

1

Señores
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y
Bogotá, D.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035578- -00004-0000

Fecha: 2011-03-09 12:47:31 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 34

Re.: Código 011 – 378 – 444
Expediente No. 10-35.578
Fase Nacional de Solicitud
de Patente PCT
PURDUE PHARMA L.P.
SHIONOGI & CO., LTD.

En relación con el expediente de la referencia y siguiendo precisas instrucciones de mi representada me permito manifestarles lo siguiente:

1. Adjunto estoy presentando un nuevo capítulo reivindicatorio el cual consta de 37 reivindicaciones.
2. Acompaño el comprobante de pago por concepto de modificación de la solicitud por valor de \$ 118.000.00, recibo No. 11-21790.
3. Igualmente adjunto el comprobante de pago por concepto de reivindicaciones adicionales en exceso de las 10 primeras por valor de \$ 729.000.00 recibo No. 11-21791.

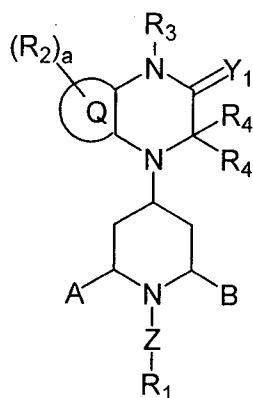
Les solicito tener en cuenta esta modificación al momento de efectuar el examen de patentabilidad correspondiente

De Ustedes Atentamente,

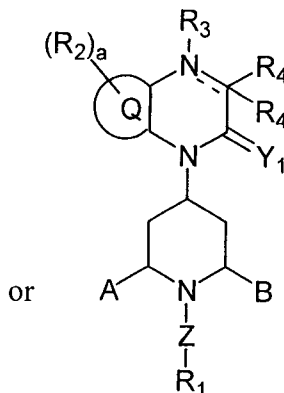

LUIS FELIPE CASTILLO GIBSON
T.P. No. 68.995 del C.S.J.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de acuerdo a la fórmula (I) o (II):



(I)



(II)

o un derivado farmacéuticamente aceptable de lo mismo, CARACTERIZADO porque:

Y₁ es O o S;

Q es seleccionado de un benzo fusionado o de un heteroarilo (de 5 ó 6 miembros);

cada R₂ es independientemente seleccionado de:

(a) -halo, -CN, -NO₂, -OT₃, -C(=O)T₃, -C(=O)OT₃,
-C(=O)N(T₁)(T₂), -S(=O)₃H, -S(=O)T₃, -S(=O)₂T₃, -S(=O)₂N(T₁)(T₂), -N(T₁)(T₂), -
N(T₃)C(=O)T₃, -N(T₃)C(=O)N(T₁)(T₂), -N(T₃)S(=O)₂T₃, o -N(T₃)S(=O)₂N(T₁)(T₂); o

(b) -alquilo(C₁-C₆), -alquenilo (C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), -alcoxi(C₁-C₆), -
cicloalquilo (C₃-C₇), -bicicloalquilo(C₆-C₁₄), -tricicloalquilo(C₈-C₂₀), -cicloalquenilo(C₅-C₁₀),
-bicicloalquenilo(C₇-C₁₄), - tricicloalquenilo(C₈-C₂₀), -heterociclo (de 5 ó 6 miembros), o -

3

bicicloheterociclo (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados; o

(c) -fenilo, -naftalenilo, -arilo(C_{14}), o
-heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7 independientemente seleccionados;

a es un número entero seleccionado de 0, 1 ó 2;

la línea punteada en el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q representa la presencia o ausencia de un enlace, y cuando esa línea punteada representa la presencia de un enlace entonces R_3 y un R_4 están ausentes;

R_3 es seleccionado de:

- (a) -H; o
- (b) -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados de -OH, -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, ó $-C(=O)N(R_6)_2$; o
- (c) -cicloalquilo(C_3-C_7) el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados de -OH, -alquilo(C_1-C_4), -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, ó $-C(=O)N(R_6)_2$;

cada R_4 es independientemente seleccionado de:

- (a) -H; o
- (b) -halo, -CN, o $-NO_2$; o
- (c) -X, -alquil(C_1-C_6)-X, -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-X, o -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)- alquil(C_1-C_6)-X; o

(d) $-C(=Y)CN$, $-C(=Y)X$, $-C(=Y)T_3$, $-C(=Y)YX$, $-C(=Y)YT_3$, $-C(=Y)N(T_1)(T_2)$,
 $-C(=Y)N(R_9)CN$, $-C(=Y)N(R_9)X$, $-C(=Y)N(R_9)YH$, $-C(=Y)N(R_9)YX$, $-C(=Y)N(R_9)YCH_2X$,
 $-C(=Y)N(R_9)YCH_2CH_2X$, o $-C(=Y)N(R_9)S(=O)_2T_3$; o

(e) $-N(R_9)X$, $-N(R_9)-CH_2X$, $-N(R_9)-CH_2CH_2X$,
 $-N(R_9)CH_2N(R_9)C(=N(R_{12}))N(R_{12})_2$, $-N(R_9)-CH_2CH_2N(R_9)C(=N(R_{12}))N(R_{12})_2$, $-N(T_1)(T_2)$,
 $-N(T_3)C(=Y)T_3$, $-N(T_3)C(=Y)YT_3$, $-N(T_3)C(=Y)N(T_1)(T_2)$, $-N(T_3)S(=O)_2T_3$, o
 $-N(T_3)S(=O)_2N(T_1)(T_2)$; o

(f) $-YH$, $-CH_2YH$, $-CH_2CH_2YH$, $-YX$, o $-YT_3$; o

(g) $-S(=O)T_3$, $-S(=O)_2T_3$, $-S(=O)N(T_1)(T_2)$, $-S(=O)_2N(T_1)(T_2)$, $-S(=O)X$, o
 $-S(=O)_2X$;

X es:

(a) $-H$, $-alquilo(C_1-C_6)$, $-alquenilo(C_2-C_6)$, $-alquinilo(C_2-C_6)$, $-alcoxi(C_1-C_6)$,
 $-cicloalquilo(C_3-C_7)$, $-bicicloalquilo(C_6-C_{14})$, $-tricicloalquilo(C_8-C_{20})$, $-cicloalquenilo(C_5-C_{10})$,
 $-bicicloalquenilo(C_7-C_{14})$, $-tricicloalquenilo(C_8-C_{20})$, $-heterociclo$ (de 5 ó 6 miembros), o
 $-bicicloheterociclo$ (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no
sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados; o

(b) $-fenilo$, $-naftalenilo$, $-arilo(C_{14})$, o $-heteroarilo$ (de 5 ó 6 miembros), cada
uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7
independientemente seleccionados;

cada Y es independientemente seleccionado de O o S;

A y B son independientemente seleccionados de:

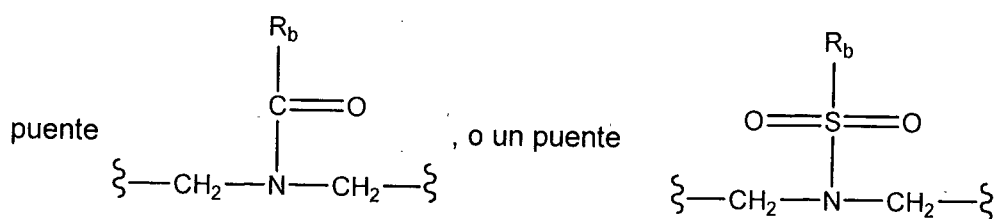
(a) $-H$, $-CN$, $-C(=O)OT_3$, o $-C(=O)N(T_1)(T_2)$; o

(b) $-cicloalquilo(C_3-C_{12})$, $-cicloalcoxi(C_3-C_{12})$, $-alquilo(C_1-C_6)$, $-alquenilo(C_2-$
 $C_6)$, $-alquinilo(C_2-C_6)$, o $-alcoxi(C_1-C_6)$, cada uno de los cuales está sustituido o no
sustituido con 1 ó 2 sustituyentes independientemente seleccionados de $-OH$, -

$S(=O)_2NH_2$, $-N(R_6)_2$, $=NR_6$, $-C(=O)OT_3$, $-CON(R_6)_2$, $-N(R_6)C(=O)R_9$, y -heterociclo (de 5 ó 6 miembros), o 1, 2 ó 3 grupos -halo independientemente seleccionados; o

(c) A-B juntos pueden formar un puente (C_2-C_6), el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes independientemente seleccionados de $-OH$, -alquilo(C_1-C_4), -halo, y $-C(halo)_3$, y donde el puente contiene opcionalmente $-HC=CH-$ o $-O-$ dentro del puente(C_2-C_6); en donde el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q puede estar en la configuración *endo-* o *exo-* con respecto del puente A-B; o

(d) A-B juntos pueden formar un puente $-CH_2-N(R_a)-CH_2-$, un



donde el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q puede estar en la configuración *endo-* o *exo-* con respecto del puente A-B;

R_a es seleccionado de $-H$, -alquilo(C_1-C_6), -cicloalquilo(C_3-C_7), $-CH_2-C(=O)-R_c$, $-(CH_2)-C(=O)-OR_c$, $-(CH_2)-C(=O)-N(R_c)_2$, $-(CH_2)_2-O-R_c$, $-(CH_2)_2-S(=O)_2-N(R_c)_2$, R_c , o $-(CH_2)_2-N(R_c)S(=O)_2-R_c$;

