

(Examen de Forma)

-

U se selecciona del grupo que consiste en OR^6 , SR^6 , $N(R^6)_2$, $(C_1-C_8)alquil-N(R^6)_2$, $(C_5-C_{12})arilo$, heteroarilo de 5-12 miembros, $(C_3-C_{10})cicloalquilo$, heterocicilo de 3-12

miembros, (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)heteroalquilo y (C₁-C₈)haloalquilo, en donde U no es CH₂-hidroxi si m+n=0, y en donde U no es hidroxi si m+n=1, y R³ es hidrógeno, en donde U se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno independientemente, de (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁶)₂, O(C₂-C₈)alquil-N(R⁶)₂, (C₁-C₈)haloalquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR⁶, N(R⁶)₂ y SO₂R⁶, y en donde cada R⁶ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁷)₂, en donde cada R⁷ es hidrógeno o (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R⁶ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

V es N o C, en donde, si V forma un enlace doble, V es carbono;

W es N o C, en donde, si W forma un enlace doble, W es carbono;

X es N o C, en donde, si X forma un enlace doble, X es carbono;

Y es CR¹⁰, N, NR¹⁰, O o S, en donde cada R¹⁰ se selecciona independientemente de hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, SH, S-(C₁-C₈)alquilo y N(R¹¹)₂ si Y es CR¹⁰, en donde Y forma un [omisión en el texto fuente] doble con un miembro del anillo adyacente, cuando Y es CR¹⁰ o N, y en donde cada R¹¹ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R¹¹ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o Y es C(R¹⁰)₂, y los dos R¹⁰ y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

Z es CR¹², N, NR¹², O o S, en donde R¹² se selecciona independientemente de hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, fluoro, cloro, bromo, SH, S-(C₁-C₈)alquilo y N(R¹³)₂, en donde Z forma un enlace doble con un miembro del anillo adyacente si es CR¹² o N, en donde cada R¹³ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R¹³ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, y en donde Z no es NR¹² si X es N, V es C, W es C e Y es CR¹⁰, o Z es C(R¹²)₂, y los dos R¹² y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

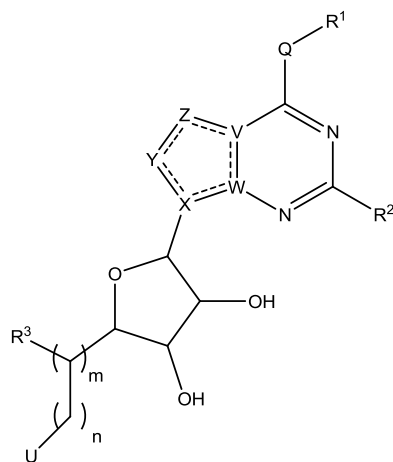
cada ----- es un enlace opcional, en donde no más de dos ----- no adyacentes pueden

estar presentes;

m es 0-1; y

n es 0-1.

2. Un compuesto de Fórmula (I):



(I)

o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) haloalquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR^4 , SR^4 y $N(R^4)_2$, en donde cada R^4 es independientemente A- R^{14} , en donde A está ausente, (C_1-C_3) alquilo, $-C(O)-$ o $-SO_2-$, y R^{14} es hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R^4 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

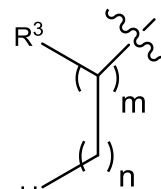
R^2 es hidrógeno, halógeno, (C_1-C_8) alquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi o $N(R^5)_2$, en donde cada R^5 es independientemente hidrógeno o (C_1-C_8) alquilo, o dos R^5 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

R^3 es hidrógeno, hidroxilo o NH_2 , o R^3 está ausente si m es 0;

Q está ausente o es una porción divalente seleccionada de O, S, NH y (C_1-C_8) alquilenilo;

U se selecciona del grupo que consiste en OR^6 , SR^6 , $N(R^6)_2$, (C_1-C_8) alquil- $N(R^6)_2$,

(C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)heteroalquilo y (C₁-C₈)haloalquilo, en donde U no es CH₂-hidroxi si m+n=0, y en donde U no es hidroxi si m+n=1, y R³ es hidrógeno, en donde U se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno independientemente, de (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁶)₂, O(C₂-C₈)alquil-N(R⁶)₂, (C₁-C₈)haloalquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR⁶, N(R⁶)₂ y SO₂R⁶, y en donde cada R⁶ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁷)₂, en donde cada R⁷ es hidrógeno o (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R⁶ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos



seleccionados de N, O y S, en donde, si -Q-R¹ es NH₂ o H, no es -CH₂-SH, -CH₂-S-(C₁-C₈ alquilo), -CH₂-NH₂, -CH₂(H)(C₁-C₈alquilo o -CH₂-(C₁-C₈ alquilo)₂;

V es N o C, en donde, si V forma un enlace doble, V es carbono;

W es N o C, en donde, si W forma un enlace doble, W es carbono;

X es N o C, en donde, si X forma un enlace doble, X es carbono;

Y es CR¹⁰, N, NR¹⁰, O o S, en donde cada R¹⁰ se selecciona independientemente de hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, SH, S-(C₁-C₈)alquilo y N(R¹¹)₂ si Y es CR¹⁰, en donde Y forma un [omisión en el texto fuente] doble con un miembro del anillo adyacente, cuando Y es CR¹⁰ o N, y en donde cada R¹¹ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R¹¹ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o Y es C(R¹⁰)₂, y los dos R¹⁰ y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

Z es CR¹², N, NR¹², O o S, en donde R¹² se selecciona independientemente de hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, hidroxi, (C₁-C₈)alcoxi, fluoro, cloro, bromo, SH, S-(C₁-

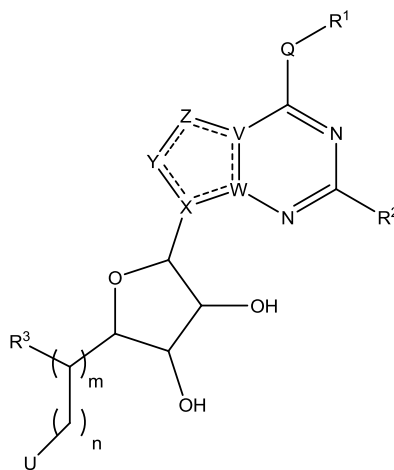
C_8)alquilo y $N(R^{13})_2$, en donde Z forma un enlace doble con un miembro del anillo adyacente si es CR^{12} o N, en donde cada R^{13} es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R^{13} se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, y en donde Z no es NR^{12} si X es N, V es C, W es C e Y es CR^{10} , o Z es $C(R^{12})_2$, y los dos R^{12} y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

cada ----- es un enlace opcional, en donde no más de dos ----- no adyacentes pueden estar presentes;

m es 0-1; y

n es 0-1.

3. Un compuesto de la Fórmula (I):



(I)

o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) haloalquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR^4 , SR^4 y $N(R^4)_2$, en donde cada R^4 es independientemente A- R^{14} , en donde A está ausente, (C_1-C_3) alquilo, $-C(O)-$ o $-SO_2-$, y R^{14} es hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R^4 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

R^2 es hidrógeno, halógeno, (C_1-C_8) alquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi o $N(R^5)_2$, en

donde cada R^5 es independientemente hidrógeno o (C_1-C_8) alquilo, o dos R^5 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

R^3 es hidrógeno, hidroxilo o NH_2 , o R^3 está ausente si m es 0;

Q está ausente o es una porción divalente seleccionada de O, S, NH y (C_1-C_8) alquilenos;

U se selecciona del grupo que consiste en OR^6 , (C_1-C_8) alquil- $N(R^6)_2$, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) heteroalquilo y (C_1-C_8) haloalquilo, en donde U no es CH_2 -hidroxilo si $m+n=0$, y en donde U no es hidroxilo si $m+n=1$, y R^3 es hidrógeno, en donde U se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno independientemente, de (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) alquil- $N(R^6)_2$, $O(C_2-C_8)$ alquil- $N(R^6)_2$, (C_1-C_8) haloalquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, halógeno, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR^6 , $N(R^6)_2$ y SO_2R^6 , y en donde cada R^6 es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) alquil- $N(R^7)_2$, en donde cada R^7 es hidrógeno o (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R^6 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

V es N o C, en donde, si V forma un enlace doble, V es carbono;

W es N o C, en donde, si W forma un enlace doble, W es carbono;

X es N o C, en donde, si X forma un enlace doble, X es carbono;

Y es CR^{10} , N, NR^{10} , O o S, en donde cada R^{10} se selecciona independientemente de hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, halógeno, SH, S- (C_1-C_8) alquilo y $N(R^{11})_2$ si Y es CR^{10} , en donde Y forma un [omisión en el texto fuente] doble con un miembro del anillo adyacente, cuando Y es CR^{10} o N, y en donde cada R^{11} es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R^{11} se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, o Y es $C(R^{10})_2$, y los dos R^{10} y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

Z es CR^{12} , N, NR^{12} , O o S, en donde R^{12} se selecciona independientemente de hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, fluoro, cloro, bromo, SH, S- $(C_1-$

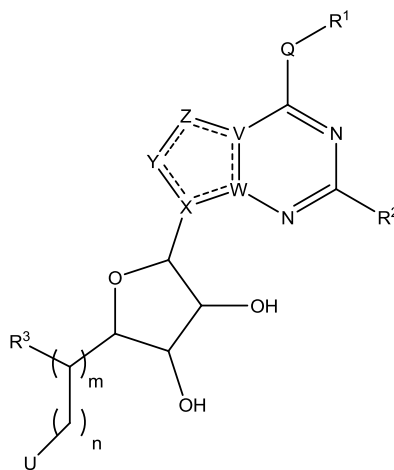
C_8)alquilo y $N(R^{13})_2$, en donde Z forma un enlace doble con un miembro del anillo adyacente si es CR^{12} o N, en donde cada R^{13} es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, o dos R^{13} se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, y en donde Z no es NR^{12} si X es N, V es C, W es C e Y es CR^{10} , o Z es $C(R^{12})_2$, y los dos R^{12} y el carbono al que están asociados forman un carbonilo o un tiocarbonilo;

cada ----- es un enlace opcional, en donde no más de dos ----- no adyacentes pueden estar presentes;

m es 0-1; y

n es 0-1.

4. Un compuesto de la Fórmula (I):



(I)

o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) haloalquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR^4 , SR^4 y $N(R^4)_2$, en donde cada R^4 es independientemente A- R^{14} , en donde A está ausente, (C_1-C_3) alquilo, $-C(O)-$ o $-SO_2-$, y R^{14} es hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R^4 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

R^2 es hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo o $N(R^5)_2$, en donde cada R^5 es independientemente

hidrógeno o (C₁-C₈)alquilo, o dos R⁵ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

R³ es hidrógeno, hidroxilo o NH₂, o R³ está ausente si m es 0;

Q está ausente o es una porción divalente seleccionada de O, S, NH y (C₁-C₈)alquilenos;

U es (C₅-C₁₂)arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, en donde U se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno independientemente, de (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁶)₂, O(C₂-C₈)alquil-N(R⁶)₂, (C₁-C₈)haloalquilo, hidroxilo, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR⁶, N(R⁶)₂ y SO₂R⁶, en donde cada R⁶ es independientemente hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, (C₁-C₈)alquil-N(R⁷)₂, en donde cada R⁷ es hidrógeno o (C₁-C₈)alquilo, (C₅-C₁₂)arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C₃-C₁₀)cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R⁶ se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

V es N o C, en donde, si V forma un enlace doble, V es carbono;

W es N o C, en donde, si W forma un enlace doble, W es carbono;

X es N o C, en donde, si X forma un enlace doble, X es carbono;

Y es CH, C(O), C(S), N o NR¹⁰, en donde R¹⁰ es hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo, hidroxilo, (C₁-C₈)alcoxi, halógeno, SH, S-(C₁-C₈)alquilo, y en donde Y forma un [omisión en el texto fuente] doble con un miembro del anillo adyacente si es CH o N;

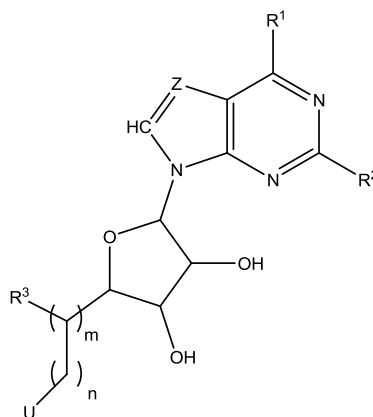
Z es CR¹², N, NR¹² u O, en donde cada R¹² es hidrógeno, (C₁-C₈)alquilo o halógeno, y en donde Z forma un enlace doble con un miembro del anillo adyacente si es CR¹² o N;

cada ----- es un enlace opcional, en donde no más de dos ----- no adyacentes pueden estar presentes;

m es 0-1; y

n es 0-1.

5. Un compuesto de la Fórmula (II):



(II)

o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, en donde:

R^1 se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_8) alquilo, $N(R^4)_2$ o (C_3-C_{10}) cicloalquilo, en donde cada R^4 es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo o heteroarilo de 5-12 miembros;

R^2 es hidrógeno, metilo o NH_2 ;

R^3 es hidroxilo o NH_2 ;

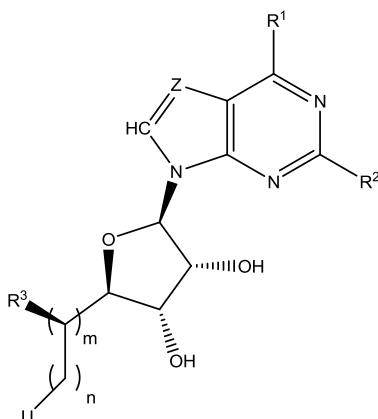
U es (C_5-C_{12}) arilo o heteroarilo de 5-12 miembros, en donde U se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados, cada uno independientemente, de (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) alquil- $N(R^6)_2$, $O(C_2-C_8)$ alquil- $N(R^6)_2$, (C_1-C_8) haloalquilo, hidroxilo, (C_1-C_8) alcoxi, halógeno, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo, heterociclilo de 3-12 miembros, OR^6 , $N(R^6)_2$ y SO_2R^6 , en donde cada R^6 es independientemente hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo, (C_1-C_8) alquil- $N(R^7)_2$, en donde cada R^7 es hidrógeno o (C_1-C_8) alquilo, (C_5-C_{12}) arilo, heteroarilo de 5-12 miembros, (C_3-C_{10}) cicloalquilo o heterociclilo de 3-12 miembros, o dos R^6 se unen para formar un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S;

Z es CR^{12} , en donde cada R^{12} es hidrógeno, (C_1-C_8) alquilo o halógeno;

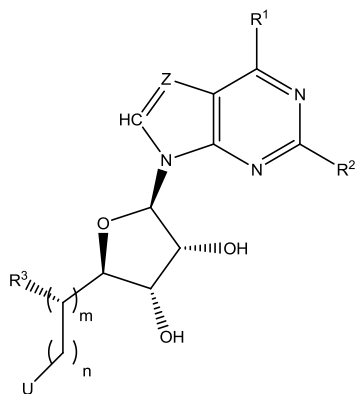
m es 0-1; y

n es 0-1.

