁₋₈alquilo)₂-amino; y,

R₄ es hidrógeno o C₁₋₈alquilo.

3. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R₁ es

C₃₋₁₄cicloalquilo-amino-C₁₋₈alquilo, en donde C₃₋₁₄cicloalquilo es seleccionado de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo;

(C₃₋₁₄cicloalquilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, en donde C₃₋₁₄cicloalquilo es seleccionado de ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo;

C₃₋₁₄cicloalquilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, en donde C₃₋₁₄cicloalquilo es seleccionado de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo;

arilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo-amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo,C₁₋₈alquilo)amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo-amino-C₁₋₈alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo-C₁₋₈alquilo)₂-amino-C₁₋₈alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

heteroarilo, en donde heteroarilo es seleccionado de pirrolilo, tiazolilo, 1H-1,2,3-triazolilo, 1H-tetrazolilo, 2H-tetrazolilo, imidazolilo o piridinilo

heteroarilo-C₁₋₈alquilo-amino-C₁₋₈alquilo, en donde heteroarilo es seleccionado de piridina-2-il, piridina-3-il o piridina-4-il;

(heteroarilo-C₁₋₈alquilo,C₁₋₈alquilo)amino-C₁₋₈alquilo, en donde heteroarilo es seleccionado de piridina-3-il o piridina-4-il;

heterociclilo, en donde heterociclilo es seleccionado de azetidino, pirrolidino, tetrahydrofuranilo, piperidino, piperazino, morfolino, 1,4-diazepano, 1,3-dioxolano, 2,5-dihidro-1H-pirrolilo, dihidro-1H-imidazolilo, 1,4,5,6-tetrahidropirimidinilo, 1,2,3,6-tetrahidropiridinilo, tetrahidro-2H-pirano, 3,4-dihidroisoquinolina-(1H)-il, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, hexahidropirrol[3,4-b][1,4]oxazina-(2H)-ilo, (4aR,7aS)-hexahidropirrol[3,4-b][1,4]oxazina-(4aH)-ilo,

(cis)-octahidrociclopenta[c]pirrol-il, hexahidropirrol[3,4-b]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,6aR)-hexahidropirrol[3,4-b]pirrol-(1H)-il, (3aR,6aS)-hexahidropirrol[3,4-c]pirrol-(1H)-ilo, 5H-pirrol[3,4-b]piridina-(7H)-ilo, 5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, tetrahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H,7H,7aH)-il, hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H)-ilo, (4aR,7aR)-hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H)-ilo, octahidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, (3aR,6aR)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,4R,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,4S,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,5r,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-2(1H)-il, 1,3-dihidro-2H-isoindolilo, octahidro-2H-isoindolilo, (3aS)-1,3,3a,4,5,6-hexahidro-2H-isoindolilo, (3aR,4R,7aS)-1H-isoindol-(3H,3aH,4H,5H,6H,7H,7aH)-ilo, (3aR,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo, (3aR,4R,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo, (3aR,4S,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo, 2,5-diazabicyclo[2.2.1]heptanilo, 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-enilo, 3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, (1R,5S,6s)-3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, (cis,cis)-3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, 3,6-diazabicyclo[3.1.0]hexanilo, (1S,5R,6R)-3-azabicyclo[3.2.0]heptanilo, (1S,5R,6S)-3-azabicyclo[3.2.0]heptanilo, 5-azaspiro[2.4]heptanilo, 2,6-diazaspiro[3.3]heptanilo, 2,5-diazaspiro[3.4]octanilo, 2,6-diazaspiro[3.4]octanilo, 2,7-diazaspiro[3.5]nonanilo, 2,7-diazaspiro[4.4]nonanilo, 2-azaspiro[4.5]decanilo o 2,8-diazaspiro[4.5]decanilo;

heterociclilo-C₁₋₈alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de azetidino, pirrolidino, tetrahydrofurano, piperidino, piperazino, morfolino, 1,4-diazepano, 1,3-dioxolano, 2,5-dihidro-1H-pirrolilo, dihidro-1H-imidazolilo, 1,4,5,6-tetrahidropirimidinilo, 1,2,3,6-tetrahidropiridinilo, tetrahidro-2H-pirano, 3,4-dihidroisoquinolina-(1H)-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolinilo, hexahidropirrol[3,4-b][1,4]oxazina-(2H)-ilo, (4aR,7aS)-hexahidropirrol[3,4-b][1,4]oxazina-(4aH)-ilo, (cis)-octahidrociclopenta[c]pirrol-il, hexahidropirrol[3,4-b]pirrol-(1H)-il, (3aR,6aR)-hexahidropirrol[3,4-b]pirrol-(1H)-il, (3aR,6aS)-hexahidropirrol[3,4-c]pirrol-(1H)-ilo, 5H-pirrol[3,4-b]piridina-(7H)-ilo, 5,7-dihidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, tetrahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H,7H,7aH)-il, hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H)-ilo, (4aR,7aR)-hexahidro-1H-pirrol[3,4-b]piridina-(2H)-ilo, octahidro-6H-pirrol[3,4-b]piridinilo, (3aR,6aR)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,4R,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-il, (3aR,4S,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-(1H)-ilo, (3aR,5r,6aS)-hexahidrociclopenta[c]pirrol-2(1H)-ilo, 1,3-dihidro-2H-isoindol-il, octahidro-2H-isoindol-il, (3aS)-1,3,3a,4,5,6-hexahidro-2H-isoindolilo, (3aR,4R,7aS)-1H-isoindol-(3H,3aH,4H,5H,6H,7H,7aH)-ilo, (3aR,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo, (3aR,4R,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo,