R_b es seleccionado de:

(a) $-H$, -alquilo(C_1-C_6), -cicloalquilo(C_3-C_7), -heterociclo (de 3 a 7 miembros), $-N(R_c)_2$, $-N(R_c)-$ cicloalquilo(C_3-C_7), o $-N(R_c)-$ heterociclo (de 3 a 7 miembros); o

(b) -fenilo, -naftalenilo, o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7 independientemente seleccionados; o

(c) $-N(R_c)$ -fenilo, $-N(R_c)$ -naftalenilo, $-N(R_c)$ -arilo(C_{14}), o $-N(R_c)$ -heterociclo (de 5 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7 independientemente seleccionados;

cada R_c es independientemente seleccionado de $-H$ o $-(C_1-C_4)$ alquilo;

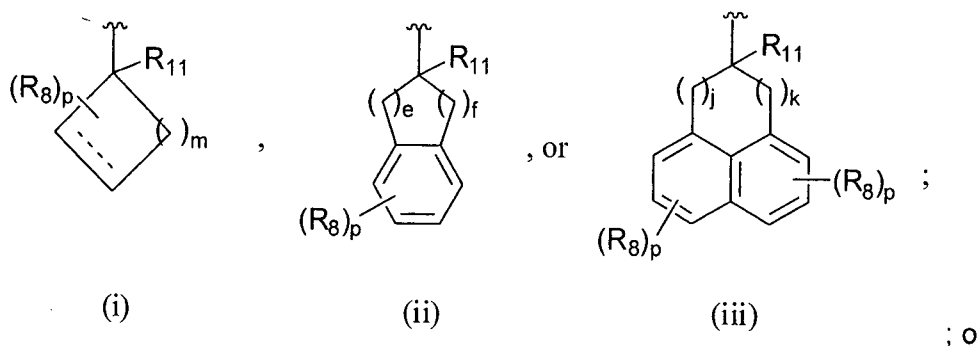
Z es $-[alquilo(C_1-C_{10})$ opcionalmente sustituido por $R_1]_h-$, donde h es 0 ó 1; o $-alquil(C_1-C_{10})-NR_6C(=Y)-$;

cada R_1 es independientemente seleccionado de:

(a) $-H$, $-halo$, $-CN$, $-OH$, $-CH_2OH$, $-CH_2CH_2OH$, $-NO_2$, $-N(R_6)_2$, $-S(=O)NH_2$, $-S(=O)_2NH_2$, $-C(=O)OV_1$, o $-C(=O)CN$; o

(b) $-alquilo(C_1-C_{10})$, $-alquenilo(C_2-C_{10})$, $-alquinilo(C_2-C_{10})$, $-O-alquilo(C_1-C_6)$, $-cicloalcoxi(C_3-C_7)$, $-bicicloalquilo(C_6-C_{14})$, $-tricicloalquilo(C_8-C_{20})$, $-cicloalquenilo(C_5-C_{10})$, $-bicicloalquenilo(C_7-C_{14})$, $-tricicloalquenilo(C_8-C_{20})$, $-heterociclo$ (de 3 a 7 miembros), $-bicloheterociclo$ (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados; o

(c)



(d) $-fenilo$, $-naftalenilo$, $-arilo(C_{14})$, o $-heterociclo$ (de 5 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con un grupo R_7 ; o

$-Z-R_1$ es 3,3-difenilpropil- opcionalmente sustituido en el carbono de la posición 3 del propilo con $-CN$, $-C(=O)N(R_6)_2$, $-C(=O)OV_1$, o $-tetrazolilo$; o

$-Z-R_1$ es $-alquilo(C_1-C_4)$ sustituido con $tetrazolilo$;

4

cada R_6 es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_6), o -cicloalquilo(C_3-C_7), o dos grupos R_6 unidos a los mismos átomos de nitrógeno juntos pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros, donde el número de átomos en el anillo incluye los átomos de nitrógeno, y en donde uno del anillo de 5 a 8 miembros átomos de carbono está opcionalmente reemplazado por O, S o N(T_3);

cada R_7 es independientemente seleccionado de -alquilo(C_1-C_4), -alquenilo(C_2-C_6), -alquinilo(C_2-C_6), -OR₉, -SR₉, -C(halo)₃, -CH(halo)₂, -CH₂(halo), -CN, -halo, -N₃, -NO₂, -CH=N(R_9), -N(R_9)₂, -N(R_9)OH, -N(R_9)S(=O)R₁₂, -N(R_9)S(=O)₂R₁₂, -N(R_9)C(=O)R₁₂, -N(R_9)C(=O)N(T_1)(T_2), -N(R_9)C(=O)OR₁₂, -C(=O)R₉, -C(=O)N(T_1)(T_2), -C(=O)OR₉, -OC(=O)R₉, -OC(=O)N(T_1)(T_2), -OC(=O)OR₉, -S(=O)R₉, o -S(=O)₂R₉;

cada R_8 es independientemente seleccionado de -alquilo(C_1-C_4), -alquenilo(C_2-C_6), -alquinilo(C_2-C_6), -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), -alquil(C_1-C_6)-COOR₉, -OR₉, -SR₉, -C(halo)₃, -CH(halo)₂, -CH₂(halo), -CN, =O, =S, -halo, -N₃, -NO₂, -CH=N(R_9), -N(R_9)alquil(C_1-C_6)-COOR₉, -N(R_9)₂, -N(R_9)OH, -N(R_9)S(=O)R₁₂, -N(R_9)S(=O)₂R₁₂, -N(R_9)C(=O)R₁₂, -N(R_9)C(=O)N(T_1)(T_2), -N(R_9)C(=O)OR₁₂, -C(=O)R₉, -C(=O)N(T_1)(T_2), -C(=O)OR₉, -OC(=O)R₉, -OC(=O)N(T_1)(T_2), -OC(=O)OR₉, -S(=O)R₉, o -S(=O)₂R₉;

cada R_9 es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_6), -alquenilo(C_2-C_6), -alquinilo(C_2-C_6), -cicloalquilo(C_3-C_8), -cicloalquenilo(C_5-C_8), -fenilo, -bencilo, -heterociclo (de 3 a 6 miembros), -C(halo)₃, -CH(halo)₂, o -CH₂(halo);

si h es 0, entonces R_{11} se puede seleccionar de -H, -CN, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R_6)₂ o R_{11} puede ser -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con -OH, -alcoxi(C_1-C_4), -N(R_6)₂, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R_6)₂;

si h es 1, entonces R_{11} se puede seleccionar de -H, -CN, -OH, -halo, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R_6)₂ o R_{11} puede ser -alquil(C_1-C_4)o el cual está sustituido o no sustituido con -OH, -alcoxi(C_1-C_4), -N(R_6)₂, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R_6)₂;

de otra forma, donde Z es $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10})\text{-NR}_6\text{C}(=\text{Y})-$, entonces R_{11} se puede seleccionar de $-\text{H}$, $-\text{CN}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$, o $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_6)_2$ o R_{11} puede ser $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_4)$ el cual está sustituido o no sustituido con $-\text{OH}$, $-\text{alcoxi}(\text{C}_1\text{-C}_4)$, $-\text{N}(\text{R}_6)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$, o $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_6)_2$;

cada R_{12} es independientemente seleccionado de $-\text{H}$ o $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_4)$;

m es un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 u 11;

e y f son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4 ó 5 con la condición que $2 \leq (e + f) \leq 5$;

j y k son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3 ó 4 con la condición que $1 \leq (j + k) \leq 4$;

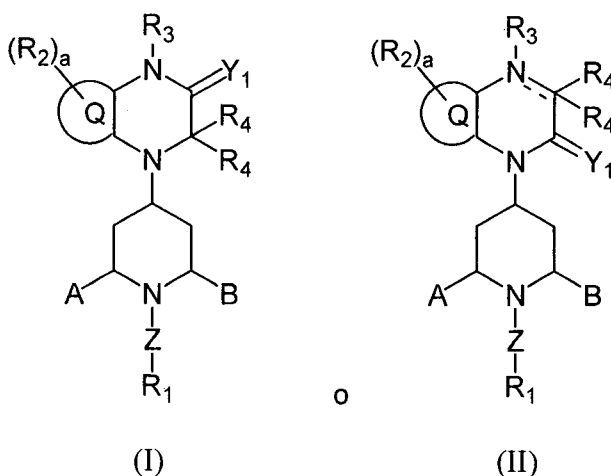
cada p es un número entero independientemente seleccionado de 0 ó 1;

cada T_1 , T_2 , y T_3 es independientemente $-\text{H}$ o $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados y, opcionalmente, en donde cualquier átomo de carbono del $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ excepto el átomo de carbono unido directamente al átomo al cual está unido T_1 , T_2 , o T_3 es independientemente reemplazado por O, S, o $\text{N}(\text{R}_6)$, o T_1 y T_2 pueden juntos formar un anillo de 5 a 8 miembros donde el número de átomos en el anillo incluye los átomos de nitrógeno a los cuales T_1 y T_2 están unidos, dicho anillo de 5 a 8 miembros está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados y, opcionalmente, cualquier átomo de carbono en dicho anillo de 5 a 8 miembros es independientemente reemplazado por O, S, o $\text{N}(\text{R}_6)$;

cada V_1 es independientemente seleccionado de $-\text{H}$, $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{fenilo}$, o $-\text{bencilo}$; y

cada halo es independientemente seleccionado de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, o $-\text{I}$.