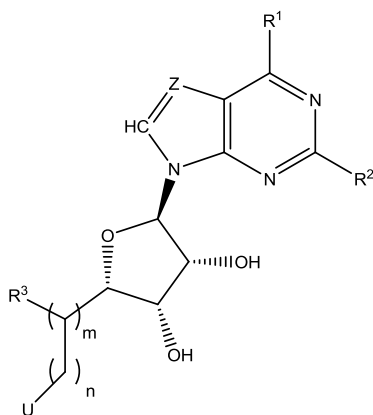
6. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 5, en donde la Fórmula (II) es:



7. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 5, en donde la Fórmula (II) es:

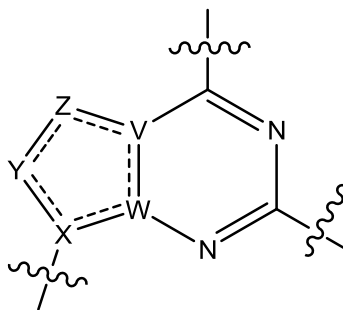


8. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 seleccionado entre:

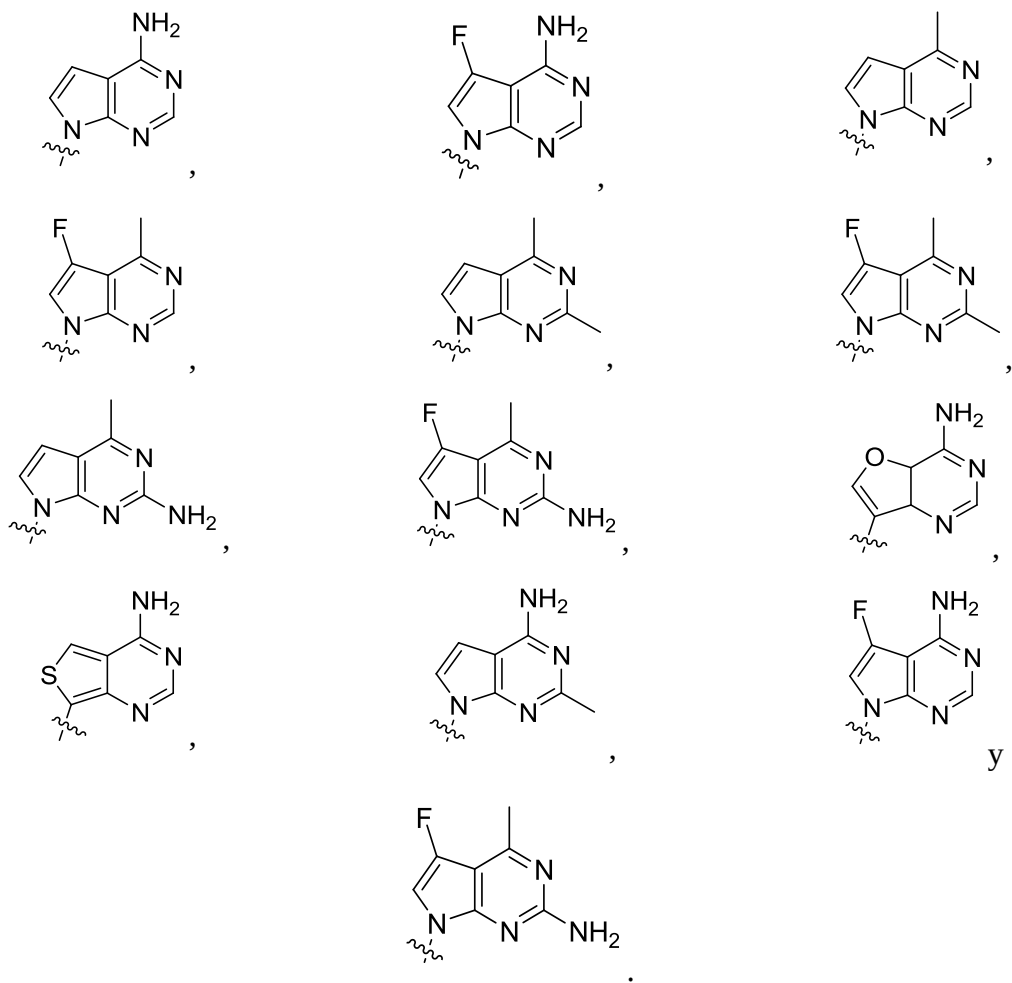


9. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es NH_2 , Z es CF, R^2 es hidrógeno, R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
10. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es NH_2 , Z es CH, R^2 es hidrógeno, R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
11. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es CH_3 , Z es CH, R^2 es hidrógeno, R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
12. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es CH_3 , Z es CF, R^2 es hidrógeno, R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
13. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es CH_3 , Z es CH, R^2 es NH_2 , R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
14. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde R^1 es CH_3 , Z es CH, R^2 es CH_3 , R^3 es hidroxilo, m es 1, y n es 0.
15. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, en donde U se sustituye opcionalmente con (C₅-C₁₂)arilo o heteroarilo de 5-12 miembros.

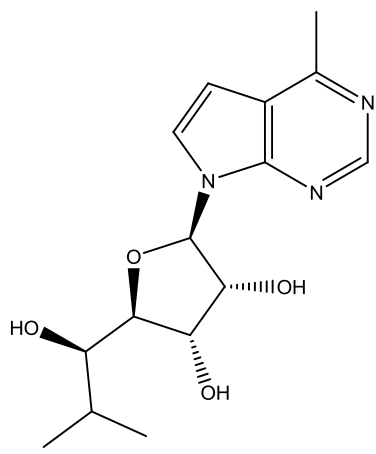
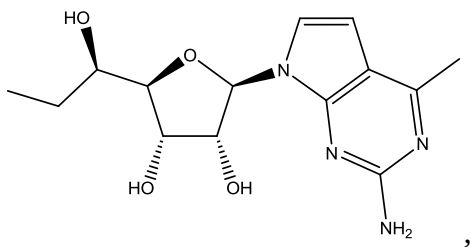
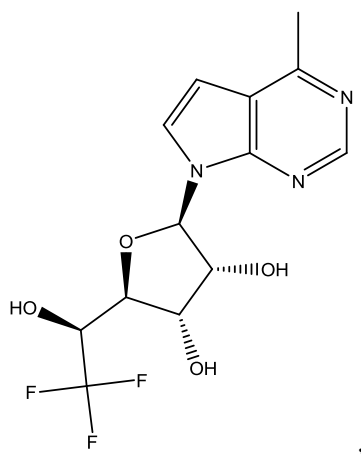
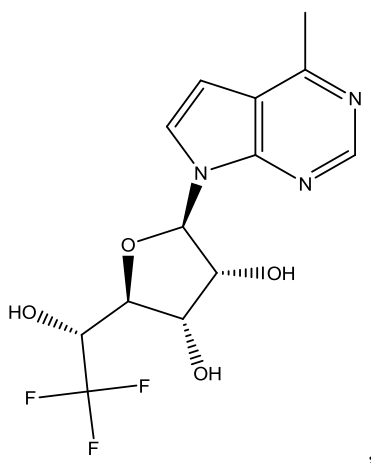
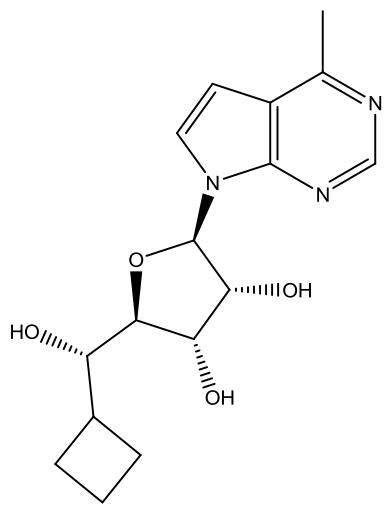
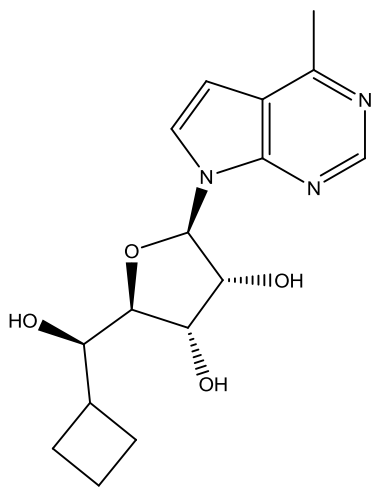
16. El compuesto o la sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-3, en donde

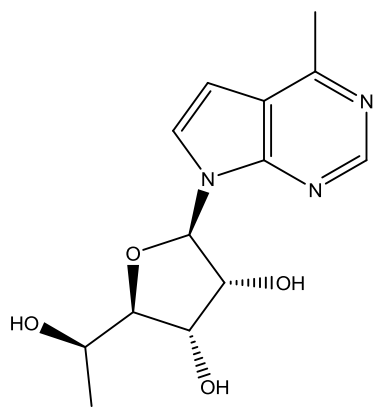
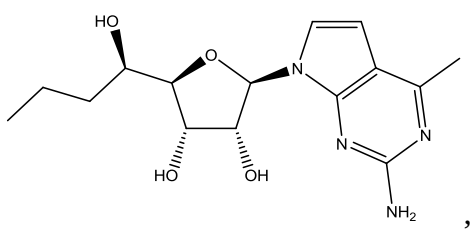
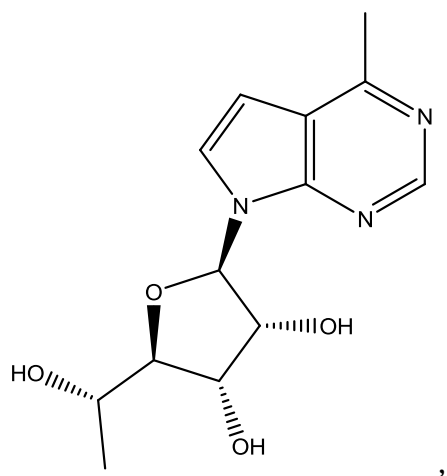
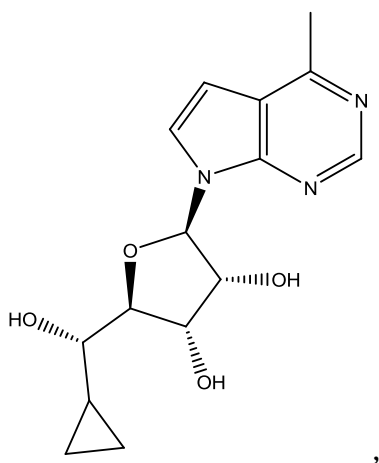
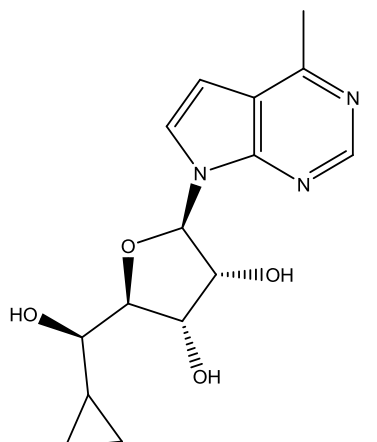
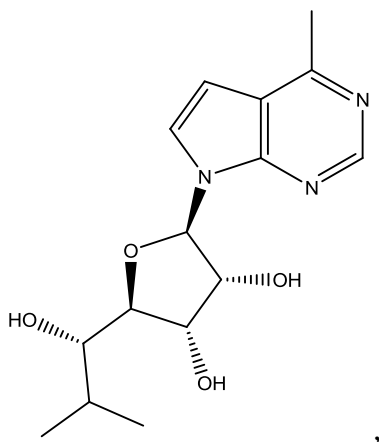


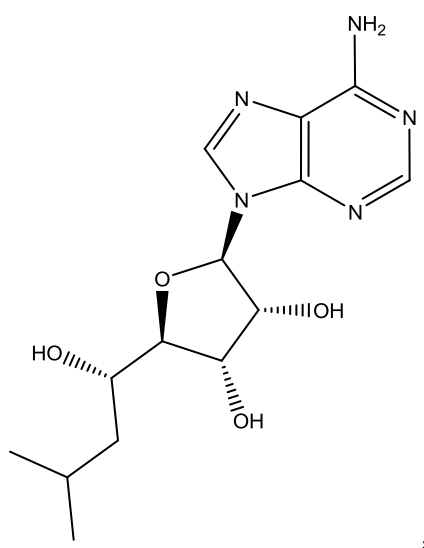
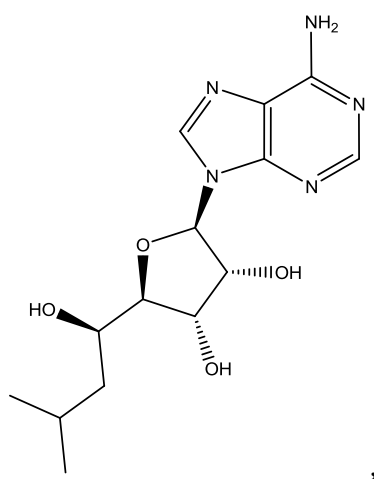
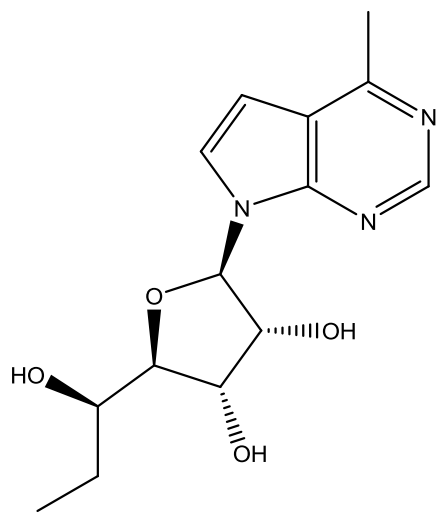
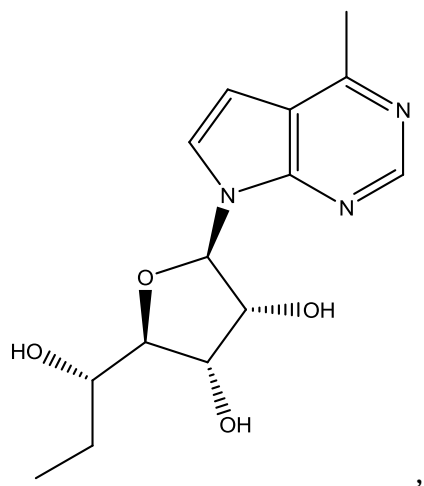
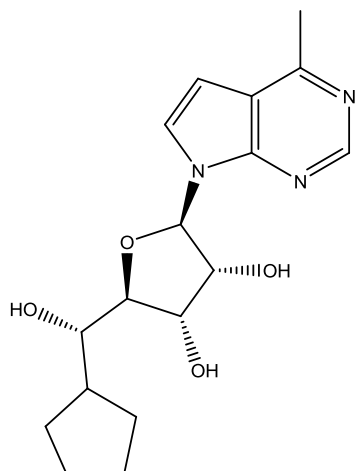
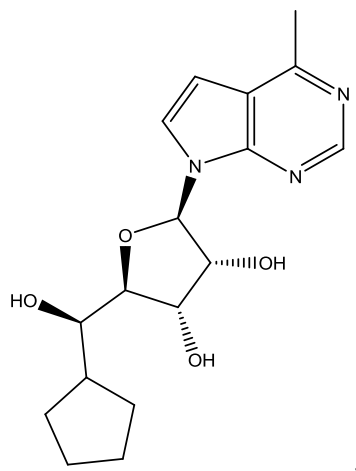
se selecciona de:

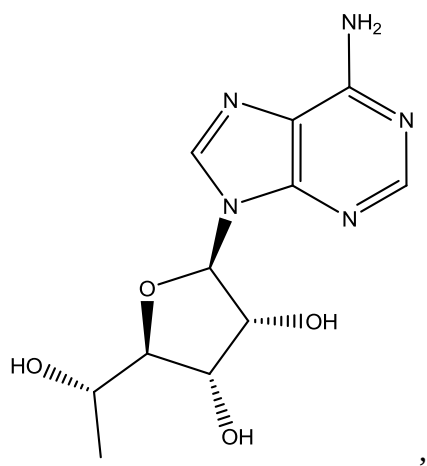
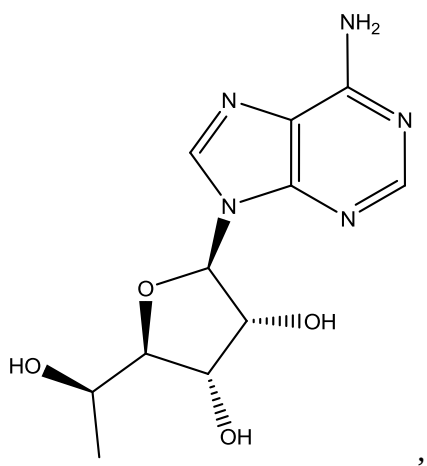
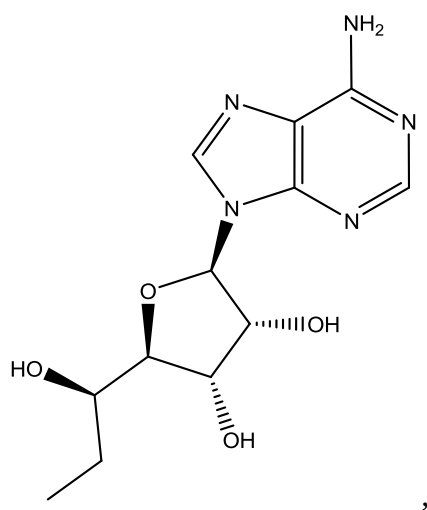
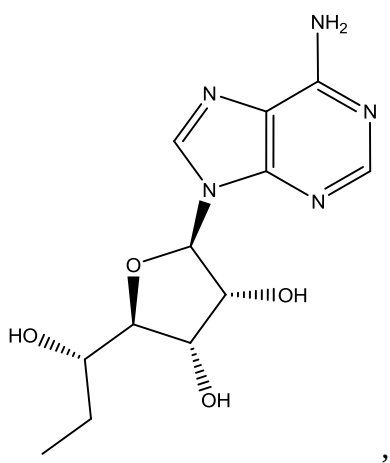
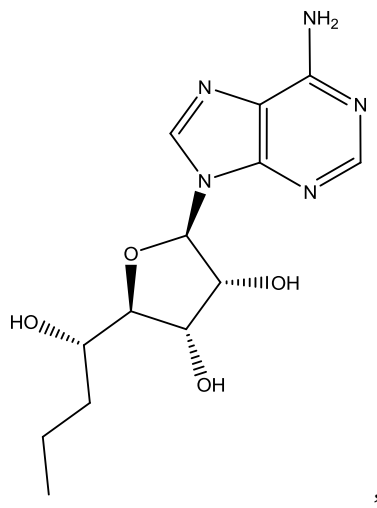
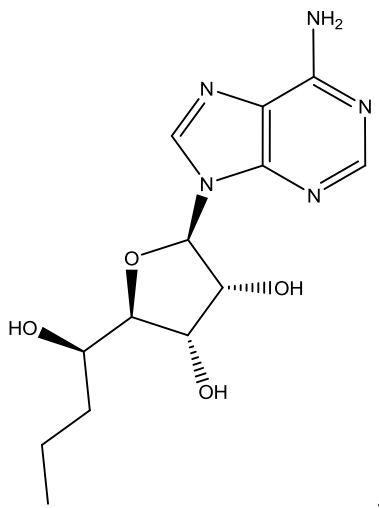


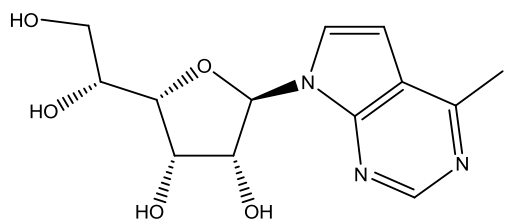
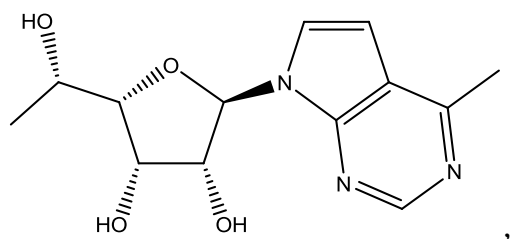
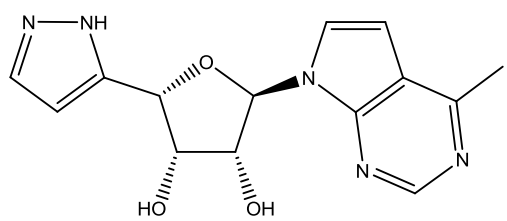
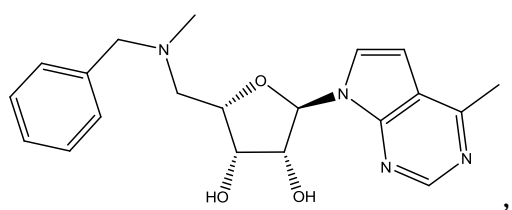
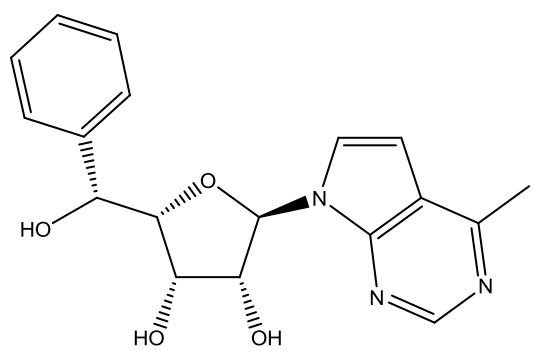
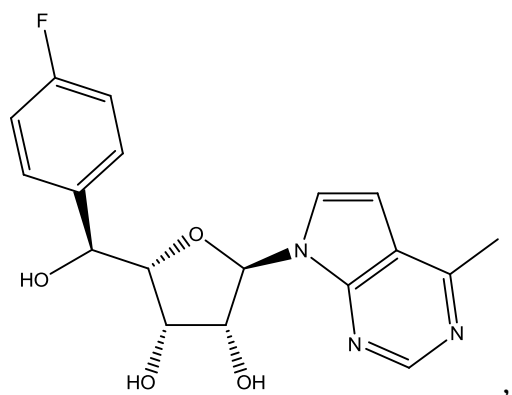
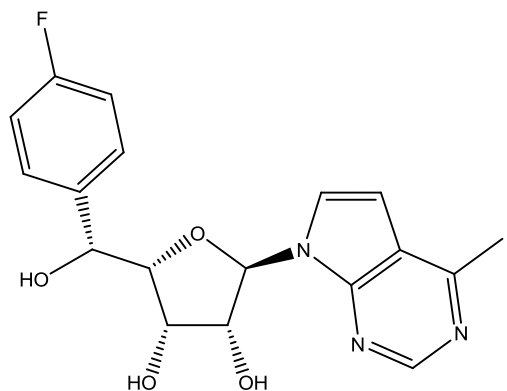
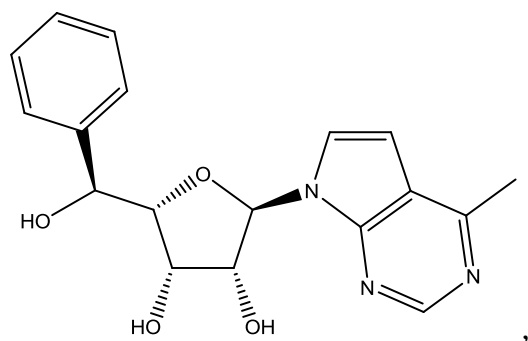
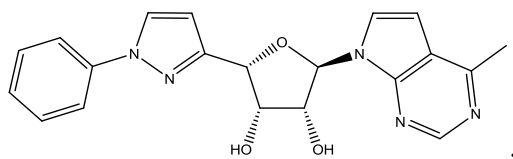
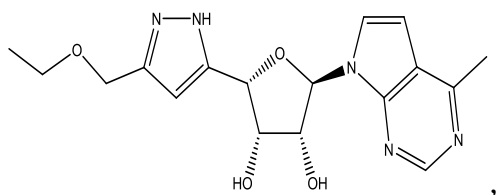
17. Un compuesto seleccionado de:

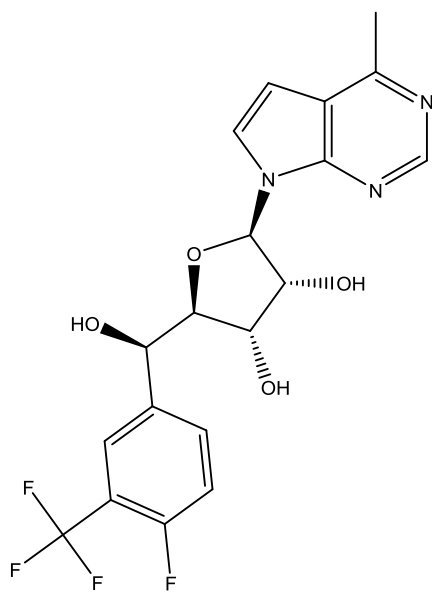
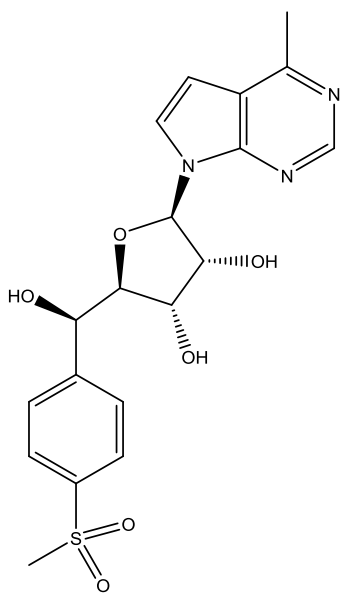
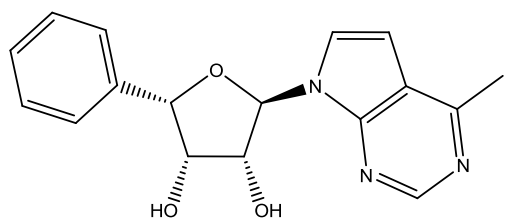
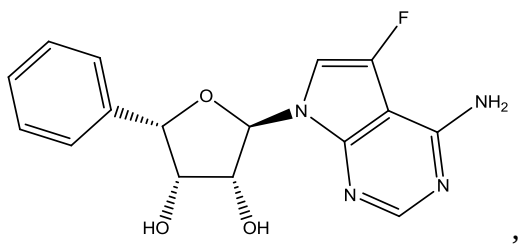
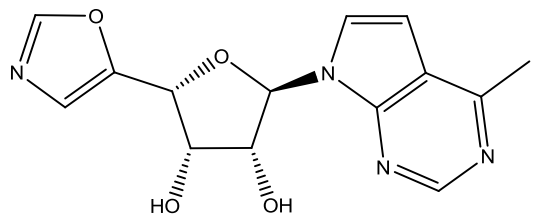
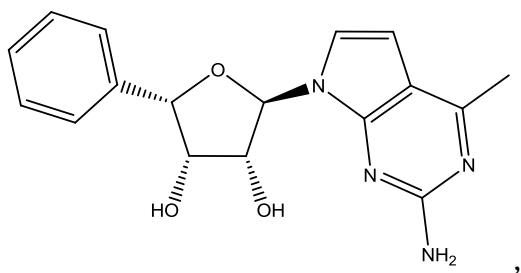


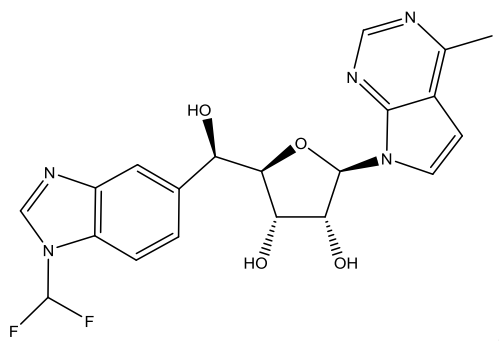
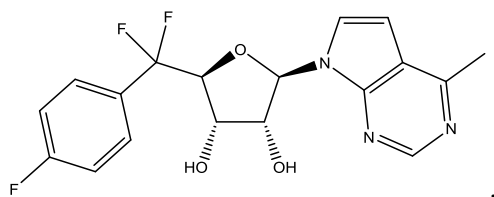
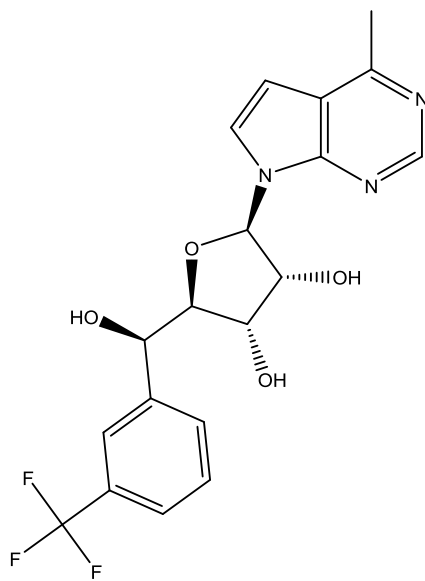
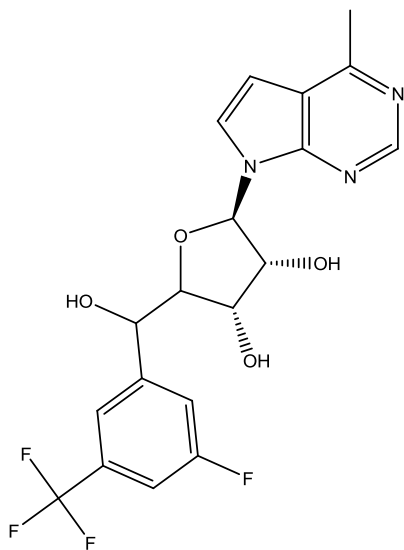


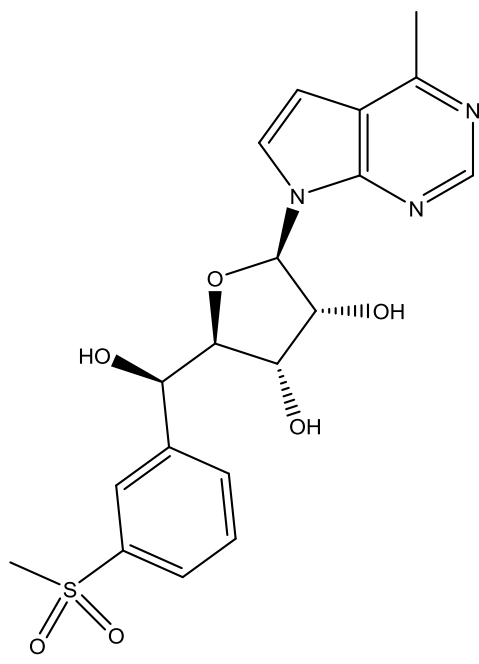
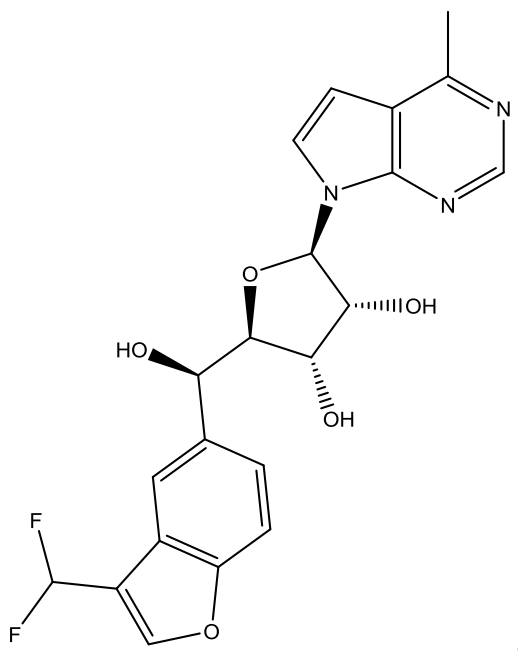
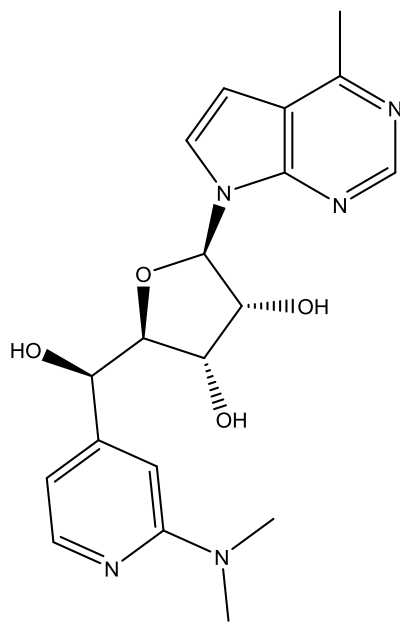
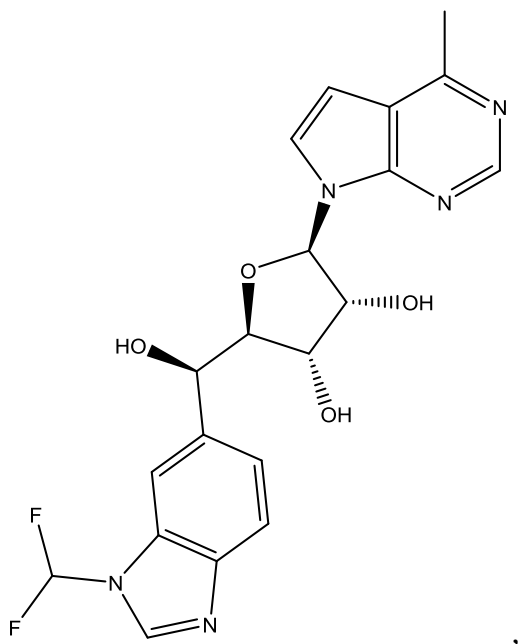