(3aR,4S,7aS)-octahidro-2H-isoindolilo, 2,5-diazabicyclo[2.2.1]heptanilo, 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-enilo, 3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, (1R,5S,6s)-3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, (cis,cis)-3-azabicyclo[3.1.0]hexanilo, 3,6-diazabicyclo[3.1.0]hexanilo, (1S,5R,6R)-3-azabicyclo[3.2.0]heptanilo, (1S,5R,6S)-3-azabicyclo[3.2.0]heptanilo, 5-azaspiro[2.4]heptanilo, 2,6-diazaspiro[3.3]heptanilo, 2,5-diazaspiro[3.4]octanilo, 2,6-diazaspiro[3.4]octanilo, 2,7-diazaspiro[3.5]nonanilo, 2,7-diazaspiro[4.4]nonanilo, 2-azaspiro[4.5]decanilo o 2,8-diazaspiro[4.5]decanilo;

heterociclilo-amino- C_{1-8} alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de azetidina-1-ilo o piperidina-4-ilo;

(heterociclilo, C_{1-8} alquilo)amino- C_{1-8} alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de piperidina-3-ilo o piperidina-4-ilo;

(heterociclilo, C_{3-14} cicloalquilo- C_{1-8} alquilo)amino- C_{1-8} alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de piperidina-3-ilo o piperidina-4-ilo;

heterociclilo- C_{1-8} alquilo-amino- C_{1-8} alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de pirrolidina-2-ilo, piperidina-2-ilo, piperidina-3-ilo, piperidina-4-ilo o tetrahidro-2H-piran-4-il; y

(heterociclilo-oxi- C_{1-8} alquilo, C_{1-8} alquilo)amino seleccionado de tetrahidro-2H-pirano-2-il-oxi- C_{1-8} alquilo, C_{1-8} alquilo)amino

en donde en cada instancia de alquilo C_{1-8} en cualquiera R_1 anterior, se selecciona de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tere-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo o n-octilo.

4. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R_{16} es

C_{3-14} cicloalquilo, en donde C_{3-14} cicloalquilo es seleccionado de ciclopropilo o ciclobutilo;

C_{3-14} cicloalquilo-amino, en donde C_{3-14} cicloalquilo es seleccionado de ciclopropil;

arilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo- C_{1-8} alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo-amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo, C_{1-8} alquilo)amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo- C_{1-8} alquilo-amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo- C_{1-8} alquilo, C_{1-8} alquilo)amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo- C_{1-8} alquilo)₂-amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo- C_{1-8} alquilo-amino- C_{1-8} alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo- C_{1-8} alquilo, C_{1-8} alquilo)amino- C_{1-8} alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

(arilo- C_{1-8} alquilo)₂-amino- C_{1-8} alquilo, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo- C_{1-8} alcoxi, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

arilo- C_{1-8} alcoxi-carbonilo-amino, en donde arilo es seleccionado de fenilo;

heteroarilo, en donde heteroarilo es seleccionado de piridina-2-il, piridina-4-il,

tiazole-2-il o 1H-1,2,3-triazol-1-il;

heteroarilo- C_{1-8} alquilo-amino- C_{1-8} alquilo, en donde heteroarilo es seleccionado de piridina-2-il,

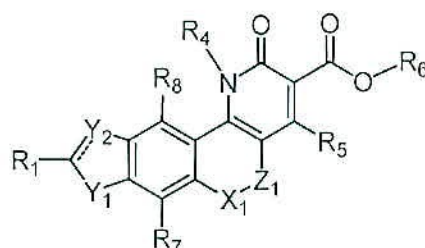
piridina-3-il o piridina-4-il;

heterociclilo, en donde heterociclilo es seleccionado de pirrolidina-1-il o morfolino-4-il;

heterociclilo- C_{1-8} alquilo, en donde heterociclilo es seleccionado de pirrolidina-1-il; y,

heterociclilo-oxi, en donde heterociclilo es seleccionado de tetrahidro-2H-pirano-2-il-oxi.