2. Un compuesto de acuerdo a la fórmula (I) o (II):



o un derivado farmacéuticamente aceptable de lo mismo, CARACTERIZADO porque

Y_1 es O o S;

Q es seleccionado de un benzo fusionado o de un heteroarilo (de 5 ó 6 miembros);

cada R_2 es independientemente seleccionado de:

(a) -halo, -CN, -NO₂, -OT₃, -C(=O)T₃, -C(=O)OT₃, -C(=O)N(T₁)(T₂), -S(=O)₃H, -S(=O)T₃, -S(=O)₂T₃, -S(=O)₂N(T₁)(T₂), -N(T₁)(T₂), -N(T₃)C(=O)T₃, -N(T₃)C(=O)N(T₁)(T₂), -N(T₃)S(=O)₂T₃, o -N(T₃)S(=O)₂N(T₁)(T₂); o

(b) -alquilo(C₁-C₆), -alquenilo(C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), -alcoxi(C₁-C₆), -cicloalquilo(C₃-C₇), -bicicloalquilo(C₆-C₁₄), -tricicloalquilo(C₈-C₂₀), -cicloalquenilo(C₅-C₁₀), -bicicloalquenilo(C₇-C₁₄), -tricicloalquenilo(C₈-C₂₀), -heterociclo (de 5 ó 6 miembros), o -bicicloheterociclo (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados; o

(c) -fenilo, -naftalenilo, -arilo(C₁₄), o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7 independientemente seleccionados;

10.

a es un número entero seleccionado de 0, 1 ó 2;

la línea punteada en el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q representa la presencia o ausencia de un enlace, y cuando esa línea punteada representa la presencia de un enlace entonces R_3 y un R_4 están ausentes;

R_3 es seleccionado de:

(a) -H; o

(b) -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados de -OH, -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$; o

(c) -cicloalquilo(C_3-C_7) el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados de -OH, -alquilo(C_1-C_4), -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$;

cada R_4 es independientemente seleccionado de:

(a) -H; o

(b) -halo, -CN, o $-NO_2$; o

(c) -X, -alquil(C_1-C_6)-X, -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-X, o -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-alquil(C_1-C_6)-X; o

(d) $-C(=Y)CN$, $-C(=Y)X$, $-C(=Y)T_3$, $-C(=Y)YX$, $-C(=Y)YT_3$, $-C(=Y)N(T_1)(T_2)$, $-C(=Y)N(R_9)CN$, $-C(=Y)N(R_9)X$, $-C(=Y)N(R_9)CH_2CH_2N(T_1)(T_2)$, $-C(=Y)N(R_9)YH$, $-C(=Y)N(R_9)YX$, $-C(=Y)N(R_9)YCH_2X$, $-C(=Y)N(R_9)YCH_2CH_2X$, o $-C(=Y)N(R_9)S(=O)_2T_3$; o

(e) $-N(R_9)X$, $-N(R_9)-CH_2X$, $-N(R_9)-CH_2CH_2X$, $-N(R_9)-CH_2CH_2N(R_9)X$, $-N(R_9)CH_2CH_2N(T_1)(T_2)$, $-N(R_9)CH_2C(=Y)X$, $-N((C_1-C_6)alquil-C(=O)OR_9)_2$, $-N(R_9)CH_2N(R_9)C(=N(R_{12}))N(R_{12})_2$, $-N(R_9)-CH_2CH_2N(R_9)C(=N(R_{12}))N(R_{12})_2$, $-N(T_1)(T_2)$, -

$N(T_3)C(=Y)T_3$, $-N(T_3)C(=Y)YT_3$, $-N(T_3)C(=Y)N(T_1)(T_2)$, $-N(T_3)S(=O)_2T_3$, o $-N(T_3)S(=O)_2N(T_1)(T_2)$; o

(f) $-YH$, $-CH_2YH$, $-CH_2CH_2YH$, $-YX$, o $-YT_3$; o

(g) $-S(=O)T_3$, $-S(=O)_2T_3$, $-S(=O)N(T_1)(T_2)$, $-S(=O)_2N(T_1)(T_2)$, $-S(=O)X$, o $-S(=O)_2X$;

X es:

(a) $-H$, $-alquilo(C_1-C_6)$, $-alquenilo(C_2-C_6)$, $-alquinilo(C_2-C_6)$, $-alcoxi(C_1-C_6)$, $-cicloalquilo(C_3-C_7)$, $-bicicloalquilo(C_6-C_{14})$, $-tricicloalquilo(C_8-C_{20})$, $-cicloalquenilo(C_5-C_{10})$, $-bicicloalquenilo(C_7-C_{14})$, $-tricicloalquenilo(C_8-C_{20})$, $-heterociclo$ (de 5 ó 6 miembros), o $-bicicloheterociclo$ (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados; o

(b) $-fenilo$, $-bencilo$, $-naftalenilo$, $-arilo(C_{14})$, $-alquil(C_1-C_6)-heteroarilo$ (de 5 ó 6 miembros) o $-heteroarilo$ (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_7 independientemente seleccionados;

cada Y es independientemente seleccionado de O o S;

A y B son independientemente seleccionados de:

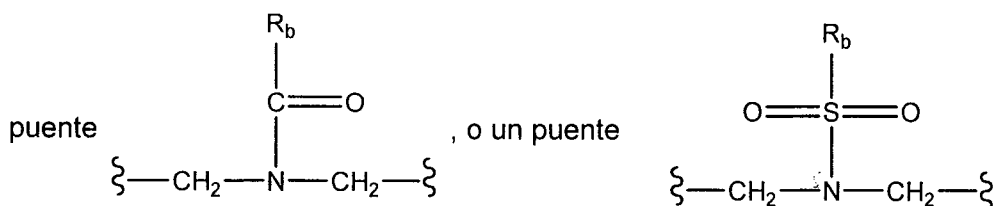
(a) $-H$, $-CN$, $-C(=O)OT_3$, o $-C(=O)N(T_1)(T_2)$; o

(b) $-cicloalquilo(C_3-C_{12})$, $-cicloalcoxi(C_3-C_{12})$, $-alquilo(C_1-C_6)$, $-alquenilo(C_2-C_6)$, $-alquinilo(C_2-C_6)$, o $-alcoxi(C_1-C_6)$, cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1 ó 2 sustituyentes independientemente seleccionados de $-OH$, $-S(=O)_2NH_2$, $-N(R_6)_2$, $=NR_6$, $-C(=O)OT_3$, $-CON(R_6)_2$, $-N(R_6)C(=O)R_9$, y $-heterociclo$ (de 5 ó 6 miembros), o 1, 2 ó 3 grupos $-halo$ independientemente seleccionados; o

(c) A-B juntos pueden formar un puente(C_2-C_6), el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes independientemente seleccionados de $-OH$, $-alquilo(C_1-C_4)$, $-halo$, y $-C(halo)_3$, y donde el puente contiene opcionalmente -

HC=CH- o -O- dentro del puente(C₂-C₆); donde el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q puede estar en la configuración *endo*- o *exo*- con respecto del puente A-B; o

(d) A-B juntos pueden formar un puente -CH₂-N(R_a)-CH₂-, un



donde el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q puede estar en la configuración *endo*- o *exo*- con respecto del puente A-B;

R_a es seleccionado de -H, -alquilo(C₁-C₆), -cicloalquilo(C₃-C₇), -CH₂-C(=O)-R_c, - (CH₂)-C(=O)-OR_c, -(CH₂)-C(=O)-N(R_c)₂, -(CH₂)₂-O-R_c, -(CH₂)₂-S(=O)₂-N(R_c)₂, R_c, o - (CH₂)₂-N(R_c)S(=O)₂-R_c;

R_b es seleccionado de:

(a) -H, -alquilo(C₁-C₆), -cicloalquilo(C₃-C₇), -heterociclo (de 3 a 7 miembros), -N(R_c)₂, -N(R_c)- cicloalquilo(C₃-C₇), o -N(R_c)-heterociclo (de 3 a 7 miembros); o

(b) -fenilo, -naftalenilo, o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R₇ independientemente seleccionados; o

(c) -N(R_c)-fenilo, -N(R_c)-naftalenilo, -N(R_c)-arilo(C₁₄), o -N(R_c)-heterociclo (de 5 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R₇ independientemente seleccionados;

cada R_c es independientemente seleccionado de -H o -alquilo(C₁-C₄);