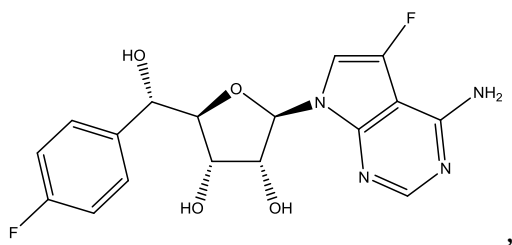
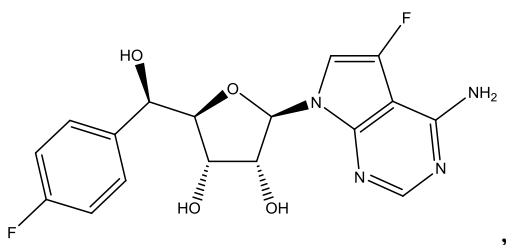
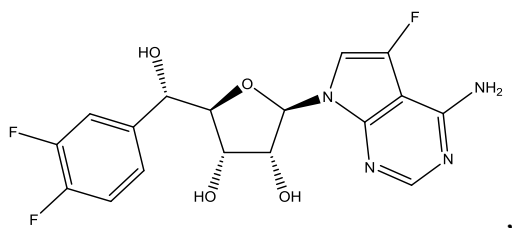
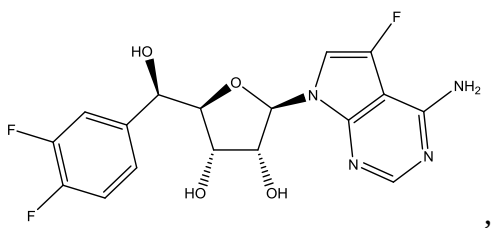
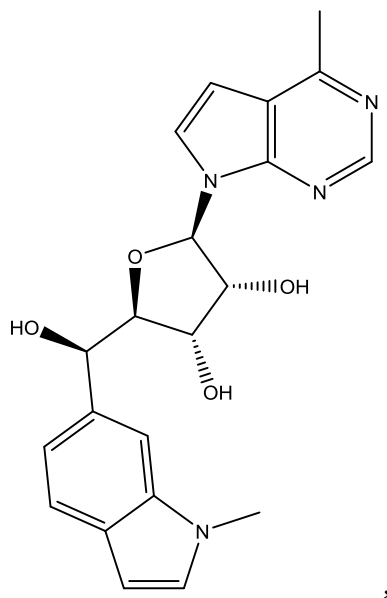
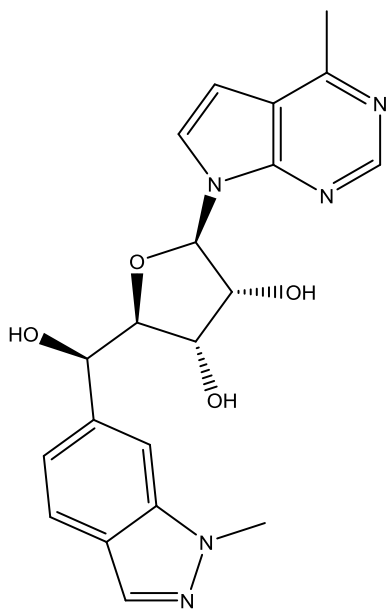


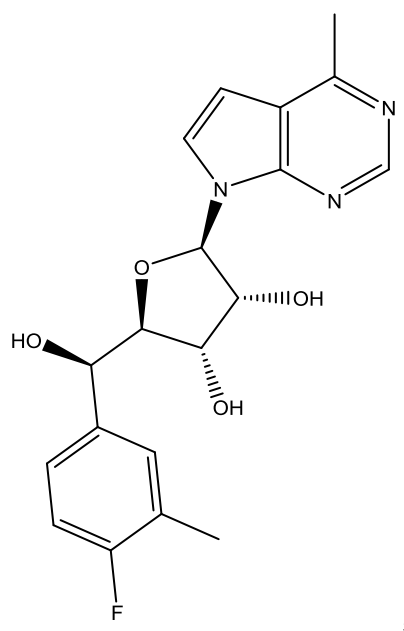
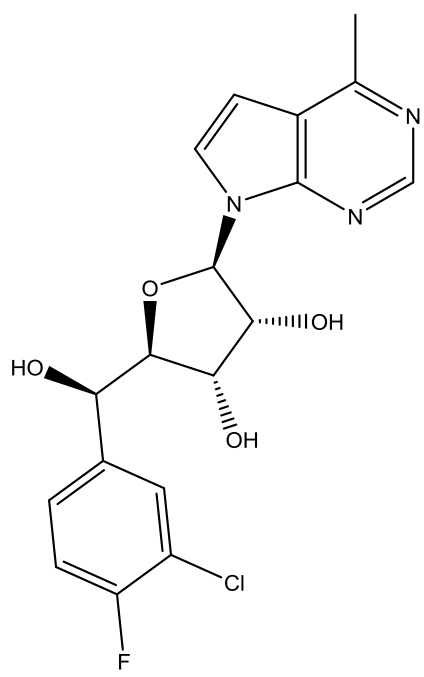
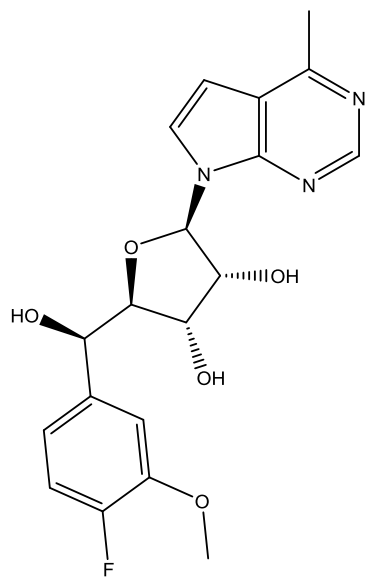
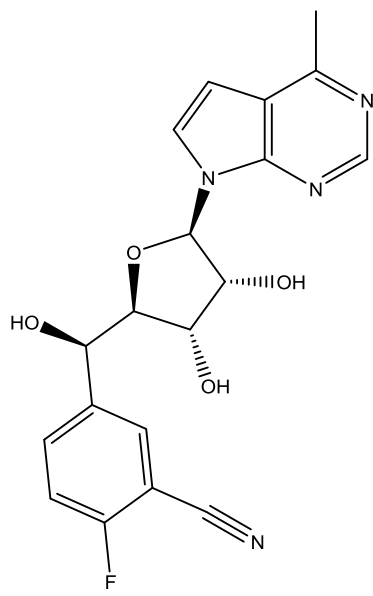


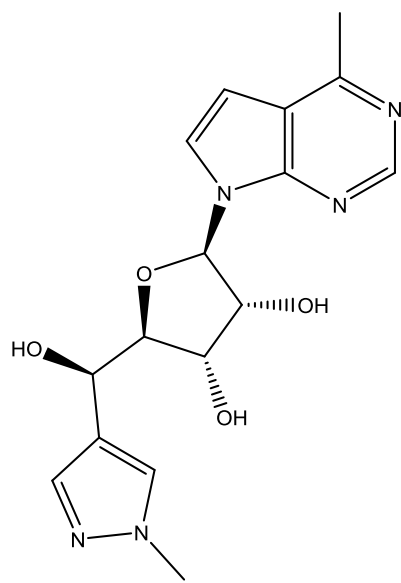
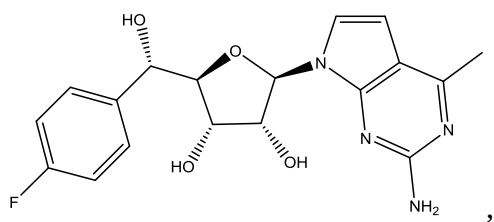
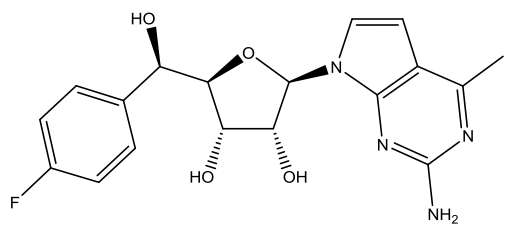
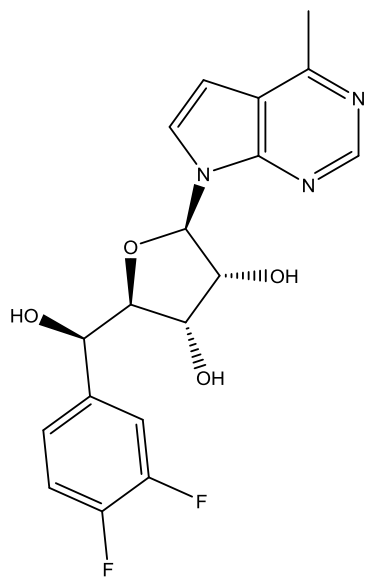


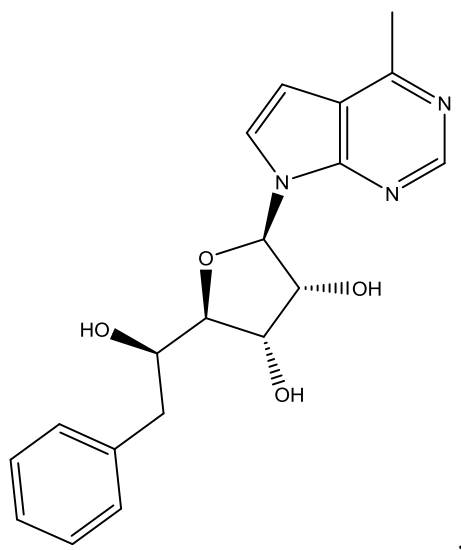
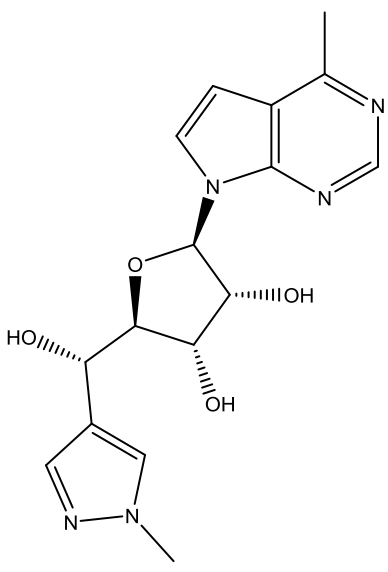
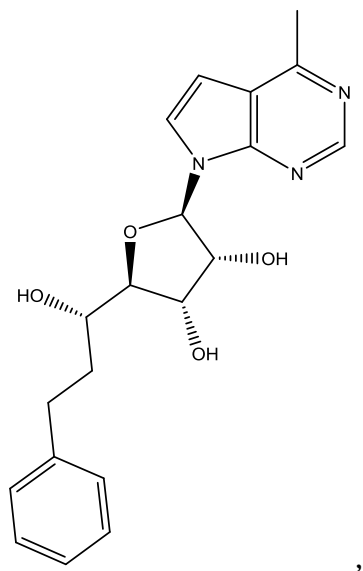
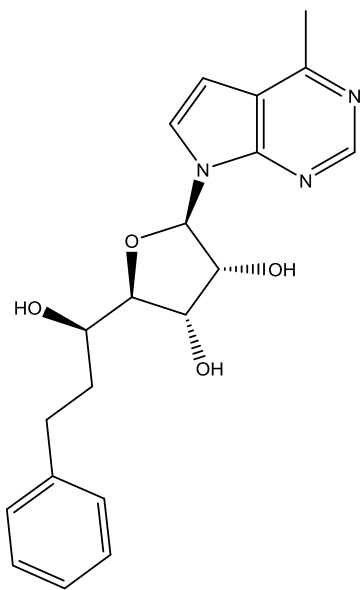