5. El compuesto de la reivindicación 1, en el que el compuesto de Fórmula (II) es un compuesto de Fórmula (IIa):



(IIa)

en la que

la línea de puntos en la Fórmula (IIa) representa un doble enlace opcionalmente presente;

X_1 es un enlace, $N(R_{14})$, S, O o $-CH(R_9)-$;

Z_1 es $N(R_{14})$, S, O, $C(O)$ o $-CH(R_3)-$ cuando X_1 es un enlace o $-CH(R_9)-$ o, Z_1 is $-CH(R_3)-$ cuando X_1 es $N(R_{14})$, S, o O; y,

todas las otras variables son como se han definido previamente.

6. El compuesto de la reivindicación 1, en el que el compuesto o una forma del mismo se selecciona a partir de:

ácido 3-[4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[8-fluoro-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[4-hidroxi-5-metilo-2-oxo-1,2,5,6-tetrahidro-[1,3]dioxolo[4',5':4,5]benzo[1,2-h]quinolina] carboxílico

ácido 3-[1,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[4-hidroxi-1,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[1-etil-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[1,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

ácido 3-[4-hidroxi-1,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico y

ácido 3-[4-hidroxi-1,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9,10,11-octahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol] carboxílico

en donde la forma del compuesto se selecciona de una sal, un racemato, un enantiómero, un diastereomero o un estereoisómero del mismo.

7. El compuesto de la reivindicación 1, en el que el compuesto o una forma del mismo se selecciona entre

2-((etilamino)metilo)-8-hidroxi-1-metilo-6-oxo-1,5,6,9-tetrahidropirido[3',2':4,5]ciclopenta[1,2-f]indol-7-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-8-metilo-9-((metiloamino)metilo)-2-oxo-2,5,6,8-tetrahidro-1H-indolo[6,5-h]quinolina-3-clorhidrato de ácido carboxílico

9-(azetidina-1-ilmetilo)-4-hidroxi-8-metilo-2-oxo-2,5,6,8-tetrahidro-1H-indolo[6,5-h]quinolina-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((ciclobutilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-(azetidina-1-ilmetilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-((isopropilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

20

20

10-((tert-butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-10-((4-hidroxipiperidina-1-il)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
10-((4-aminopiperidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
10-((4-(dimetilamino)piperidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
10-((3-aminopiperidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
10-(((ciclopropilmetilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-10-(((1-metilciclopropilo)amino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
10-((benziloamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
10-(aminometilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
10-((ciclopropilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
10-(((ciclobutilmetilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-10-(((2-metilciclopropilo)metilo)amino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(((piridina-4-ilmetilo)amino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(piperidina-1-ilmetilo)-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-10-(morpholinometilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-10-((4-metilopiperazina-1-il)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
10-((dietilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-((propilamino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-((prop-2-yn-1-ilamino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 (R)-10-((3-fluoropirrolidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((3-(dimetilamino)pirrolidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
 10-((dimetilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 (S)-10-((3-aminopirrolidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(pirrolidina-1-ilmetilo)-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-10-((3-hidroxipirrolidina-1-il)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(((piridina-3-ilmetilo)amino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 9-metilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((etilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((isopropilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((tert-butilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-(azetidina-1-ilmetilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-10-metilo-11-((metiloamino)metilo)-2-oxo-2,5,6,7,8,10-hexahidro-1H-
 pirido[3',2':7,8]cicloocta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 11-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-10-metilo-2-oxo-2,5,6,7,8,10-hexahidro-1H-
 pirido[3',2':7,8]cicloocta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-7,9-dimetilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-7,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-10-((isopropilamino)metilo)-7,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((tert-butilamino)metilo)-4-hidroxi-7,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-7,9-dimetilo-10-(((1-metilciclopropilo)amino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-5,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-7,9-dimetilo-2-oxo-1,2,5,9-tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

(cis)-10-((etilamino)metilo)-4,6,7-trihidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-((isopropilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-(azetidina-1-ilmetilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-5,9-dimetilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((metiloamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[2',3':4,5]azepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[2',3':4,5]azepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-((isopropilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[2',3':4,5]azepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((tert-butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[2',3':4,5]azepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-metilo-11-((metiloamino)metilo)-2-oxo-2,5,6,7,8,10-hexahidro-1H-pirido[2',3':4,5]azocino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