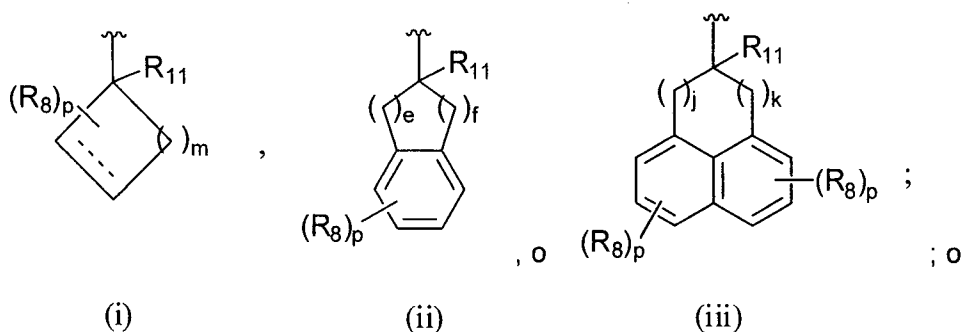
Z es -[alquilo(C₁-C₁₀) opcionalmente sustituido por R₁]_h-, donde h es 0 ó 1; -[alquenilo(C₂-C₁₀) opcionalmente sustituido por R₁]; o -alquil(C₁-C₁₀)-NR₆C(=Y)-;

cada R₁ es independientemente seleccionado de:

(a) -H, -halo, -CN, -OH, -CH₂OH, -CH₂CH₂OH, -NO₂, -N(R₆)₂, -S(=O)NH₂, -S(=O)₂NH₂, -C(=O)OV₁, o -C(=O)CN; o

(b) -alquilo(C₁-C₁₀), -alquenilo(C₂-C₁₀), -alquinilo(C₂-C₁₀), -O-alquilo(C₁-C₆), -cicloalcoxi(C₃-C₇), -bicicloalquilo(C₆-C₁₄), -tricicloalquilo(C₈-C₂₀), -cicloalquenilo(C₅-C₁₀), -bicicloalquenilo(C₇-C₁₄), -tricicloalquenilo(C₈-C₂₀), -heterociclo (de 3 a 7 miembros), -bicloheterociclo (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2, o 3 grupos R₈ independientemente seleccionados; o

(c)



(d) -fenilo, -naftalenilo, -arilo(C₁₄), o -heterociclo (de 5 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con un grupo R₇; o

-Z-R₁ es 3,3-difenilpropil- opcionalmente sustituido en el carbono de la posición 3 del propilo con -CN, -C(=O)N(R₆)₂, -C(=O)OV₁, o -tetrazolilo; o

-Z-R₁ es -alquilo(C₁-C₄) sustituido con tetrazolilo;

cada R₆ es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C₁-C₆), o -cicloalquilo(C₃-C₇), o dos grupos R₆ unidos a los mismos átomos de nitrógeno juntos pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros, donde el número de átomos en el anillo

14

incluye los átomos de nitrógeno, y en donde uno del anillo de 5 a 8 miembros átomos de carbono está opcionalmente reemplazado por O, S, o N(T₃);

cada R₇ es independientemente seleccionado de -alquilo(C₁-C₄), -alquenilo(C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), -OR₉, -SR₉, -C(halo)₃, -CH(halo)₂, -CH₂(halo), -CN, -halo, -N₃, -NO₂, -CH=N(R₉), -N(R₉)₂, -N(R₉)OH, -N(R₉)S(=O)R₁₂, -N(R₉)S(=O)₂R₁₂, -N(R₉)C(=O)R₁₂, -N(R₉)C(=O)N(T₁)(T₂), -N(R₉)C(=O)OR₁₂, -C(=O)R₉, -C(=O)N(T₁)(T₂), -C(=O)OR₉, -OC(=O)R₉, -OC(=O)N(T₁)(T₂), -OC(=O)OR₉, -S(=O)R₉, o -S(=O)₂R₉;

cada R₈ es independientemente seleccionado de -alquilo(C₁-C₄), -alquenilo(C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), -fenilo, -alquil(C₁-C₆)-COOR₉, -OR₉, -SR₉, -C(halo)₃, -CH(halo)₂, -CH₂(halo), -CN, =O, =S, -halo, -N₃, -NO₂, -CH=N(R₉), -N(R₉)alquil(C₁-C₆)-COOR₉, -N(R₉)₂, -N(R₉)OH, -N(R₉)S(=O)R₁₂, -N(R₉)S(=O)₂R₁₂, -N(R₉)C(=O)R₁₂, -N(R₉)C(=O)N(T₁)(T₂), -N(R₉)C(=O)OR₁₂, -C(=O)R₉, -C(=O)-C(=O)OR₉, -C(=O)N(T₁)(T₂), -C(=O)OR₉, -OC(=O)R₉, -OC(=O)N(T₁)(T₂), -OC(=O)OR₉, -S(=O)R₉, o -S(=O)₂R₉;

cada R₉ es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C₁-C₆), -alquenilo(C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), -cicloalquilo(C₃-C₈), -cicloalquenilo(C₅-C₈), -fenilo, -bencilo, -heterociclo (de 3 a 6 miembros), -C(halo)₃, -CH(halo)₂, o -CH₂(halo);

si h es 0, entonces R₁₁ se puede seleccionar de -H, -CN, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R₆)₂ o R₁₁ puede ser -alquilo(C₁-C₄) el cual está sustituido o no sustituido con -OH, -alcoxi(C₁-C₄), -N(R₆)₂, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R₆)₂;

si h es 1, entonces R₁₁ se puede seleccionar de -H, -CN, -OH, -halo, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R₆)₂ o R₁₁ puede ser -alquilo(C₁-C₄) el cual está sustituido o no sustituido con -OH, -alcoxi(C₁-C₄), -N(R₆)₂, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R₆)₂;

de otro modo, donde Z es -alquil(C₁-C₁₀)-NR₆C(=Y)-, entonces R₁₁ se puede seleccionar de -H, -CN, -C(=O)OR₉, o -C(=O)N(R₆)₂ o R₁₁ puede ser -alquilo(C₁-C₄) el

15
cual está sustituido o no sustituido con $-\text{OH}$, $-\text{alcoxi}(\text{C}_1\text{-C}_4)$, $-\text{N}(\text{R}_6)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$, o $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_6)_2$;

cada R_{12} es independientemente seleccionado de $-\text{H}$ o $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_4)$;

m es un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 u 11;

e y f son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4 ó 5 con la condición que $2 \leq (e + f) \leq 5$;

j y k son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3 ó 4 con la condición que $1 \leq (j + k) \leq 4$;

cada p es un número entero independientemente seleccionado de 0, 1, 2, 3 ó 4;

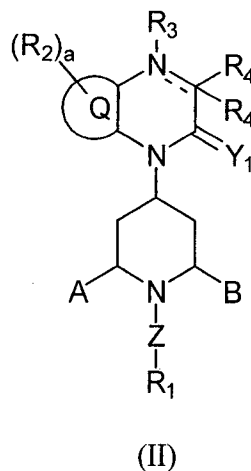
cada T_1 , T_2 , y T_3 es independientemente $-\text{H}$ o $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados y, opcionalmente, donde cualquier átomo de carbono del $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ excepto el átomo de carbono unido directamente al átomo al cual T_1 , T_2 , o T_3 se encuentra unido es independientemente reemplazado por O, S, o $\text{N}(\text{R}_6)$, o T_1 y T_2 pueden juntos formar un anillo de 5 a 8 miembros donde el número de átomos en el anillo incluye los átomos de nitrógeno a los cuales T_1 y T_2 están unidos, dicho anillo de 5 a 8 miembros está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados y, opcionalmente, cualquier átomo de carbono en dicho anillo de 5 a 8 miembros es independientemente reemplazado por O, S, o $\text{N}(\text{R}_6)$;

cada V_1 es independientemente seleccionado de $-\text{H}$, $-\text{alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{cicloalquilo}(\text{C}_3\text{-C}_7)$, $-\text{fenilo}$, o $-\text{bencilo}$; y

cada halo es independientemente seleccionado de $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, o $-\text{I}$;

con la condición que si Z es $-\text{[alquilo}(\text{C}_1\text{-C}_{10}) \text{ opcionalmente sustituido por } \text{R}_1]_h$ y $h=0$ entonces R_4 no es COOH .

3. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 2, CARACTERIZADO porque el compuesto es un compuesto de fórmula (II):



o un derivado farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, CARACTERIZADO porque Y₁ es O.

5. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, CARACTERIZADO porque cuando la línea punteada está presente, un R₄ está presente, y preferentemente R₃ está ausente.

6. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, CARACTERIZADO porque Q es seleccionado de benzo, piridino, pirimidino, pirazino, y

17

piridazino, y preferentemente Q es seleccionado de benzo y piridino, donde preferentemente las posiciones 2 y 3 del piridino se encuentran fusionadas al anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno y más preferentemente Q es benzo.

7. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, CARACTERIZADO porque a es 0.

8. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, CARACTERIZADO porque cada R_4 es independientemente seleccionado de:

(a) $-C(=Y)YX$, donde preferentemente cada Y es O y preferentemente X es -H o -alquilo(C_1-C_6); o

(b) $-N(R_9)X$, donde preferentemente X es -alquilo(C_1-C_6) sustituido con un grupo R_8 , -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) sustituido con un grupo R_8 , -fenilo sustituido con un grupo R_7 , o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) sustituido con un grupo R_7 .

9. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 8, CARACTERIZADO porque cada R_7 o R_8 es $-C(=O)OR_9$, donde preferentemente cada R_9 es -H.

10. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 8, CARACTERIZADO porque R_4 es $-C(=O)OX$ y preferentemente R_4 es $-C(=O)OH$.

11. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 8, CARACTERIZADO porque R_4 es $-N(H)X$, donde X es a -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) sustituido con un grupo R_8 , donde R_8 es $-C(=O)OR_9$ y preferentemente R_8 es $-C(=O)OH$ y preferentemente R_8 está unido a X en una posición en el anillo ya sea orto respecto de o meta respecto del punto de unión de X al N de $-N(H)X$.

12. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 8, CARACTERIZADO porque R_4 es $-N(H)X$, donde X es -alquilo(C_1-C_6) sustituido con un grupo R_8 , donde R_8 es $-C(=O)OR_9$ y preferentemente R_8 es $-C(=O)OH$.

13. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, CARACTERIZADO porque al menos un R_4 es -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-X, donde X es fenilo o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) cada uno de los cuales está sustituido con un grupo R_7 , donde preferentemente R_7 es $-C(=O)OR_9$, donde preferentemente R_9 es -H y más preferentemente R_7 es $-C(=O)OR_9$ e incluso más preferentemente R_7 está unido a X en una posición en el anillo ya sea orto respecto de o meta respecto del punto de unión de X al -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) del -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-X.

14. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, CARACTERIZADO porque al menos un R_4 es -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-alquil(C_1-C_6)-X, donde X es fenilo o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) cada uno de los cuales está sustituido con un grupo R_7 , donde preferentemente R_7 es $-C(=O)OR_9$, donde

18

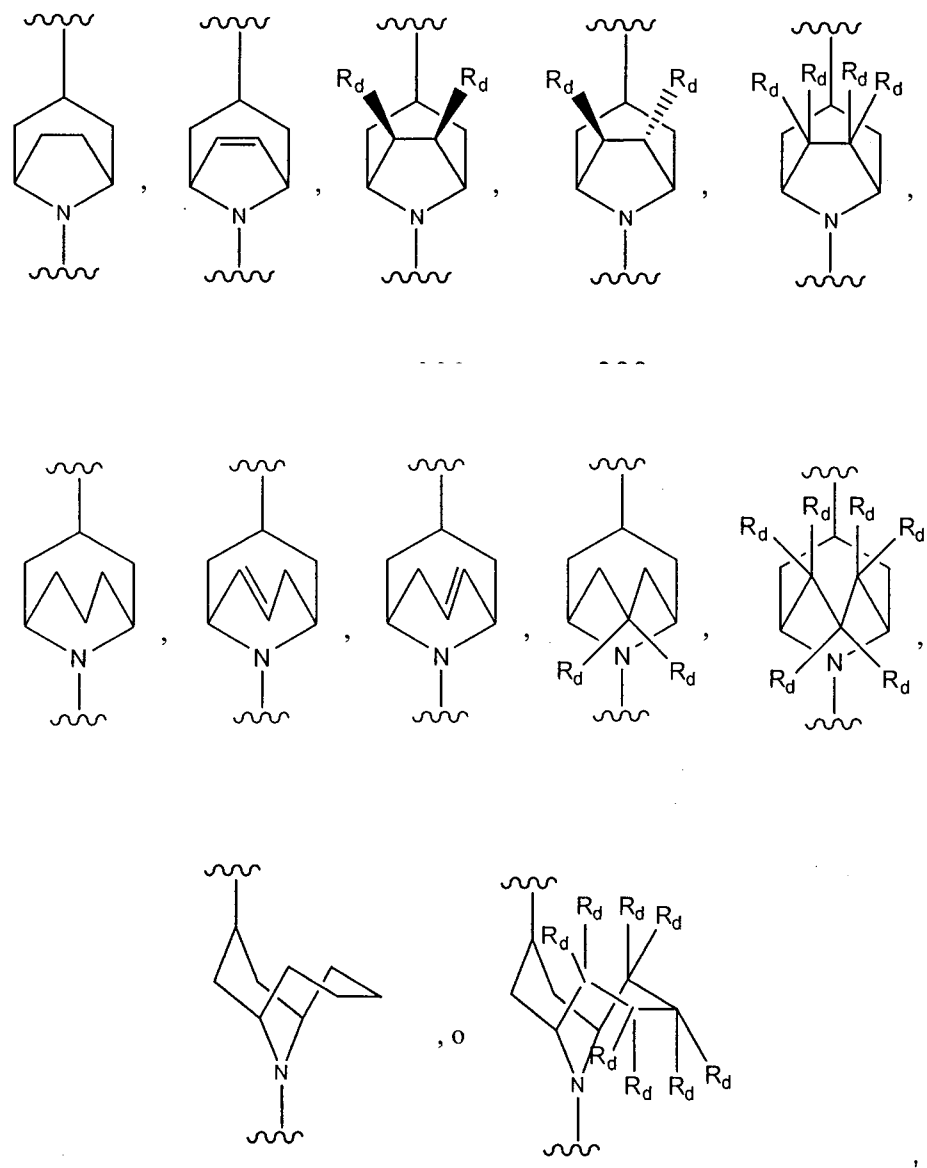
preferentemente R_9 es -H y más preferentemente el grupo $-C(=O)OR_9$ está unido al fenilo o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) en una posición en el anillo ya sea orto respecto de o meta respecto del punto de unión del fenilo o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) al alquilo(C_1-C_6) del -heterociclo (de 5 ó 6 miembros)-alquil(C_1-C_6)-X.

15. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, CARACTERIZADO porque cada R_4 es independientemente seleccionado de X, donde al menos un X es -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), cada uno de los cuales se encuentra opcionalmente sustituido con $-C(=O)OR_9$ donde preferentemente R_9 es -H, y más preferentemente el grupo $-C(=O)OR_9$ está unido al -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) en una posición en el anillo ya sea orto respecto de o meta respecto del punto de unión del -heterociclo (de 5 ó 6 miembros) o -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros) al anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q.

16. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 15, CARACTERIZADO porque al menos un X es -tetrazolilo.

17. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, CARACTERIZADO porque A y B son independientemente seleccionados de -H o -alquilo(C_1-C_6) y preferentemente A y B son cada uno -H.

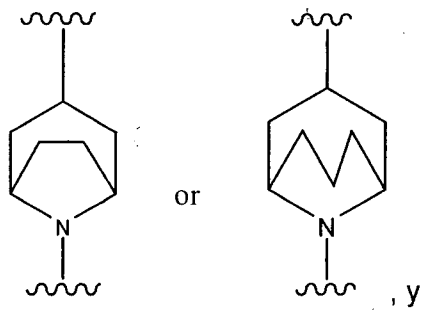
18. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, CARACTERIZADO porque A y B juntos forman un puente de modo que la piperidina puenteada es seleccionada del grupo que consiste de:



donde cada R_d es independientemente seleccionado de -H, -(C₁-C₄)alquilo, -halo, o -C(halo)₃.

20

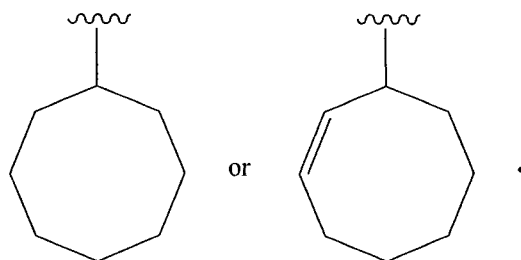
19. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 y 18, CARACTERIZADO porque A y B juntos forman un puente de modo que la piperidina puenteada es seleccionada del grupo que consiste de:



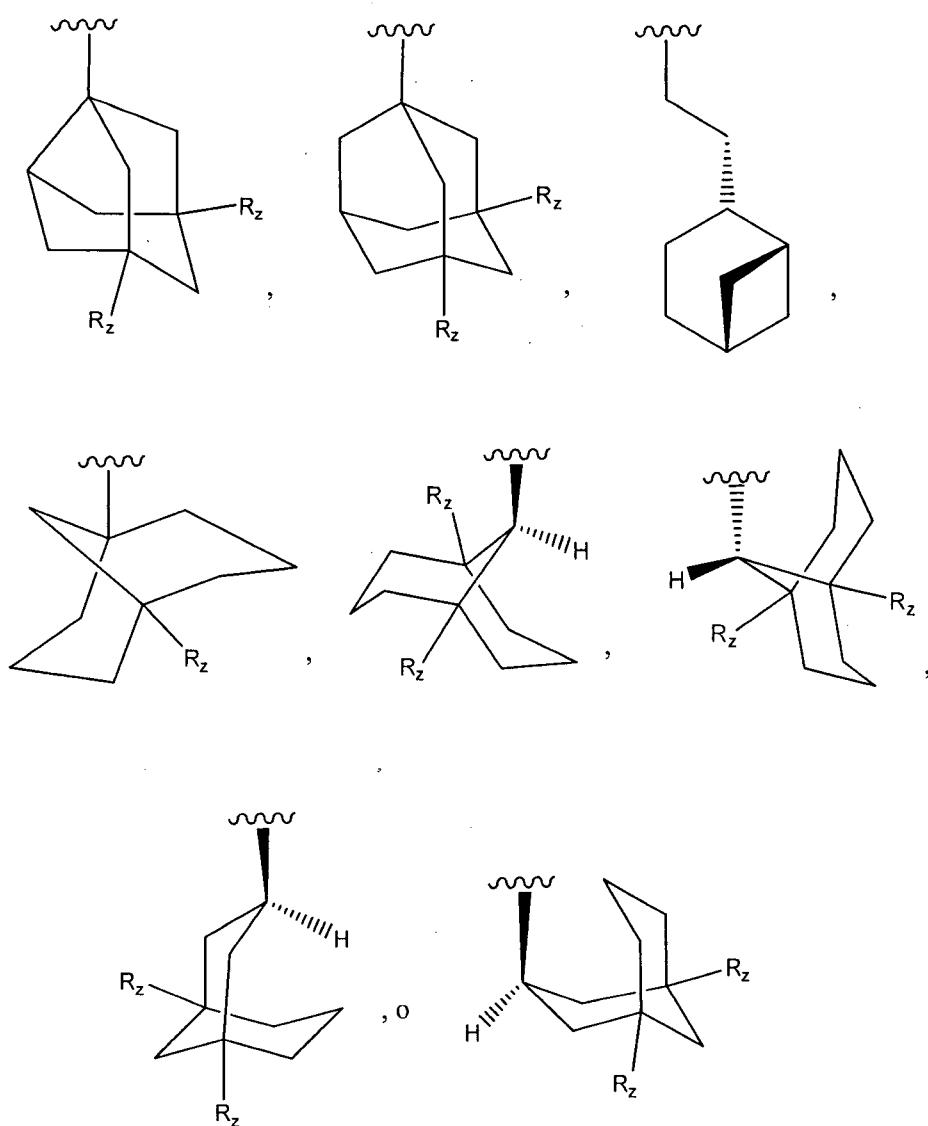
donde preferentemente, el anillo de 6 miembros que contiene nitrógeno que está fusionado al grupo Q se encuentra en la configuración *endo* con respecto del puente A-B de la piperidina puenteada.

20. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, CARACTERIZADO porque h es 0 y R₁ es -alquilo(C₁-C₁₀), -alquenilo(C₂-C₁₀), -alquinilo(C₂-C₁₀), -cicloalquil(C₃-C₁₄), -cicloalquenilo(C₃-C₁₄), -bicicloalquilo(C₆-C₁₄), -bicicloalquenilo(C₇-C₁₄), o -tricicloalquilo(C₈-C₂₀), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 o 3 grupos R₈ independientemente seleccionados y preferentemente R₁ es -cicloalquilo(C₃-C₁₄), -cicloalquenilo(C₃-C₁₄), -bicicloalquilo(C₆-C₁₄), -bicicloalquenilo(C₇-C₁₄), o -tricicloalquilo(C₈-C₂₀), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2, o 3 grupos R₈ independientemente seleccionados.

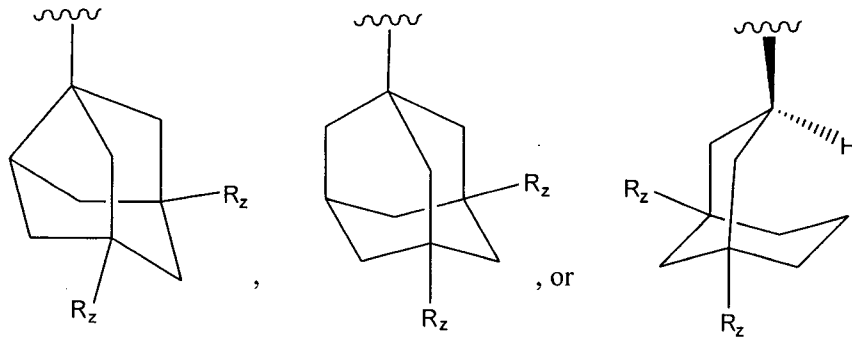
21. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, CARACTERIZADO porque h es 0 y R₁ es seleccionado del grupo que consiste de:



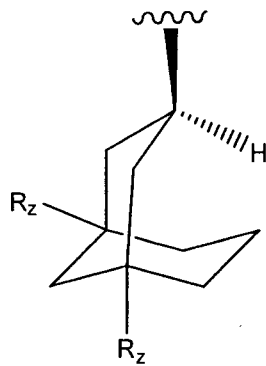
22. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, CARACTERIZADO porque h es 0 y R_1 es seleccionado del grupo que consiste de:



donde cada R_z es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_4), -OH, y -CN y preferentemente cada R_7 es independientemente seleccionado de -H y -CH₃ y donde más preferentemente h es 0 y R_1 es seleccionado del grupo que consiste de:



donde cada R_z es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_4), -OH, y -CN y preferentemente cada R_z es independientemente seleccionado de -H y -CH₃, e incluso más preferentemente h es 0 y R_1 es:



donde cada R_z es -H.

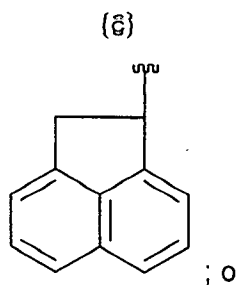
23. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, CARACTERIZADO porque a es 1 y R_2 es -halo, preferentemente R_2 es -F.

24. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, 22 y 23, CARACTERIZADO porque el grupo R_1 -se encuentra en la configuración exo con respecto del puente A-B de la piperidina puenteada.

25. El compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, CARACTERIZADO porque -Z- R_1 es seleccionado de:

(a) cicloalquilo(C_6 - C_{12}), donde preferentemente -Z- R_1 es ciclooctilo, ciclononilo, ciclodecilo, cicloundecilo, o ciclododecilo; o

(b) cicloalqueno(C_5 - C_{12}), donde preferentemente -Z- R_1 es ciclohexenilo, cicloheptenilo, o ciclooctenilo; o



(d) cicloalquilo(C_6 - C_{12}) opcionalmente sustituido por un -alquilo(C_1 - C_4).

26. El compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25, CARACTERIZADO porque el derivado farmacéuticamente aceptable es una sal farmacéuticamente aceptable.

24

27. El compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 26 CARACTERIZADO porque el derivado farmacéuticamente aceptable es una sal clorhidrato, una sal sódica o una sal de potasio.

28. Una composición, CARACTERIZADA porque que comprende una cantidad efectiva del compuesto o un derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

29. Uso de un compuesto o derivado farmacéuticamente aceptable de lo mismo de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, CARACTERIZADO porque sirve para la preparación de un medicamento para modular la función del receptor ORL-1 en una célula, que comprende poner en contacto una célula capaz de expresar al receptor ORL-1, con una cantidad efectiva del compuesto o un derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27.

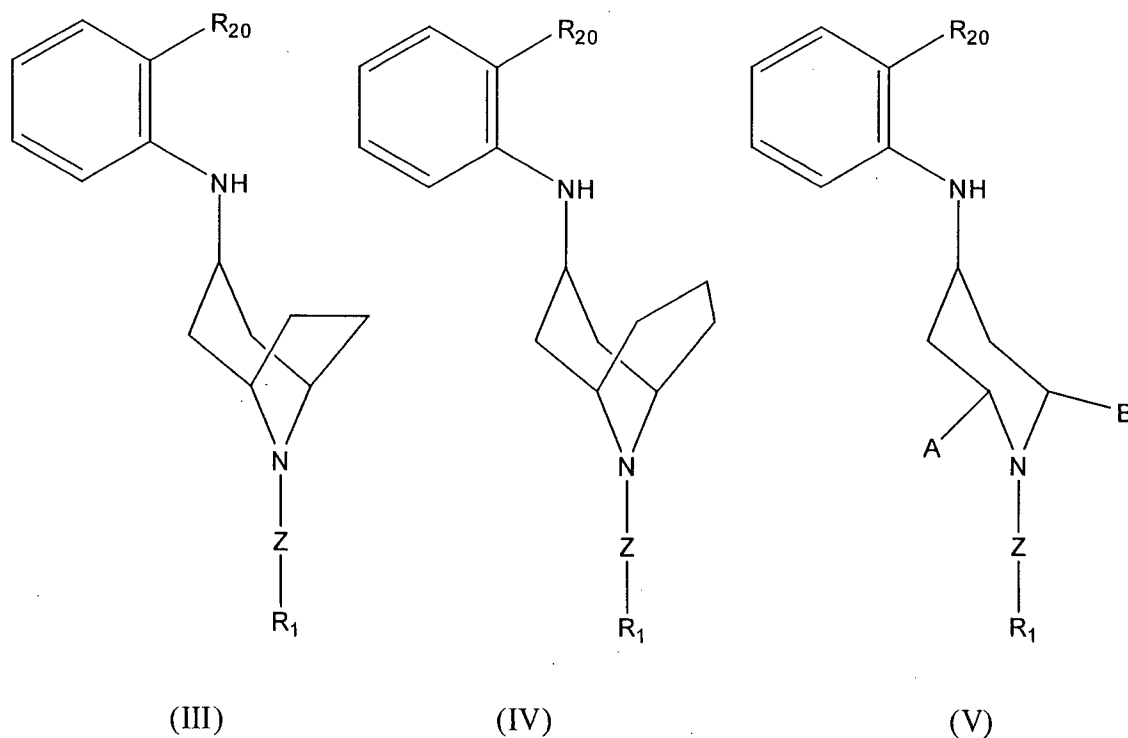
30. El uso de acuerdo a la reivindicación 29, CARACTERIZADO porque el compuesto o el derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto actúa como un agonista en el receptor ORL-1, un agonista parcial en el receptor ORL-1 o como un antagonista en el receptor ORL-1.