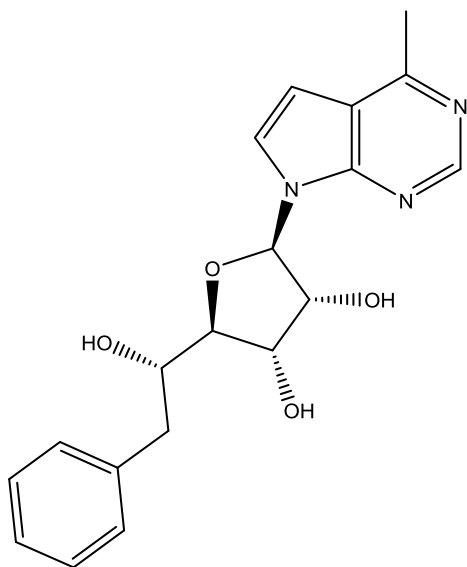




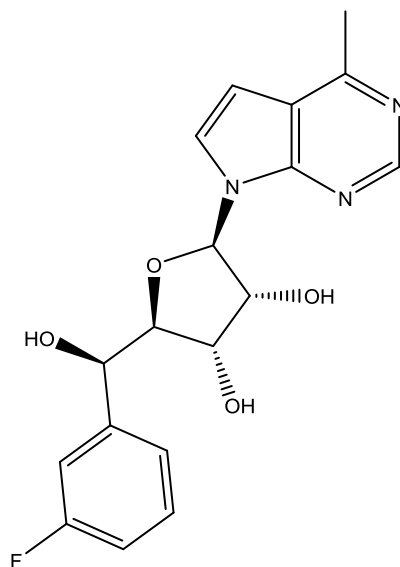




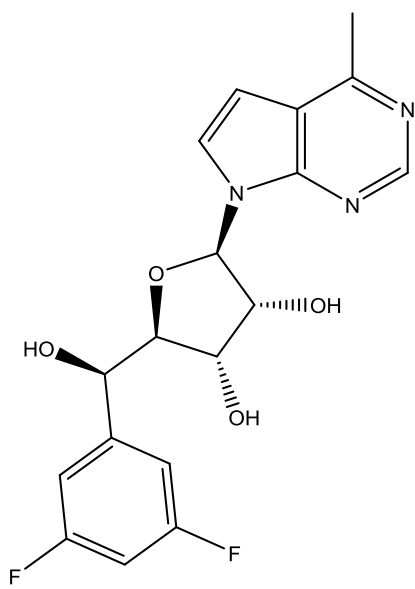




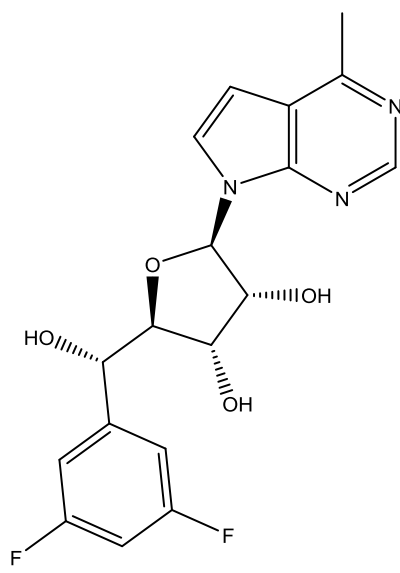
,



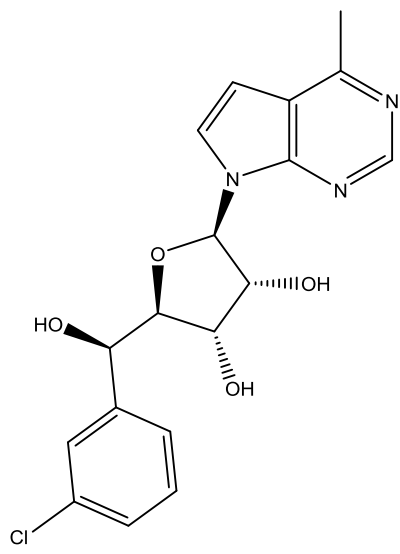
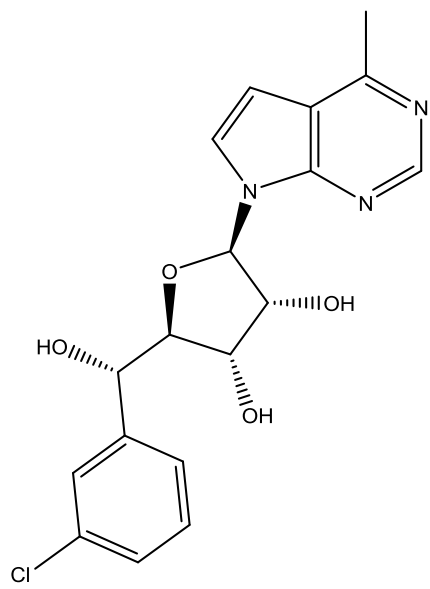
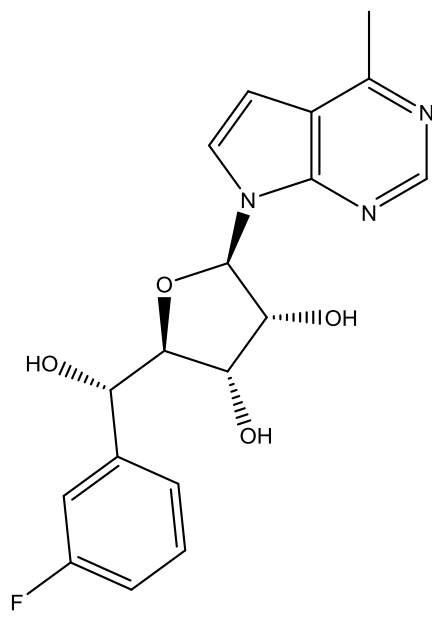
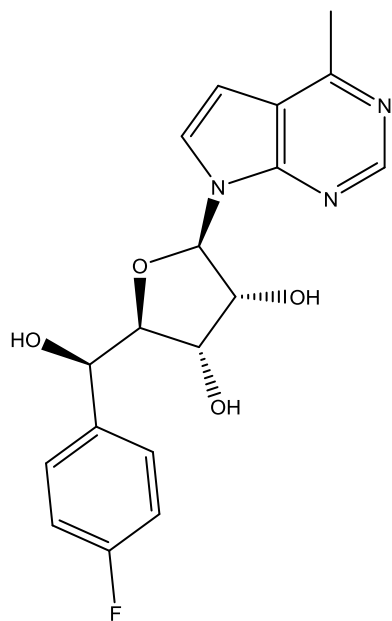
,

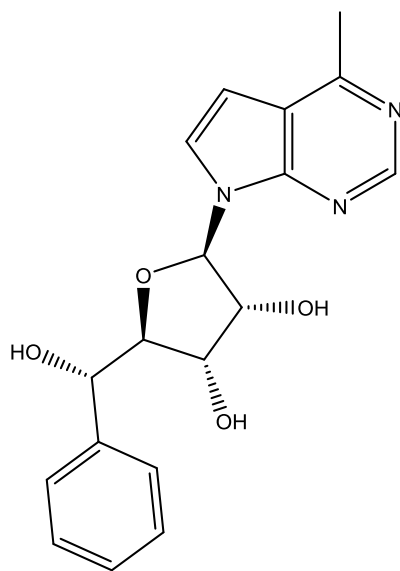
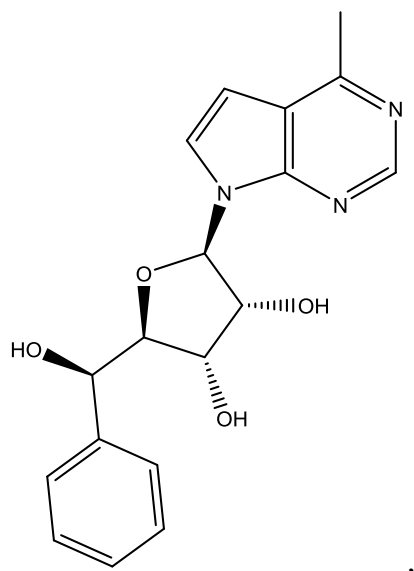
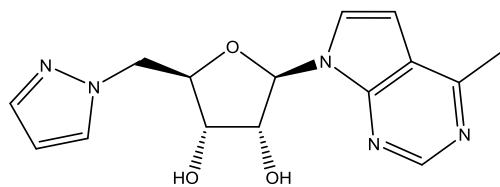
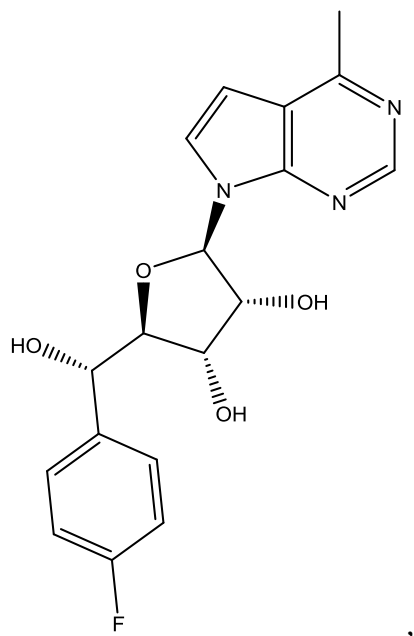


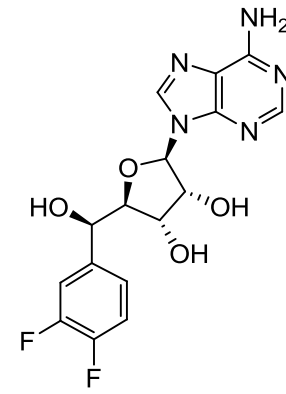
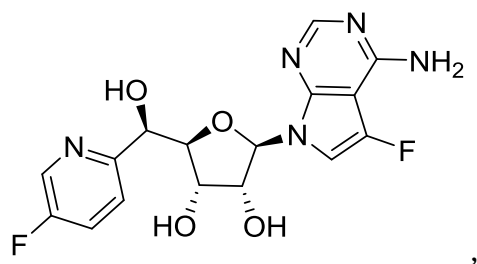
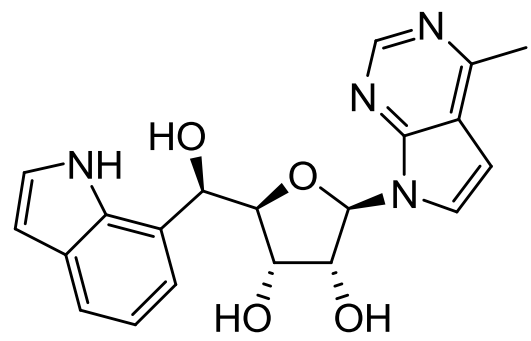
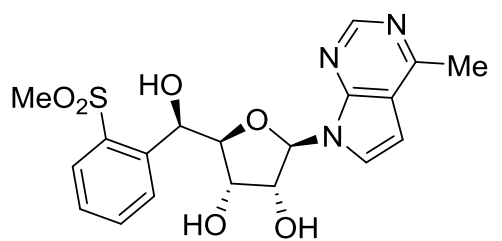
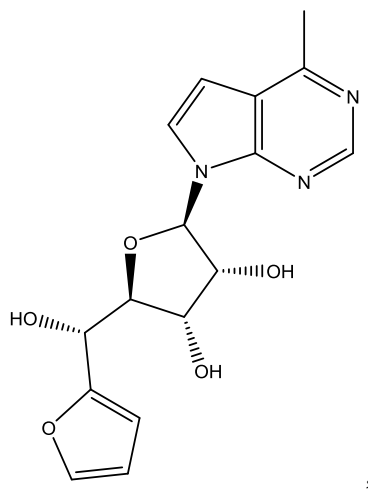
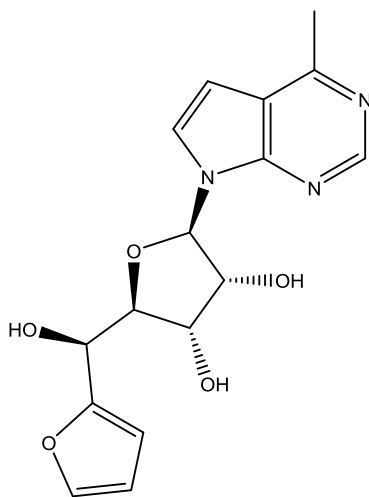
,

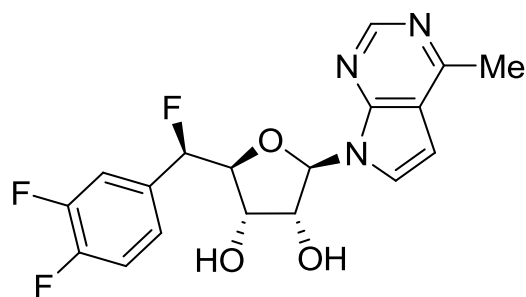
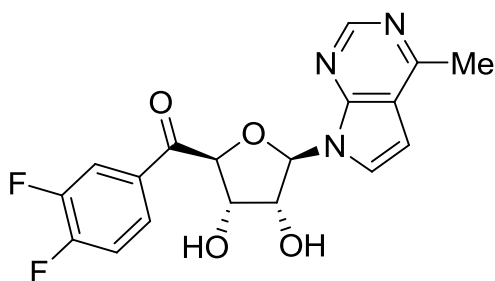
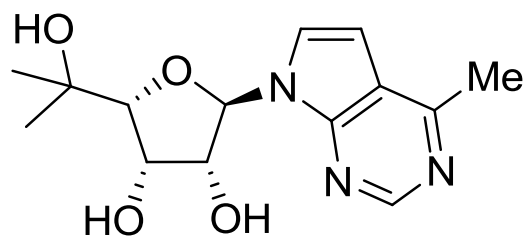
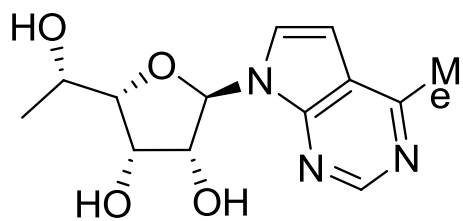
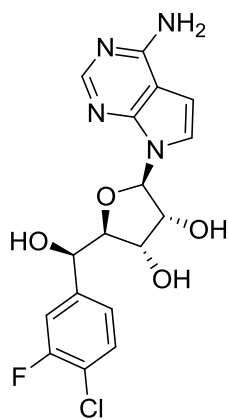
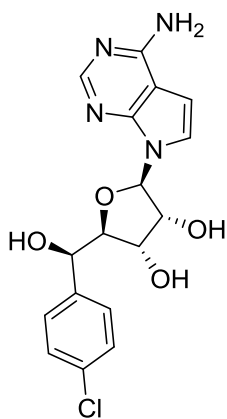
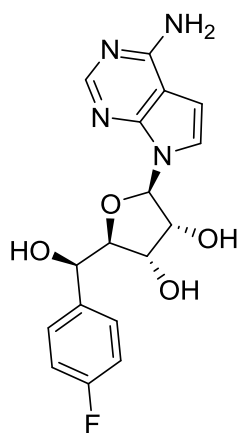
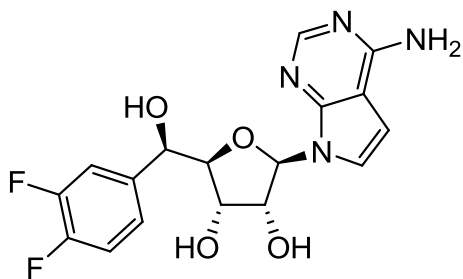


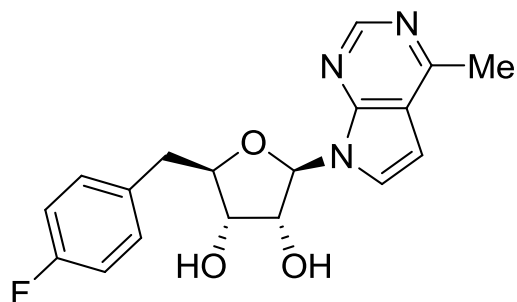
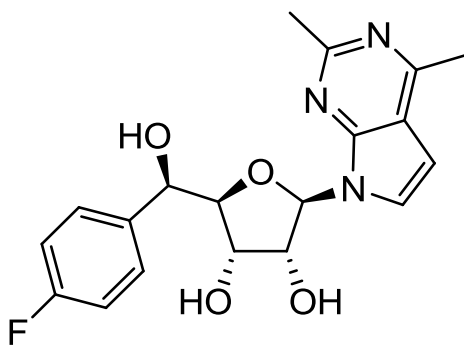
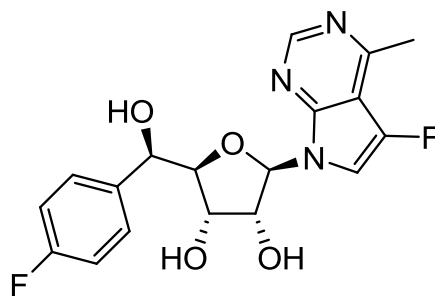
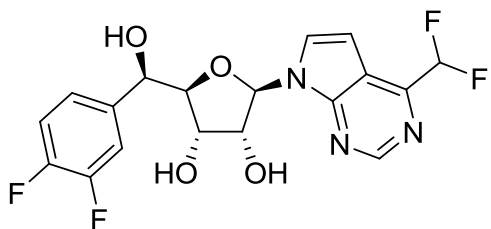
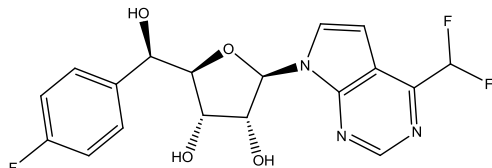
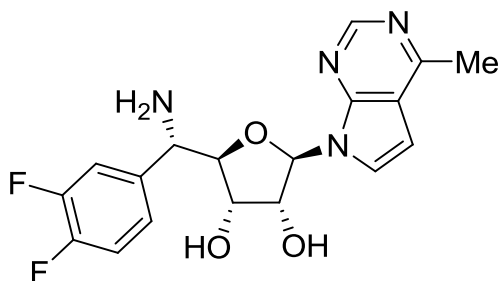
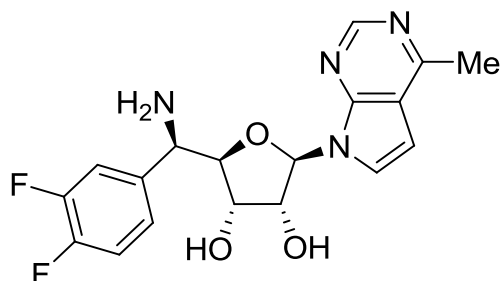
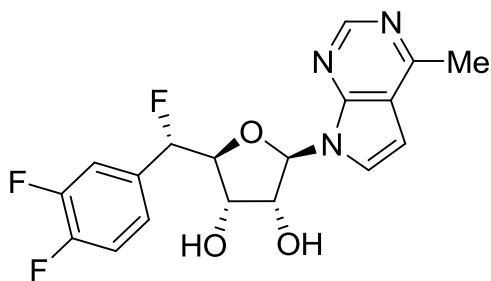
,