11-((etilamino)metilo)-4-hidroxi-10-metilo-2-oxo-2,5,6,7,8,10-hexahidro-1H-pirido[2',3':4,5]azocino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-11-((isopropilamino)metilo)-10-metilo-2-oxo-2,5,6,7,8,10-hexahidro-1H-pirido[2',3':4,5]azocino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-((pentilamino)metilo)-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((hexilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((heptilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((octilamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((nonilamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2-(dimetilamino)etilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-(((2-(metiloamino)etilo)amino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2-aminoetilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2-(dimetilamino)etilo)(metilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

10-((sec-butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((2-hidroxietilo)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((2-metoxietilo)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((2-hidroxietilo)(metilo)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((1-metoxipropano-2-il)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((1-hidroxipropano-2-il)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(((2-(pirrolidina-1-il)etilo)amino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
 10-((alilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-10-((isobutilamino)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-10-((neopentilamino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-10-((4-metilo-1,4-diazepan-1-il)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-10-(((1-metilopiperidina-4-il)amino)metilo)-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-10-((3-metoxipirrolidina-1-il)metilo)-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((3-acetamidopirrolidina-1-il)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-(((1-(dimetilamino)propano-2-il)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-
 1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido
 carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(((tetrahydrofuran-2-il)metilo)amino)metilo)-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-10-((1-metilohexahidropirrol[3,4-b]pirrol-5(1H)-il)metilo)-2-oxo-
 1,2,5,6,7,9-hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido
 carboxílico
 10-(((2-(dimetilamino)-2-oxoetilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-(2-(etilamino)etilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,9-
 tetrahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-trifluoroacetato de ácido carboxílico
 10-(2-(etilamino)etilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-1,2,5,6,7,9-
 hexahidropirido[3',2':6,7]ciclohepta[1,2-f]indol-3-trifluoroacetato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-10-(((1-metilciclopropilo)amino)metilo)-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-
 1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 10-((sec-butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahydro-1H-
 pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico
 4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-((propilamino)metilo)-2,5,6,9-tetrahydro-1H-
 pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2,4-dimetoxibenzilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((ciclopropilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((ciclobutilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((dimetilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(pirrolidina-1-ilmetilo)-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

10-((tert-butilamino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-((4-metilopiperazina-1-il)metilo)-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((2-hidroxietilo)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((1-hidroxipropano-2-il)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-10-(((2-(pirrolidina-1-il)etilo)amino)metilo)-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2-aminoetilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-9-metilo-10-(((2-(metiloamino)etilo)amino)metilo)-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

10-(((2-(dimetilamino)etilo)amino)metilo)-4-hidroxi-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-diclorhidrato de ácido carboxílico

4-hidroxi-10-(((2-metoxietilo)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico, y

4-hidroxi-10-(((1-metoxipropano-2-il)amino)metilo)-9-metilo-2-oxo-2,5,6,9-tetrahidro-1H-pirido[2',3':4,5]oxepino[3,2-f]indol-3-clorhidrato de ácido carboxílico;

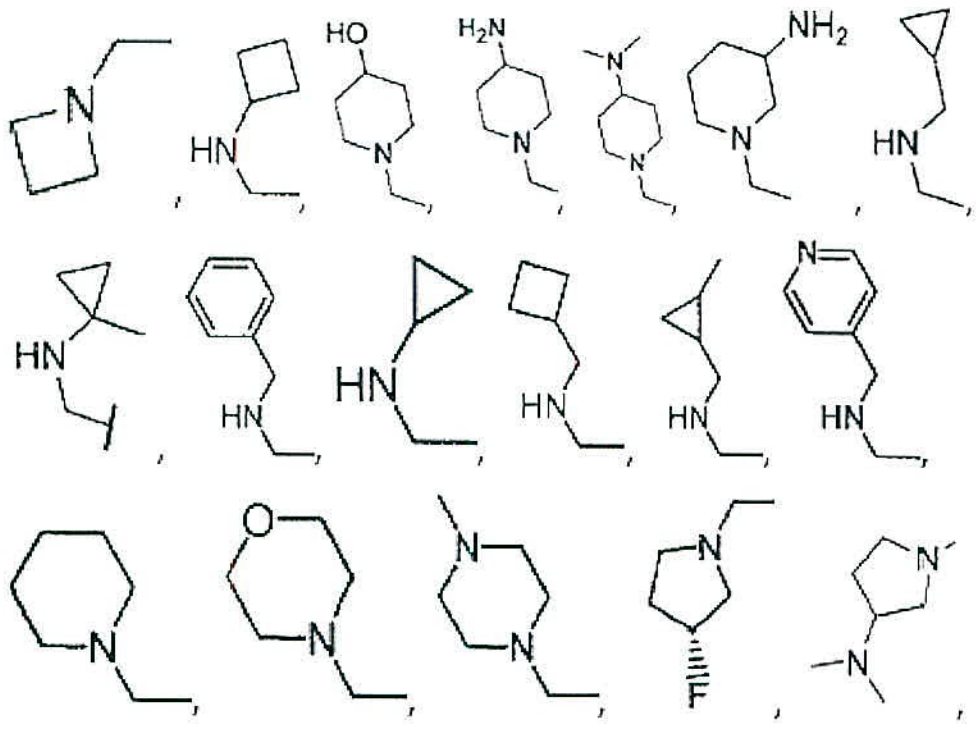
en el que la forma del compuesto se selecciona de un ácido libre, base libre, , racemato, enantiómero, diastereómero o estereoisómero, del mismo.