31. Uso de un compuesto o derivado farmacéuticamente aceptable de lo mismo de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, CARACTERIZADO porque sirve para preparar un medicamento para tratar dolor, un desorden de la memoria, obesidad, constipación, depresión, demencia, enfermedad de Parkinson, ansiedad, tos, diarrea, presión sanguínea elevada, epilepsia, anorexia/caquexia, incontinencia urinaria, o abuso de drogas en un animal, que comprende administrar a un animal que lo necesita una cantidad efectiva del compuesto o un derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27.

32. Un kit, CARACTERIZADO porque comprende un envase que contiene una cantidad efectiva del compuesto o un derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27.

33. Un método para preparar a composición, CARACTERIZADO porque comprende la etapa de mezclar un compuesto o un derivado farmacéuticamente aceptable del compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

34. Un compuesto, CARACTERIZADO porque tiene la fórmula (III), (IV), o (V):



o un derivado farmacéuticamente aceptable de lo mismo donde:

el puente C₂ o C₃ del anillo de piperidina puenteado de los compuestos de Fórmula (III) y (IV) puede estar sustituido o no sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, o 6 sustituyentes independientemente seleccionados de -OH, -alquilo(C₁-C₄), -halo, y -C(halo)₃,

A y B de Fórmula (V) son independientemente seleccionados de:

(a) -H, -CN, -C(=O)OT₃, o -C(=O)N(T)₁(T₂); o

(b) -cicloalquilo(C₃-C₁₂), -cicloalcoxi(C₃-C₁₂), -alquilo(C₁-C₆), -alquenilo(C₂-C₆), -alquinilo(C₂-C₆), o -alcoxi(C₁-C₆), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1 ó 2 sustituyentes independientemente seleccionados de -OH, -

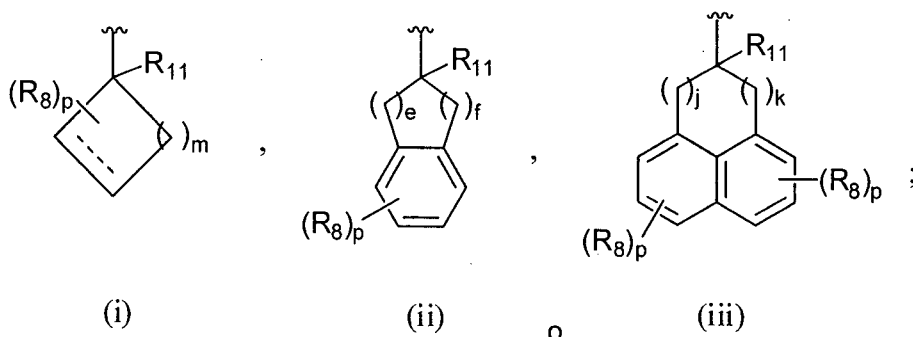
$S(=O)_2NH_2$, $-N(R_6)_2$, $=NR_6$, $-C(=O)OT_3$, $-CON(R_6)_2$, $-N(R_6)C(=O)R_9$, y -heterociclo (de 5 ó 6 miembros), o 1, 2 ó 3 grupos -halo independientemente seleccionados;

Z es -[alquilo(C_1-C_{10}) opcionalmente sustituido por R_1] $_h$ -, donde h es 0 ó 1; o -[alquenil(C_1-C_{10}) opcionalmente sustituido por R_1] o -alquil(C_1-C_{10})- $NR_6C(=Y)-$;

R_1 es seleccionado de

(a) -alquilo(C_1-C_{10}), -alquenilo(C_2-C_{10}), -alquinilo(C_2-C_{10}), -O-alquilo(C_1-C_6), -cicloalcoxi(C_3-C_7), -bicicloalquilo(C_6-C_{14}), -tricicloalquilo(C_8-C_{20}), -cicloalquenilo(C_5-C_{10}), -bicicloalquenilo(C_7-C_{14}), -tricicloalquenilo(C_8-C_{20}), -heterociclo (de 3 a 7 miembros), -bicicloheterociclo (de 7 a 10 miembros), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados R_8 grupos; o

(b)



-Z- R_1 es 3,3-difenilpropil- opcionalmente sustituido en el carbono de la posición 3 del propilo con $-CN$, $-C(=O)N(R_6)_2$, $-C(=O)OV_1$, o -tetrazolilo; o

-Z- R_1 es -alquilo(C_1-C_4) sustituido con tetrazolilo;

cada R_6 es independientemente seleccionado de $-H$, -alquilo(C_1-C_6), o -cicloalquilo(C_3-C_7), o dos R_6 grupos unidos a los mismos átomos de nitrógeno juntos pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros, donde el número de átomos en el anillo incluye los átomos de nitrógeno, y en donde uno del anillo de 5 a 8 miembros átomos de carbono es opcionalmente reemplazado por O, S, o N(T_3);

cada R_7 es independientemente seleccionado de -alquilo(C_1-C_4), -alquenilo(C_2-C_6), -alquinilo(C_2-C_6), $-OR_9$, $-SR_9$, $-C(halo)_3$, $-CH(halo)_2$, $-CH_2(halo)$, $-CN$, $-halo$, $-N_3$, $-NO_2$, $-CH=N(R_9)$, $-N(R_9)_2$, $-N(R_9)OH$, $-N(R_9)S(=O)R_{12}$, $-N(R_9)S(=O)_2R_{12}$, $-N(R_9)C(=O)R_{12}$, $-N(R_9)C(=O)N(T_1)(T_2)$, $-N(R_9)C(=O)OR_{12}$, $-C(=O)R_9$, $-C(=O)N(T_1)(T_2)$, $-C(=O)OR_9$, $-OC(=O)R_9$, $-OC(=O)N(T_1)(T_2)$, $-OC(=O)OR_9$, $-S(=O)R_9$, o $-S(=O)_2R_9$;

cada R_8 es independientemente seleccionado de -alquilo(C_1-C_4), -alquenilo(C_2-C_6), -alquinilo(C_2-C_6), -heteroarilo (de 5 ó 6 miembros), -fenilo, -alquil(C_1-C_6)- $COOR_9$, $-OR_9$, $-SR_9$, $-C(halo)_3$, $-CH(halo)_2$, $-CH_2(halo)$, $-CN$, $=O$, $=S$, $-halo$, $-N_3$, $-NO_2$, $-CH=N(R_9)$, $-N(R_9)alquil(C_1-C_6)$, $-COOR_9$, $-C(=O)-C(=O)OR_9$, $-N(R_9)_2$, $-N(R_9)OH$, $-N(R_9)S(=O)R_{12}$, $-N(R_9)S(=O)_2R_{12}$, $-N(R_9)C(=O)R_{12}$, $-N(R_9)C(=O)N(T_1)(T_2)$, $-N(R_9)C(=O)OR_{12}$, $-N(alquil(C_1-C_6)-C(=O)OR_9)_2$, $-C(=O)R_9$, $-C(=O)-C(=O)OR_9$, $-C(=O)N(T_1)(T_2)$, $-C(=O)OR_9$, $-OC(=O)R_9$, $-OC(=O)N(T_1)(T_2)$, $-OC(=O)OR_9$, $-S(=O)R_9$, o $-S(=O)_2R_9$;

cada R_9 es independientemente seleccionado de $-H$, -alquilo(C_1-C_6), -alquenilo(C_2-C_6), -alquini(C_2-C_6)o, -cicloalquilo(C_3-C_8), -cicloalquenilo(C_5-C_8), -fenilo, -bencilo, -heterociclo (de 3 a 6 miembros), $-C(halo)_3$, $-CH(halo)_2$, o $-CH_2(halo)$;

si h es 0, entonces R_{11} se puede seleccionar de $-H$, $-CN$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$ o R_{11} puede ser -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con $-OH$, -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$;

si h es 1, entonces R_{11} se puede seleccionar de $-H$, $-CN$, $-OH$, $-halo$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$ o R_{11} puede ser -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con $-OH$, -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$;

de otro modo, donde Z es -alquil(C_1-C_{10})- $NR_6C(=Y)-$, entonces R_{11} se puede seleccionar de $-H$, $-CN$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$ o R_{11} puede ser -alquilo(C_1-C_4) el cual está sustituido o no sustituido con $-OH$, -alcoxi(C_1-C_4), $-N(R_6)_2$, $-C(=O)OR_9$, o $-C(=O)N(R_6)_2$;

cada R_{12} es independientemente seleccionado de $-H$ o -alquilo(C_1-C_4);

R_{20} es seleccionado de NO_2 o NH_2 ,

m es un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 u 11;

e y f son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4 ó 5 con la condición que $2 \leq (e + f) \leq 5$;

j y k son cada uno un número entero seleccionado de 0, 1, 2, 3 ó 4 con la condición que $1 \leq (j + k) \leq 4$;

cada p es un número entero independientemente seleccionado de 0, 1, 2, 3 ó 4;

cada T_1 , T_2 , y T_3 es independientemente -H o -alquilo(C_1-C_{10}) el cual está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados R_8 grupos y, opcionalmente, en donde cualquier átomo de carbono del -alquilo(C_1-C_{10}) a excepción del átomo de carbono unido directamente al átomo al cual T_1 , T_2 , o T_3 se encuentra unido, es independientemente reemplazado por O, S, o $N(R_6)$, o T_1 y T_2 pueden juntos formar un anillo de 5 a 8 miembros donde el número de átomos en el anillo incluye los átomos de nitrógeno a los cuales T_1 y T_2 están unidos, dicho anillo de 5 a 8 miembros se encuentra sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados y, opcionalmente, cualquier átomo de carbono en dicho anillo de 5 a 8 miembros es independientemente reemplazado por O, S, o $N(R_6)$;