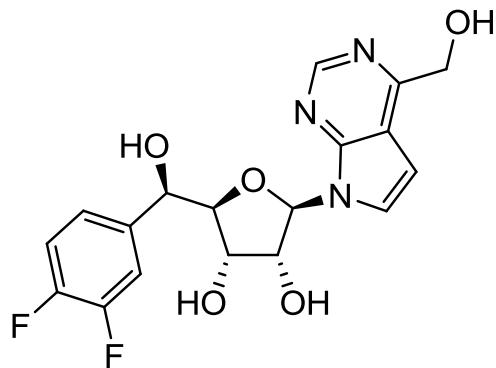
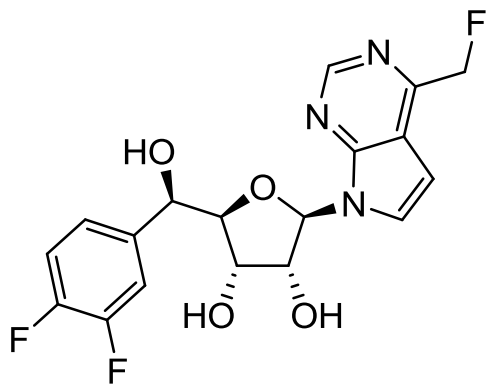
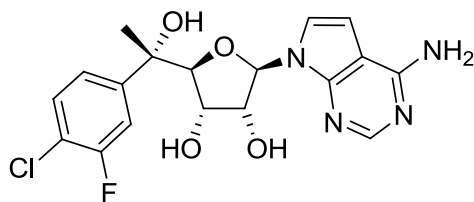
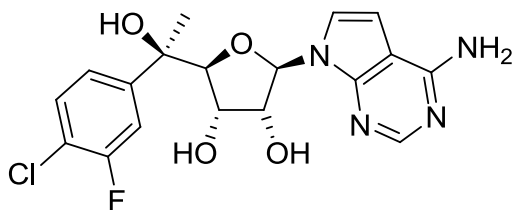
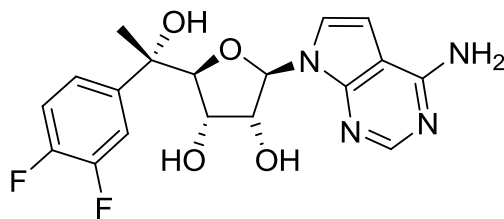
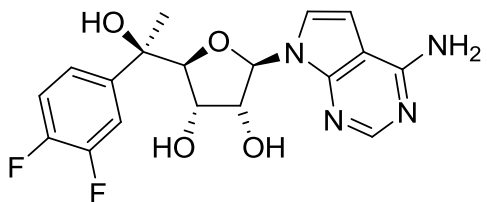
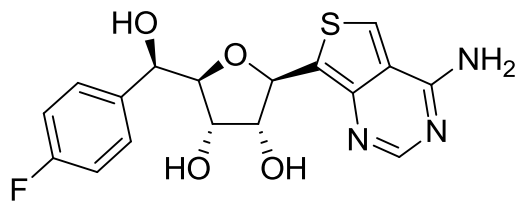
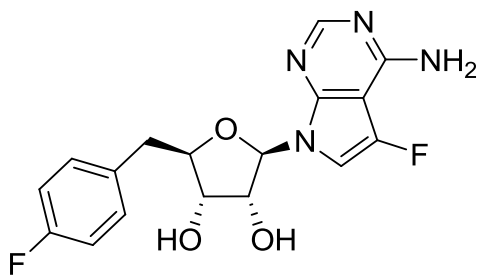


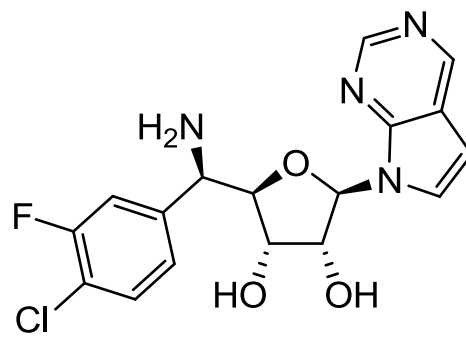
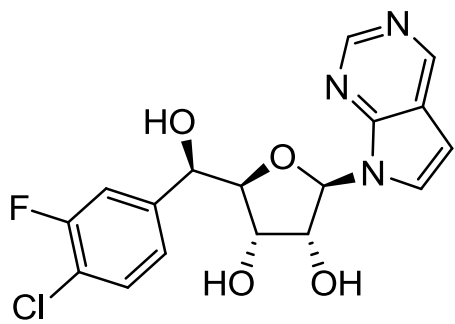
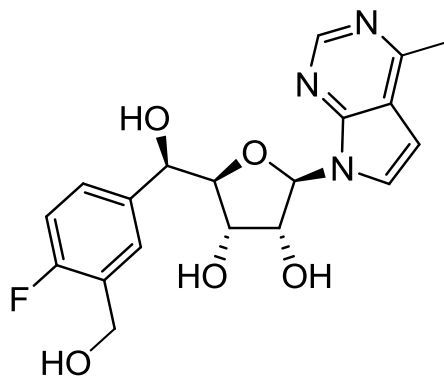
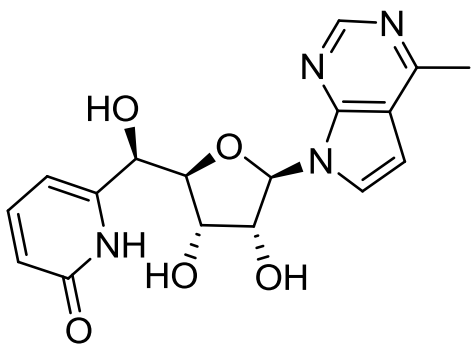
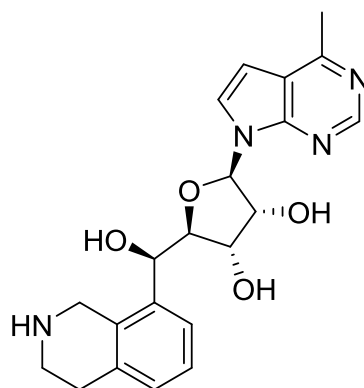
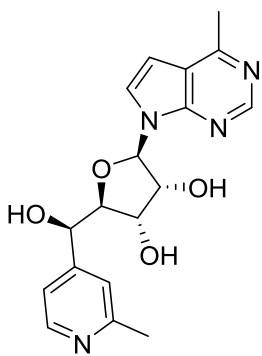
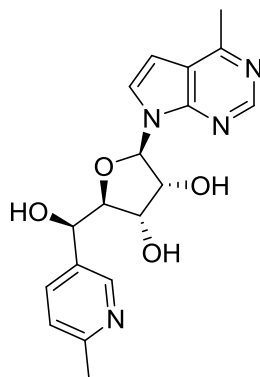
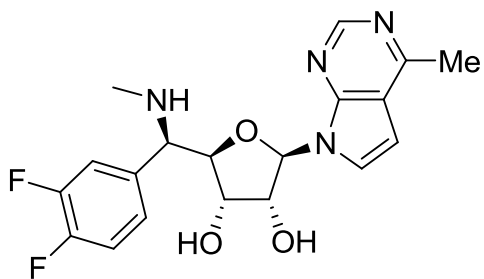


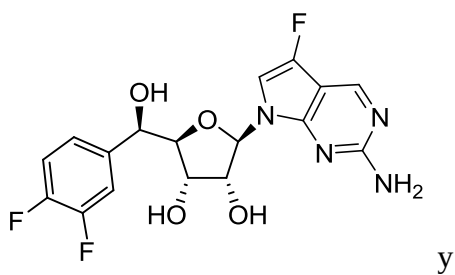
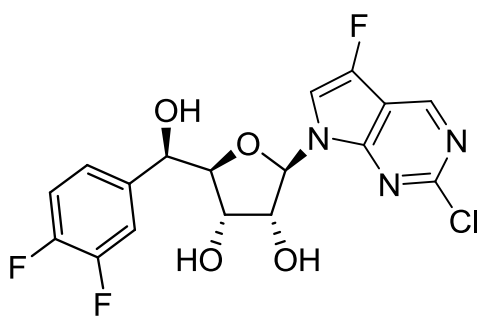
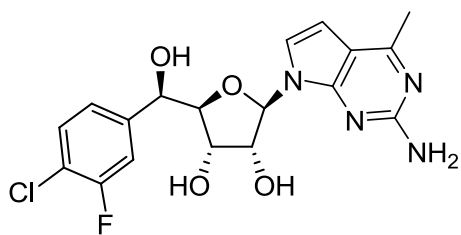
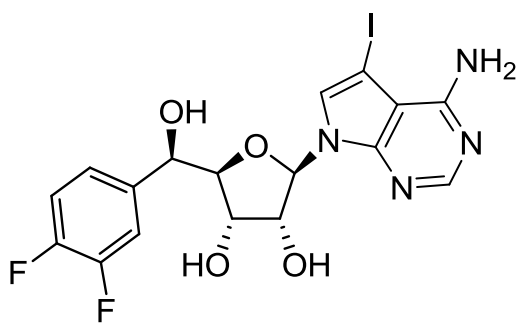
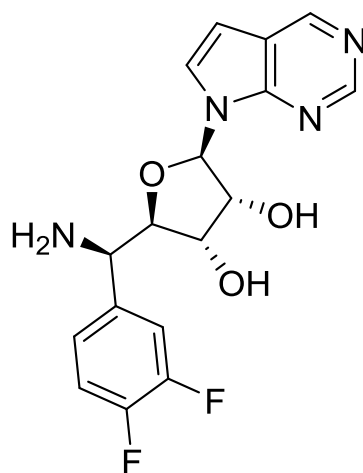
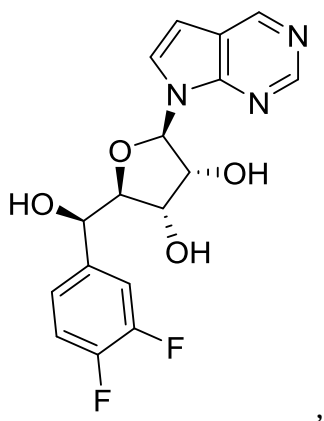


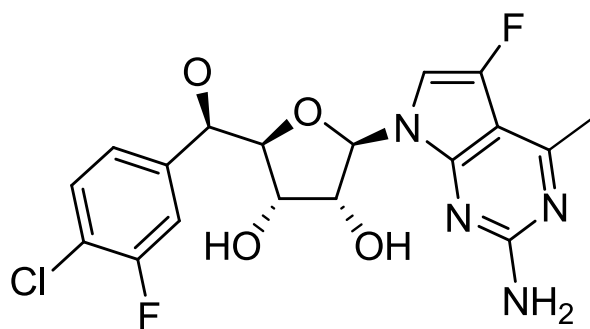






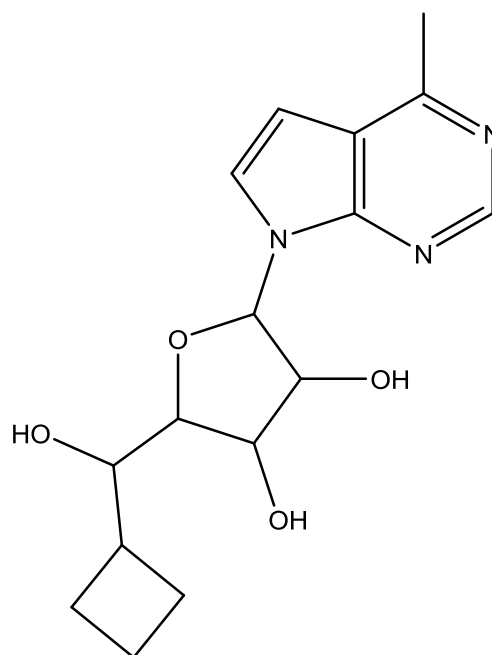
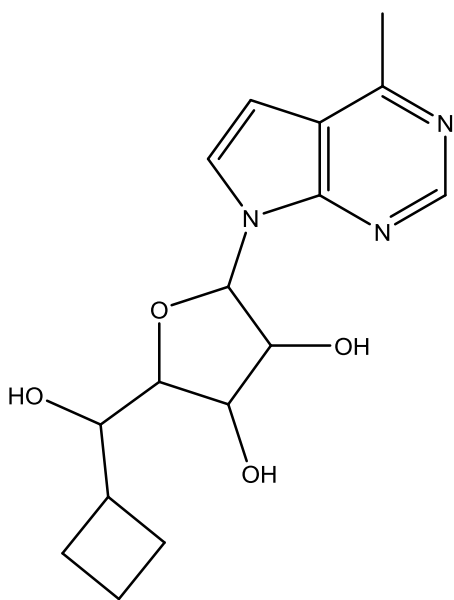


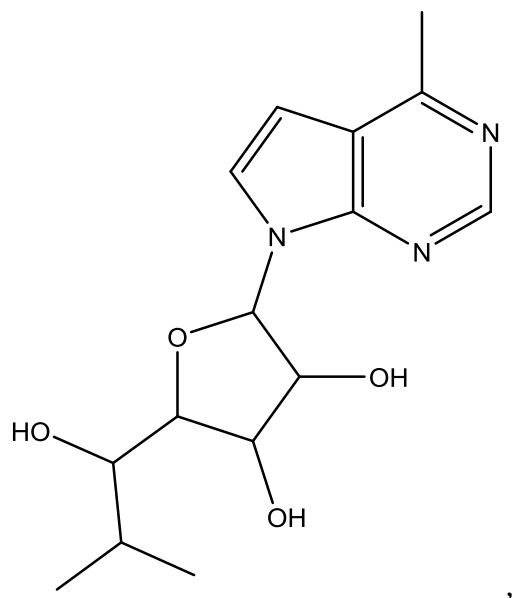
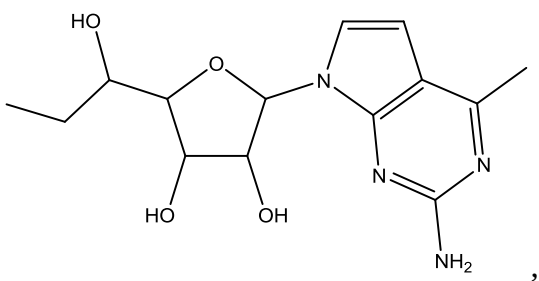
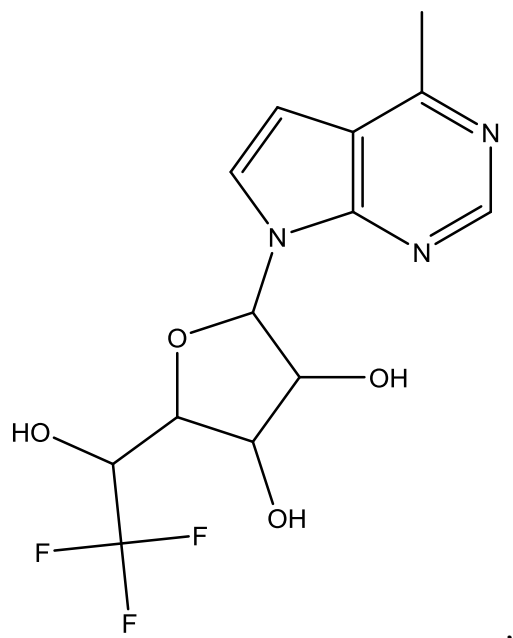
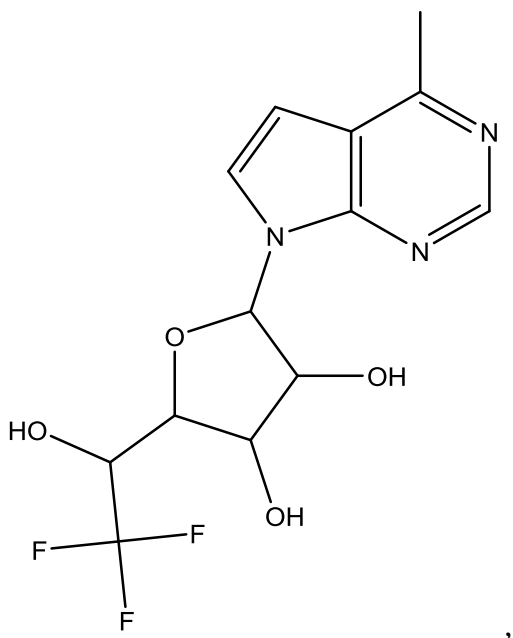


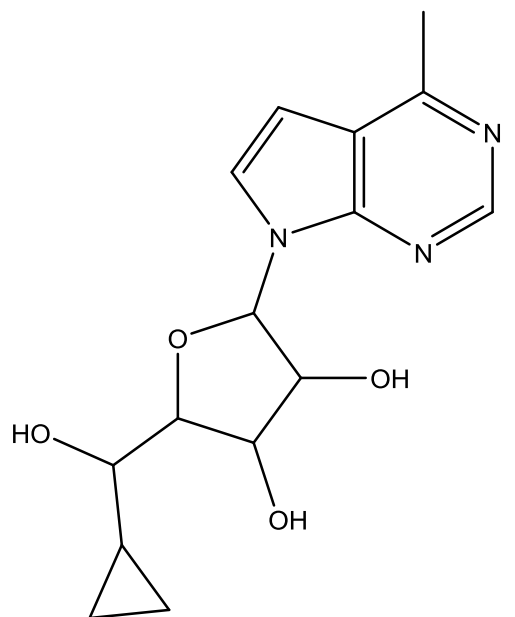
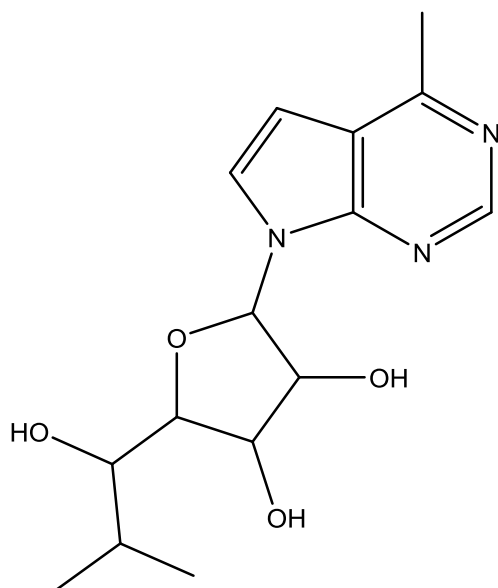


o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico.