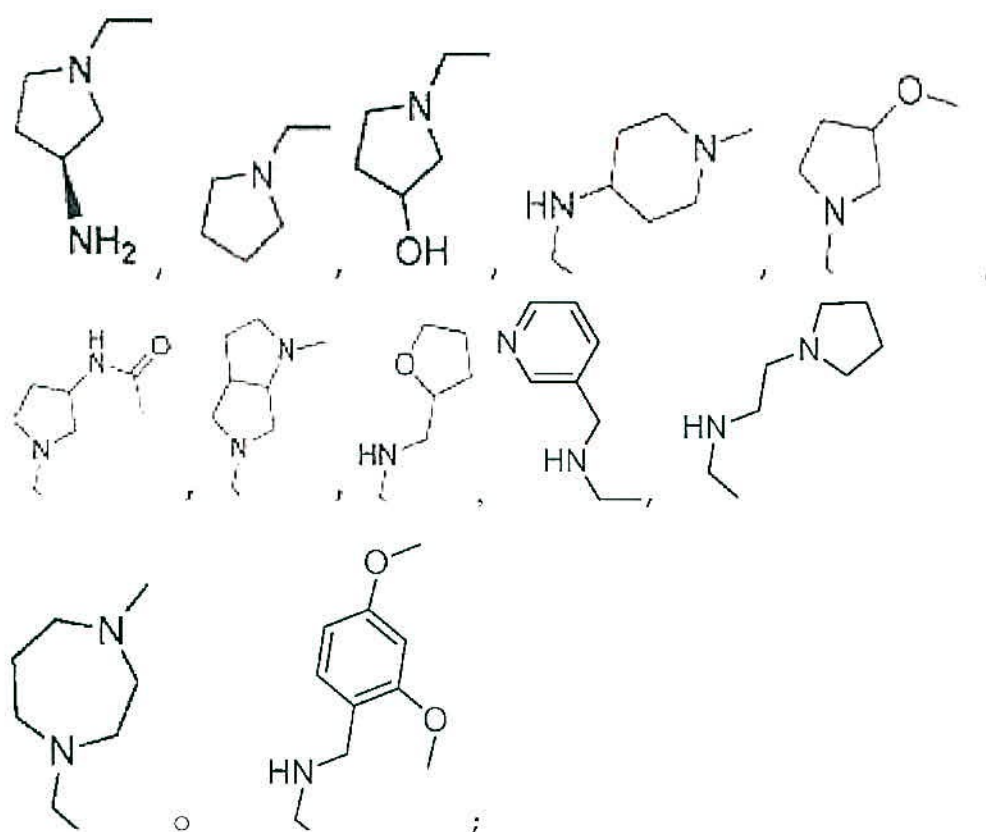
8. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la reivindicación 1 en mezcla con un excipiente; en donde el excipiente se selecciona de un grupo que

consiste de un vehículo, solvente, adyuvante, diluyente, agente desintegrante, agente de unión, agente lubricante o combinaciones de los mismos.

9.El compuesto de la reivindicación 1, en donde:

- X es $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}-$,
 $-\text{CH}(\text{OH})\text{CH}(\text{OH})-$, $-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$, $-\text{NH}-\text{CH}_2-$ or
 $-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;
Y₁ es $-\text{N}(\text{CH}_3)-$;
Y₂ es $-\text{CH}-$;
Z es $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$;
R₁ es $-\text{H}$, $-\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{NHCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{NHC}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{OH}$,
 $-\text{CH}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$,
 $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$,





R_4 es -H, -CH₃, -CH₂CH₃

R_5 es -OH;

R_6 es -H;

R_7 es -H or -F; and

R_8 es -H or -F.

10. El compuesto de la reivindicación 1, en donde

Y_1 es -N(CH₃)-;

Y_2 es -CH-;

Z es -CH₂-, -O-, or -CH(CH₃);

R_5 es -OH;

R_6 es -H;

R_7 es -H; and

R_8 es -H.