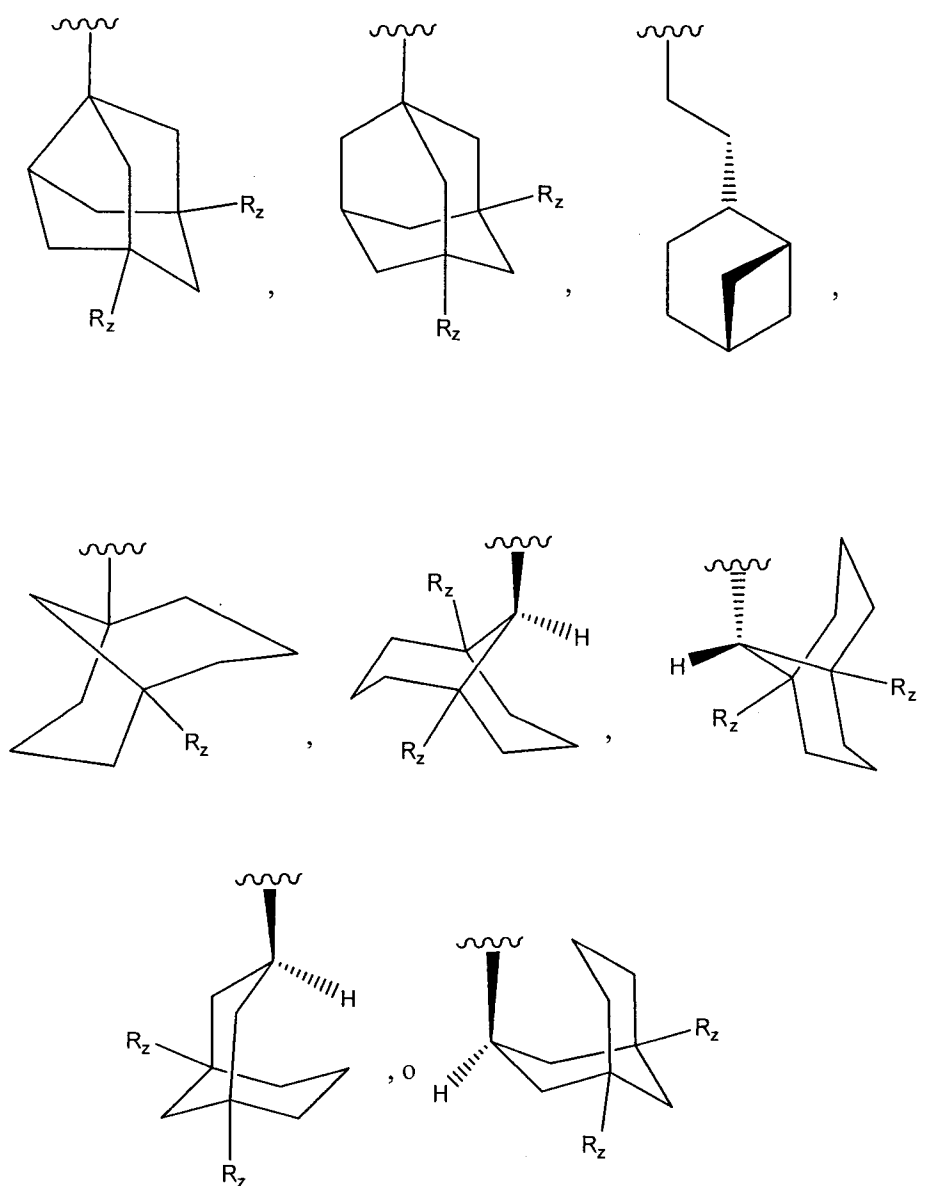
cada V_1 es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_6), -cicloalquilo(C_3-C_7), -fenilo, o -bencilo; y

cada halo es independientemente seleccionado de -F, -Cl, -Br, o -I.

35. El compuesto de acuerdo a la reivindicación 34, CARACTERIZADO porque h es 0 y R_1 es -alquilo(C_1-C_{10}), -alquenilo(C_2-C_{10}), -alquinilo(C_2-C_{10}), -cicloalquilo(C_3-C_{14}), -cicloalquenilo(C_3-C_{14}), -bicicloalquilo(C_6-C_{14}), -bicicloalquenilo(C_7-C_{14}), o -tricicloalquilo(C_8-C_{20}), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con

1, 2 ó 3 grupos independientemente seleccionados R_8 grupos y preferentemente R_1 es - cicloalquilo(C_3-C_{14}), cicloalquenilo-(C_3-C_{14}), -bicicloalquilo(C_6-C_{14}), bicicloalquenilo-(C_7-C_{14}), o -tricicloalquilo(C_8-C_{20}), cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1, 2 ó 3 grupos R_8 independientemente seleccionados.

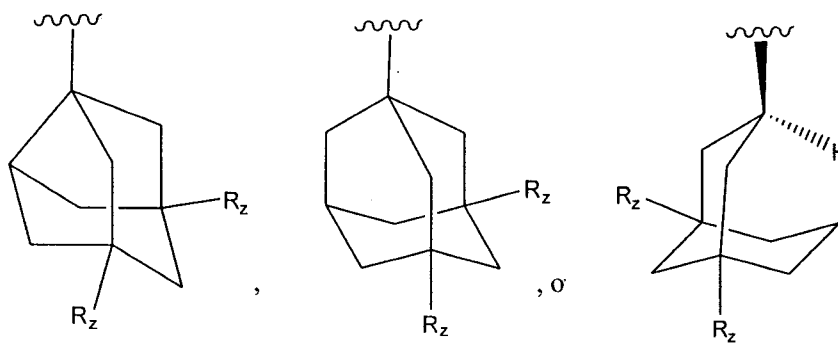
36. El compuesto de acuerdo cualquiera de las reivindicaciones 34 y 35, CARACTERIZADO porque h es 0 y R_1 es seleccionado del grupo que consiste de:



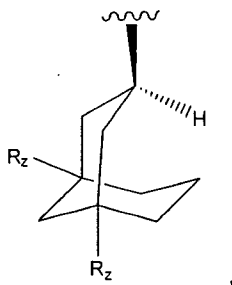
(3)

donde cada R_z es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_4), -OH, y -CN y preferentemente cada R_z es independientemente seleccionado de -H y -CH₃ y preferentemente

h es 0 y R_1 es seleccionado del grupo que consiste de:



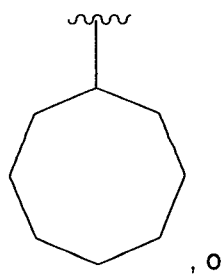
donde cada R_z es independientemente seleccionado de -H, -alquilo(C_1-C_4), -OH, y -CN y preferentemente cada R_z es independientemente seleccionado de -H y -CH₃ y más preferentemente h es 0 y R_1 es:



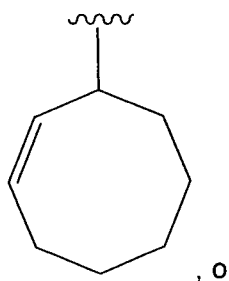
donde cada R_z es -H.

37. El compuesto de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 34 ó 35, CARACTERIZADO porque -Z- R_1 es seleccionado de:

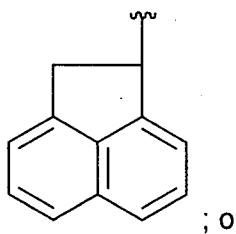
(a) cicloalquilo(C_6-C_{12}), donde preferentemente -Z- R_1 es ciclooctilo, ciclononilo, ciclodecilo, cicloundecilo, o ciclododecilo; y preferentemente es



(b) cicloalquenilo(C_5-C_{12}), donde preferentemente -Z- R_1 es ciclohexenilo, cicloheptenilo, o ciclooctenilo; y preferentemente es



(c)



(d) cicloalquilo(C_6-C_{12}) opcionalmente sustituido por un -alquilo(C_1-C_4), y preferentemente -Z- R_1 es cicloundecilo.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0021791

Bogotá D.C., Marzo 09 de 2011 - 12:26:45

RECIBIDO DE : CASTILLO GRAU & ASOCIADOS LTDA.

NI 800.098.704

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	378727823	09/03/2011	965.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
27	50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	27.000.00	729.000.00
				<u>\$729.000.00</u>

SON: **SETECIENTOS VEINTINUEVE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035578- -00004-0000

Fecha: 2011-03-09 12:47:31 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 34

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

Marzo 9 de 2011 - 12:26:46

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0021790

Bogotá D.C., Marzo 09 de 2011 - 12:26:45

RECIBIDO DE : CASTILLO GRAU & ASOCIADOS LTDA.

NI 800.098.704

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	378727823	09/03/2011	965.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	118.000.00	118.000.00
				\$118.000.00

SON: **CIENTO DIECIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-035578- -00004-0000

Fecha: 2011-03-09 12:47:31 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 34

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

Marzo 9 de 2011 - 12:26:46