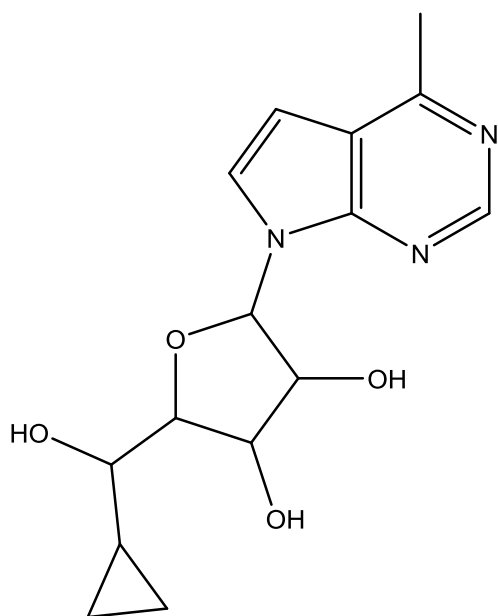
18. Un compuesto seleccionado de:



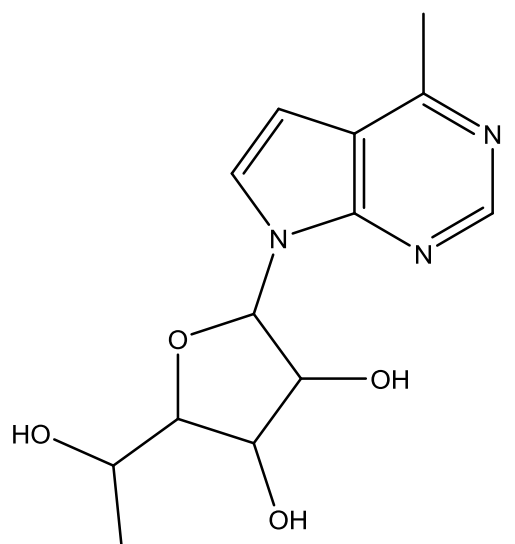




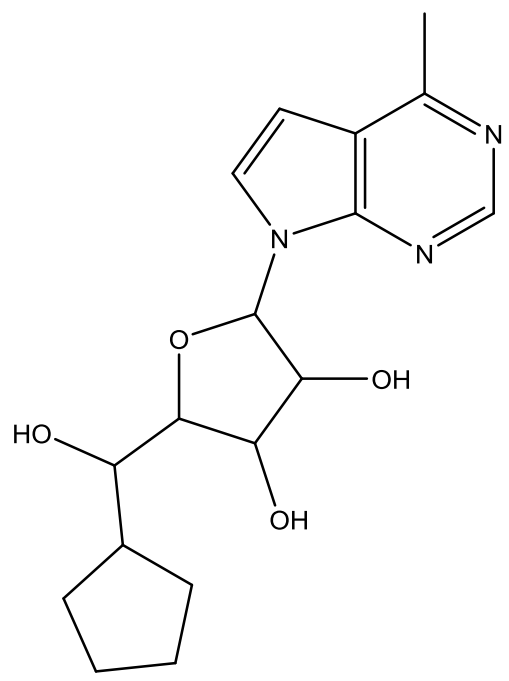
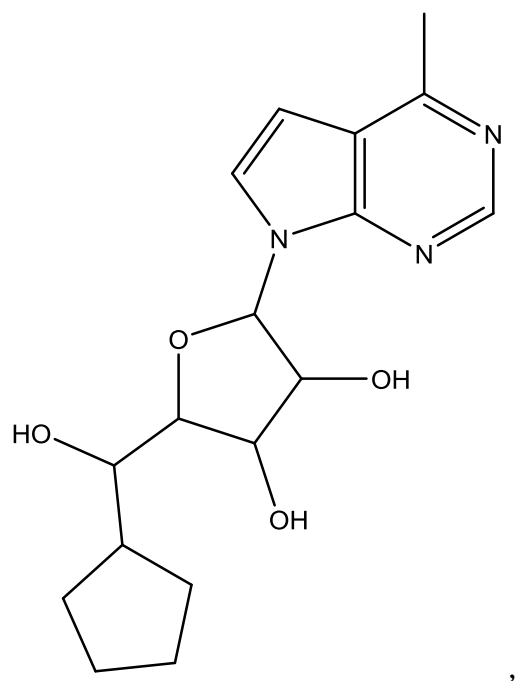
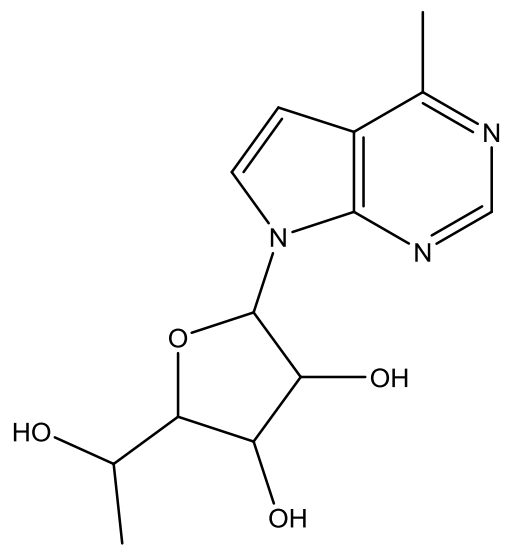
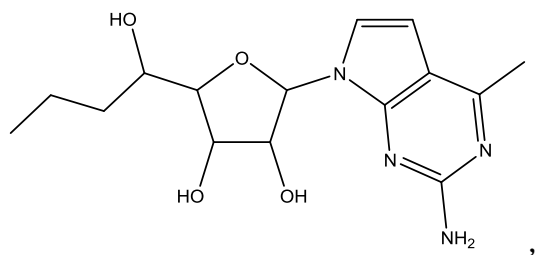
,

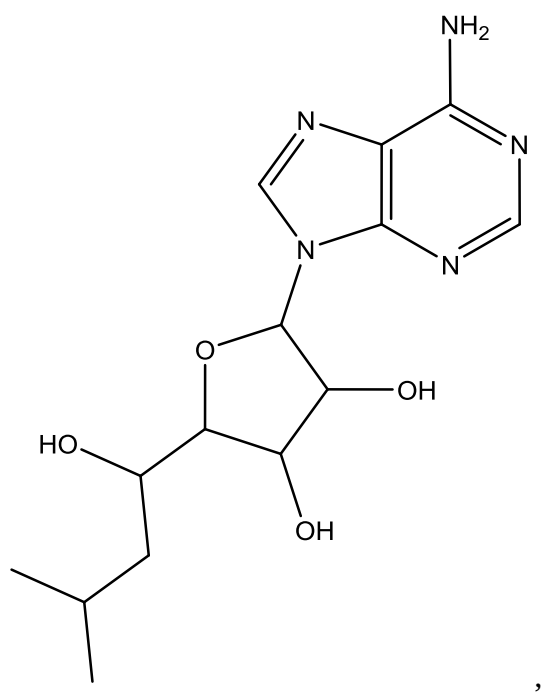
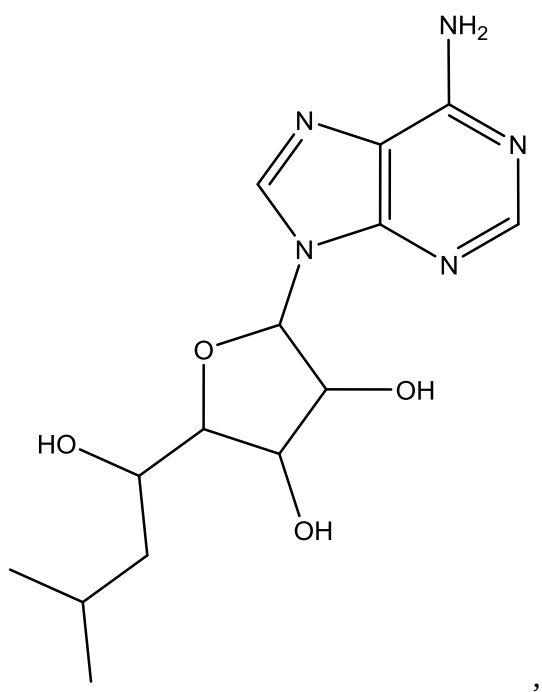
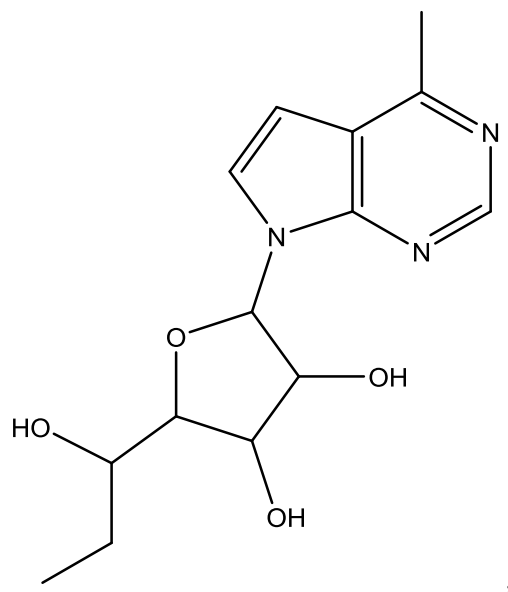
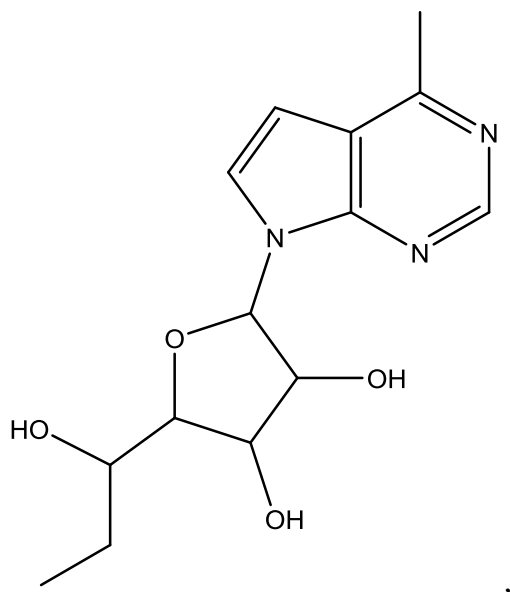


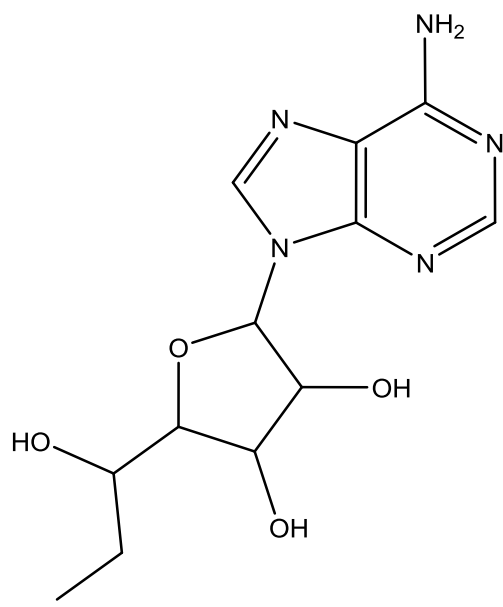
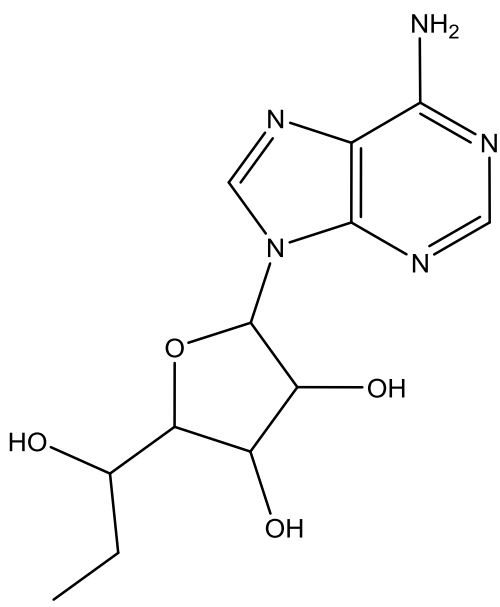
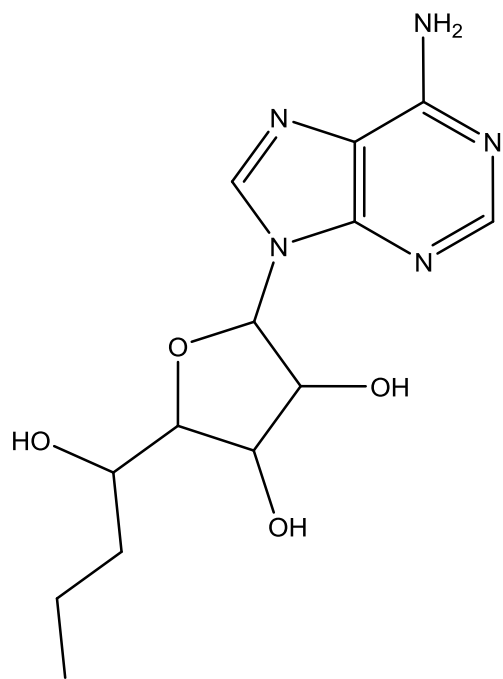
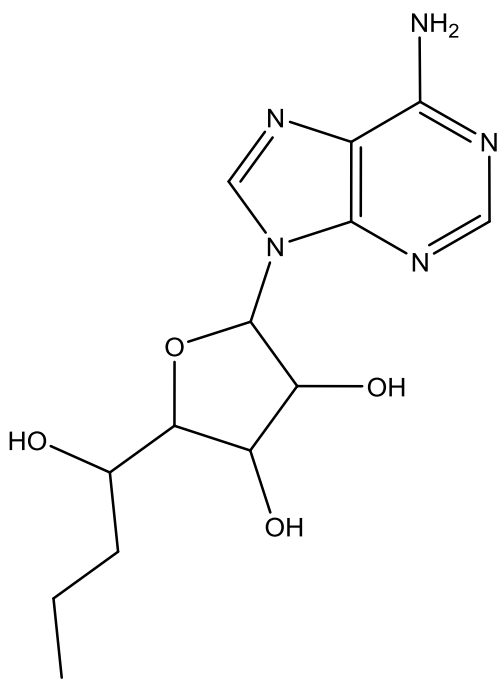
,