11. El compuesto de la reivindicación 1, en donde:

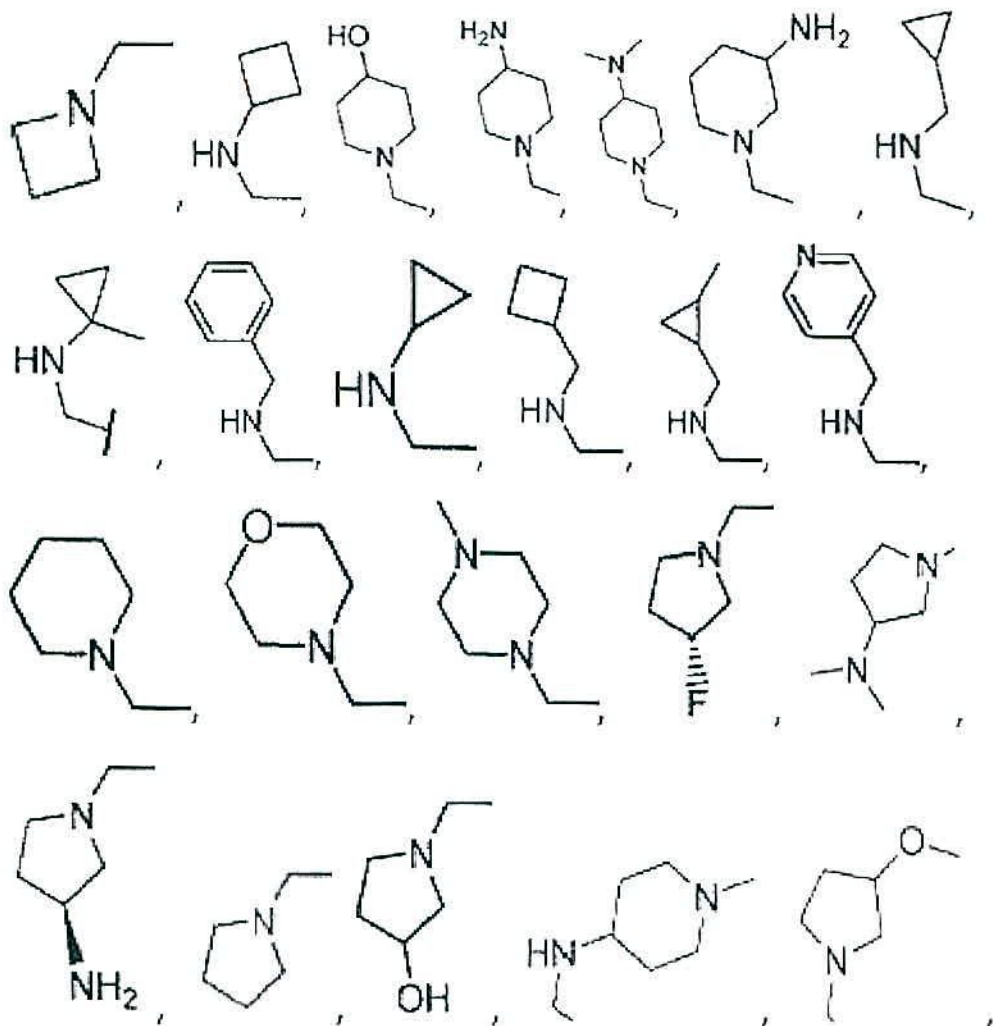
X es -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)-CH₂-, -CH=CH-, -C(CH₃)-CH-,
-CH(OH)CH(OH)-, -O-, -O-CH₂-, -N(CH₃)-CH₂-, -NH-CH₂- or
-NH-CH₂CH₂-;

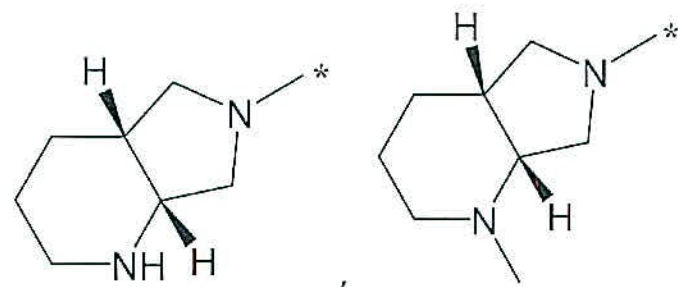
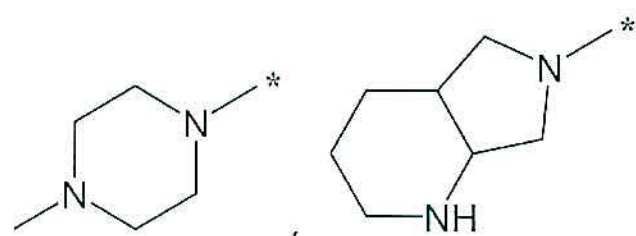
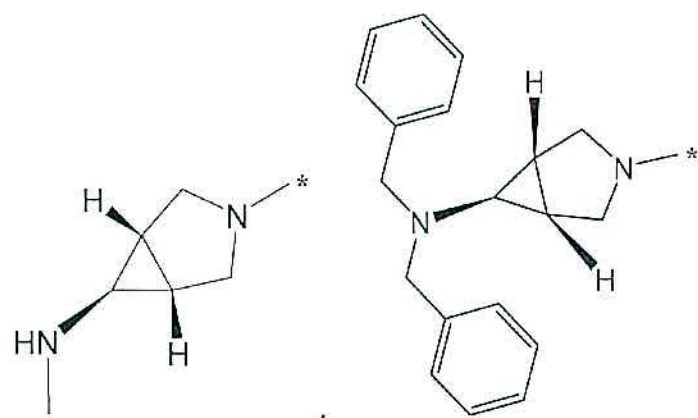
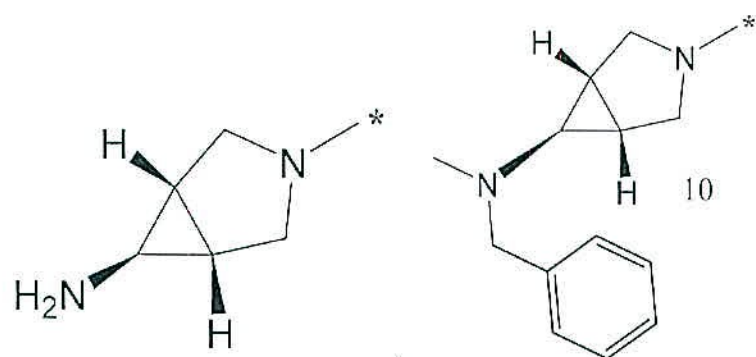
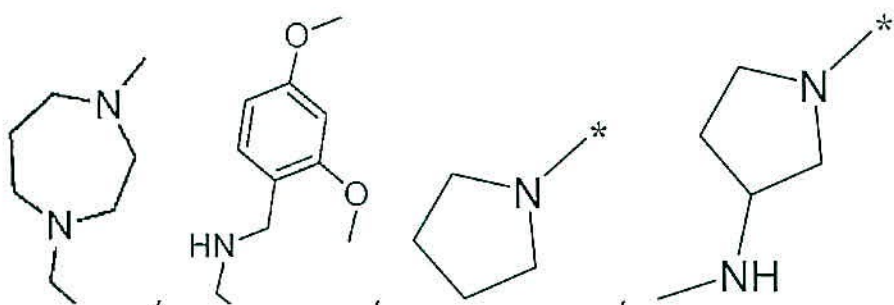
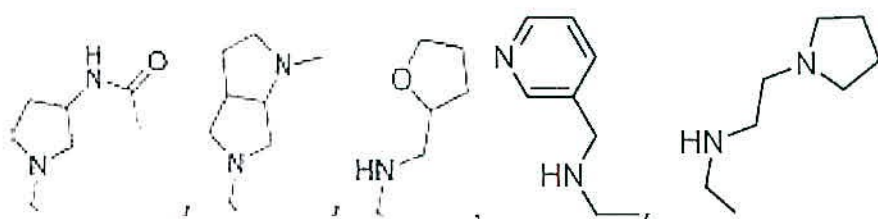
Y_1 es -N(CH₃)-;

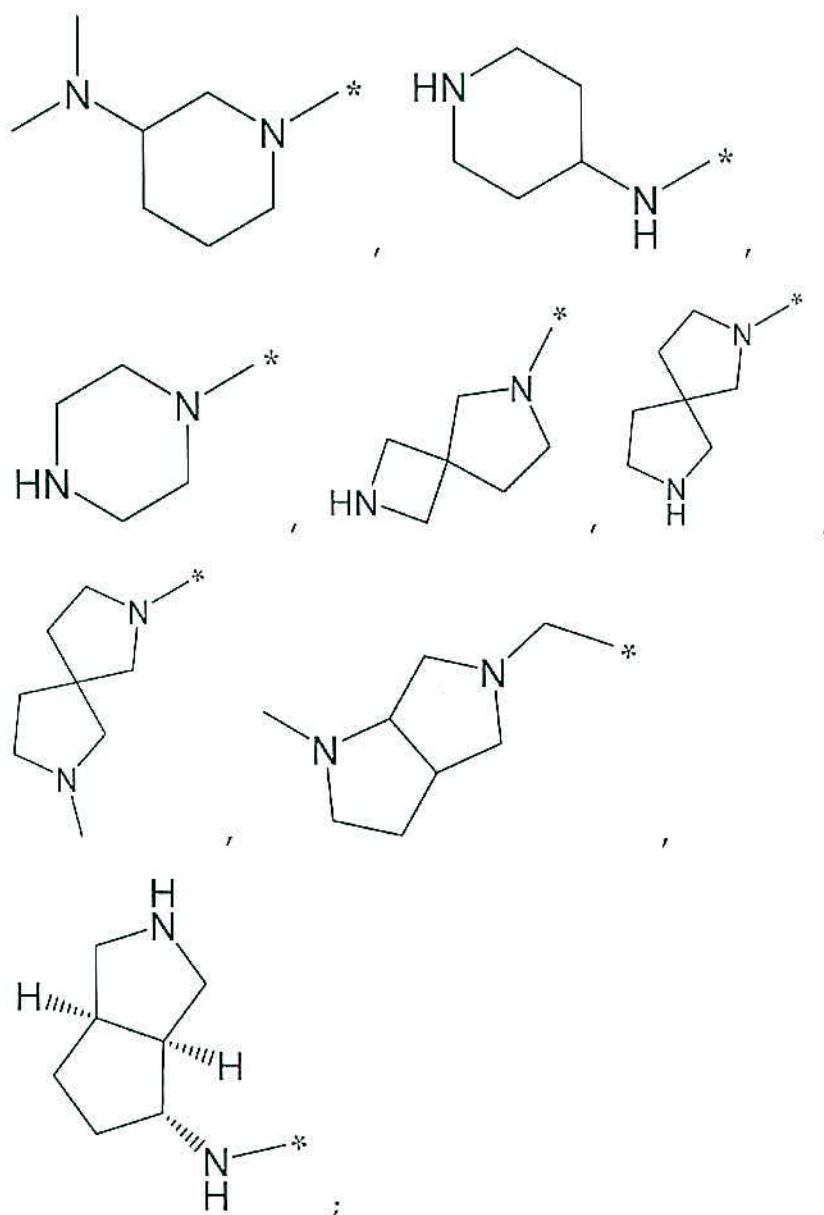
Y₂ es -CH-;

Z es -CH₂-, -CH(CH₃)-;

R₁ es -H, -CH₂NH₂, -CH₂NHCH₃, -CH₂NHCH₂CH₃, -CH₂NHCH(CH₃)₂,
 -CH₂NHC(CH₃)₃, -CH₂N(CH₂CH₃)₂, -CH₂NHCH₂CH₂)₂CH₃,
 -CH₂NHCH₂C≡CH, -CH₂N(CH₃)₂, -CH₂NH(CH₂)₃CH₃, -
 CH₂NH(CH₂)₄CH₃, -CH₂NH(CH₂)₅CH₃, -CH₂NH(CH₂)₆CH₃,
 -CH₂NH(CH₂)₇CH₃, -CH₂NH(CH₂)₈CH₃, -
 CH₂N(CH₃)(CH₂)₂N(CH₃)₂, -
 CH₂NH(CH₂)₂CH₃-(CH₂)₂NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NH(CH₂)₂N(CH₃)₂,
 -CH₂NH(CH₂)₂NHCH₃, -CH₂NH(CH₂)₂NH₂, -CH₂NHC(CH₃)CH₂CH₃,
 -CH₂NHCH₂CH₂OH, -CH₂NH(CH₂)₂OCH₃, -CH₂N(CH₃)(CH₂)₂OH,
 -CH₂NHCH(CH₃)CH₂OCH₃, -CH₂NHCH(CH₃)CH₂OH, -
 CH₂NHCH₂CH=CH₂, -CH₂NHCH₂C(CH₃)₃, -CH₂NHCH₂CH(CH₃)₂, -
 CH₂NHCH(CH₃)CH₂N(CH₃)₂, -CH₂NHCH(CH₃)CH₂CH₃,







en donde "*" representa un punto de unión;

$$R_4 \text{ es } -H, -CH_3, -CH_2CH_3$$
 R_5 es $-\text{OH}$;

R₆ es -H;

R₇ is -H or -F; and

R_g es -H or -F.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -

31



RECIBO DE CAJA

No. 16 - 0042072

Bogotá D.C., Abril 29 de 2016 - 11:24:55

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	SIC ** RECIBO **	999999999	40212	26/04/2016	80.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	40.000.00	40.000.00
			\$40.000.00

SON: **CUARENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 15-269914- -00004-0000

Fecha: 2016-05-02 16:12:13

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 444 RESPUESTAREQUE

Folios: 31

0010-15565-841-007-3

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

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

Abril 29 de 2016 - 11:28:43