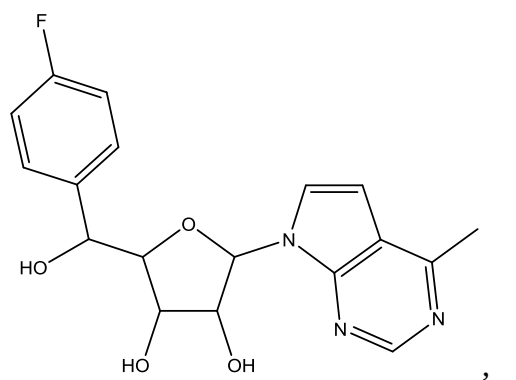
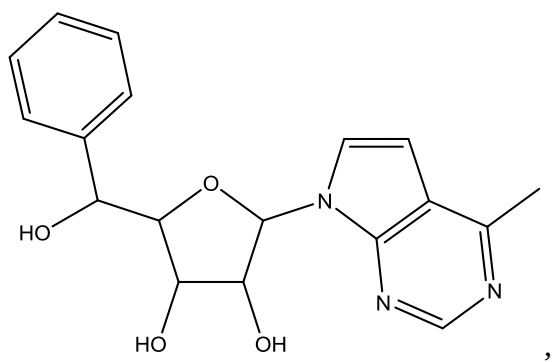
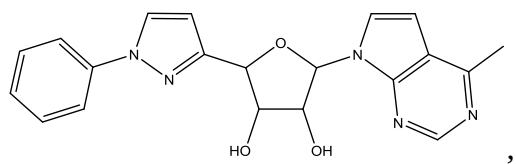
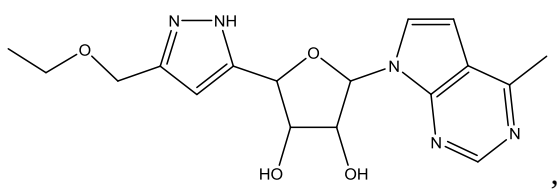
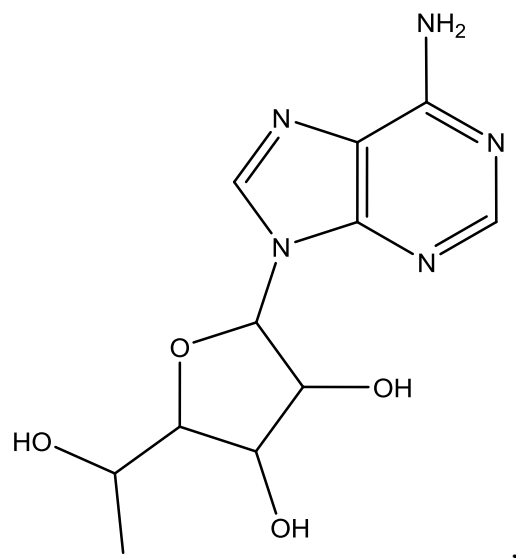
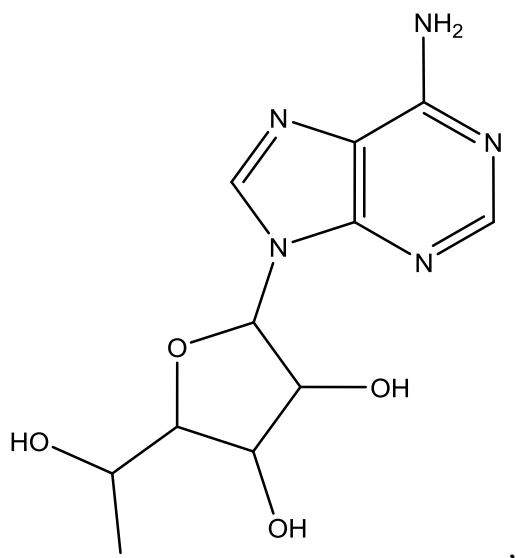


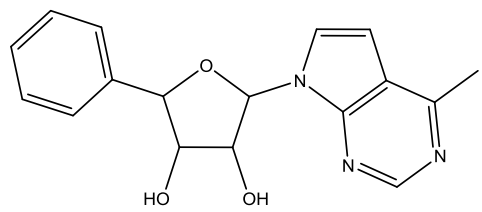
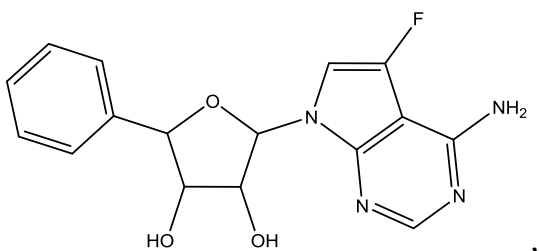
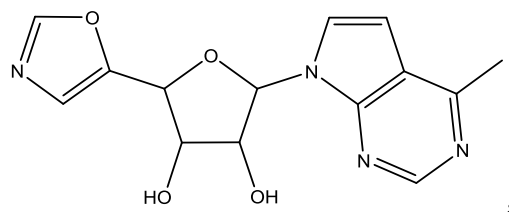
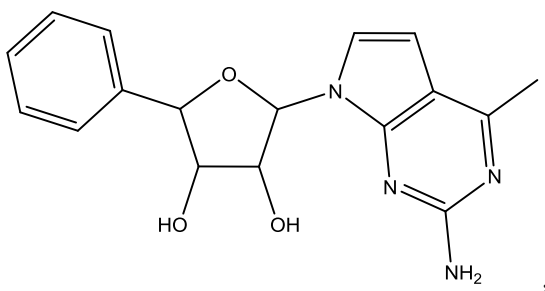
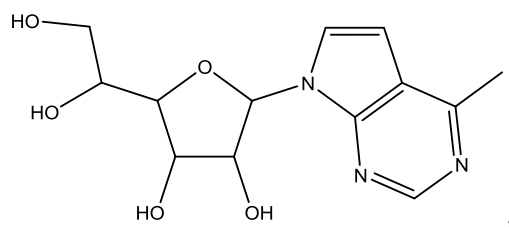
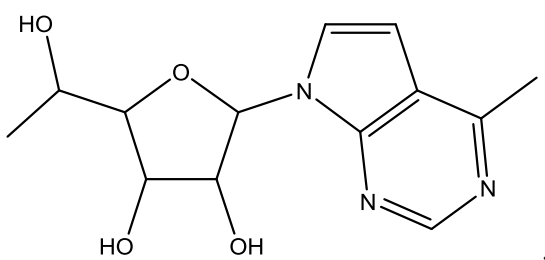
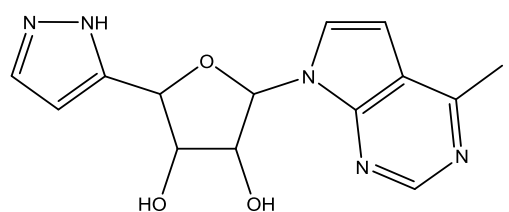
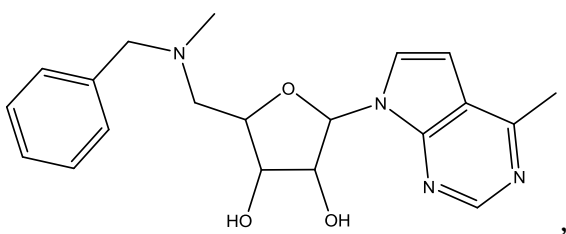
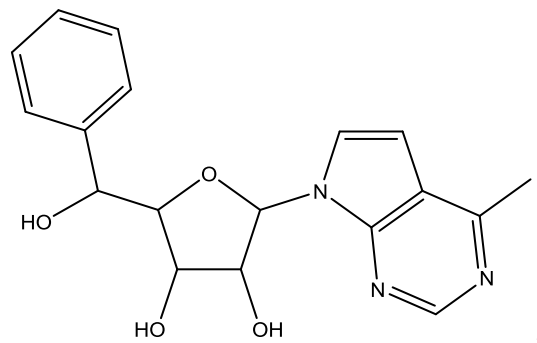
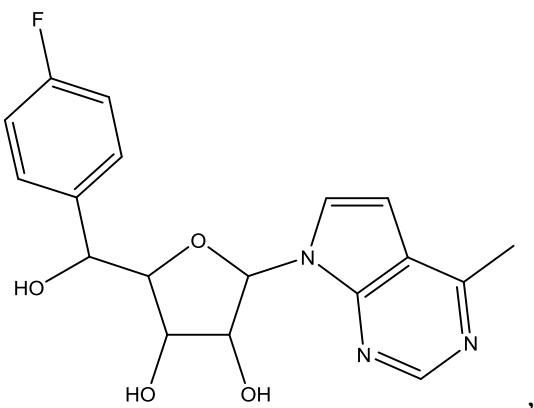
,

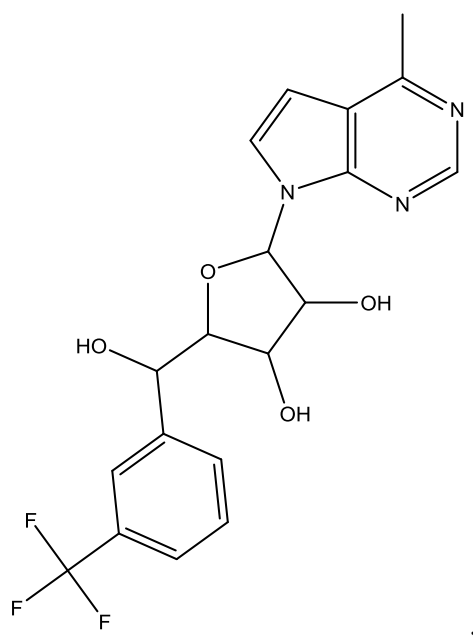
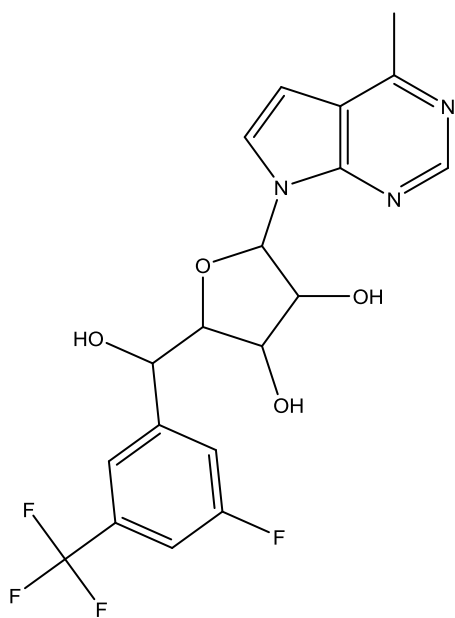
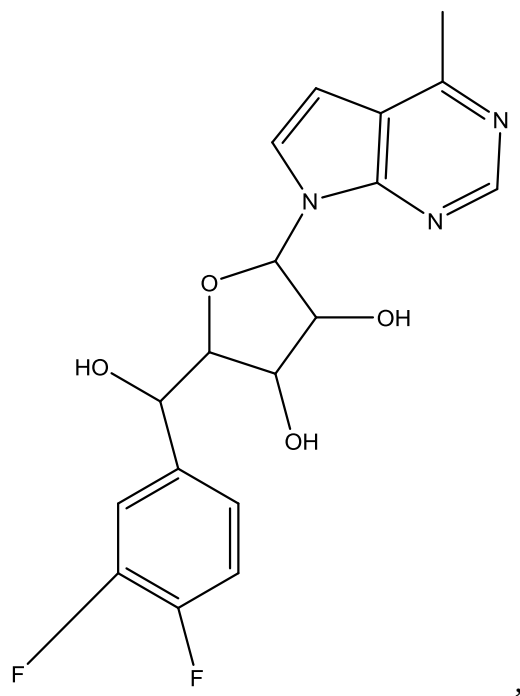
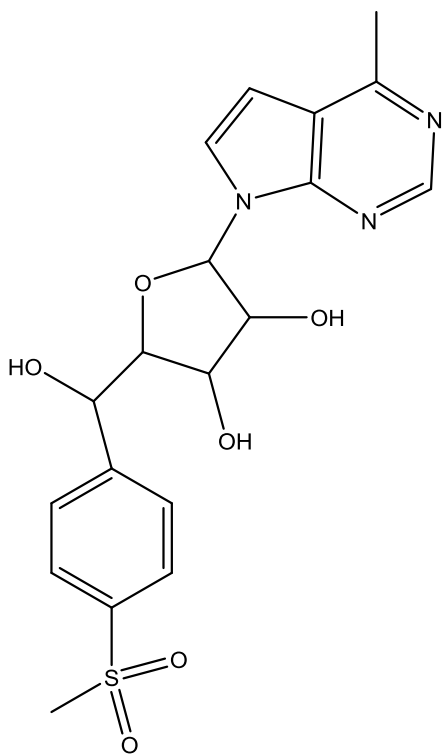


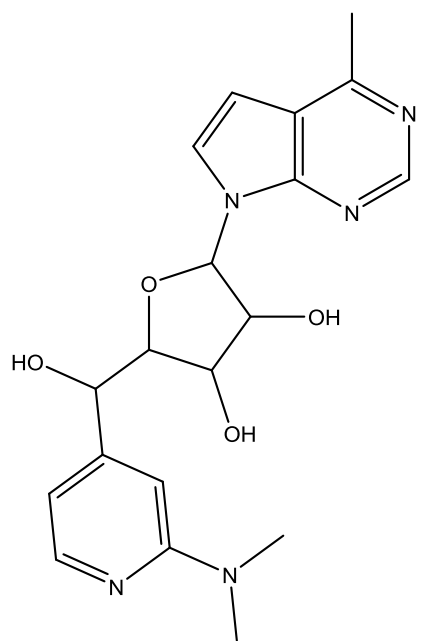
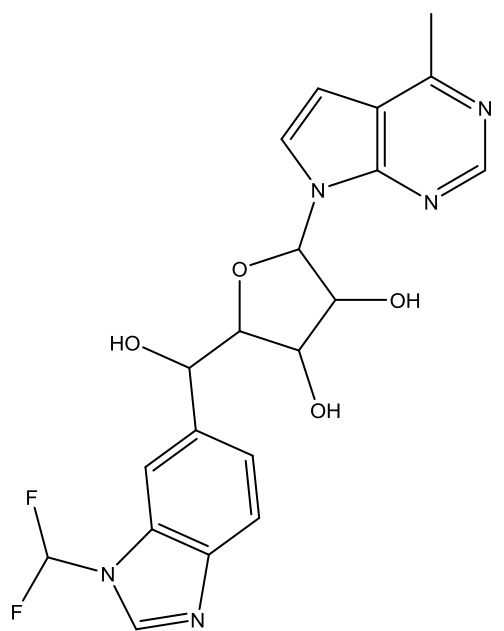
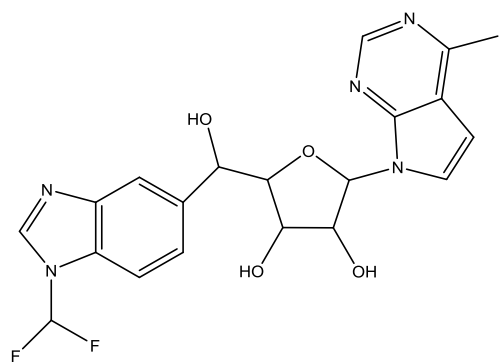
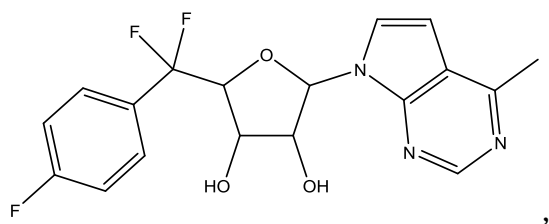


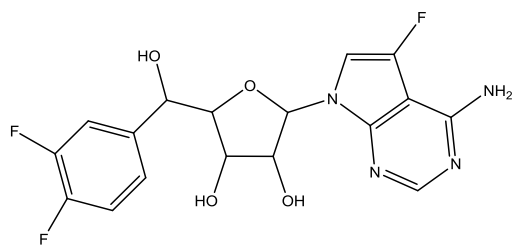
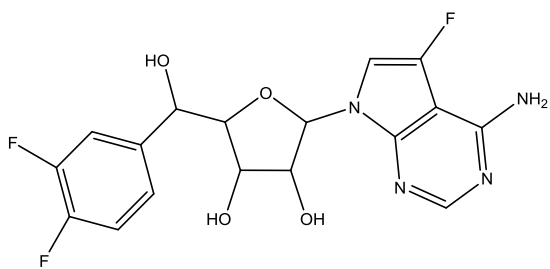
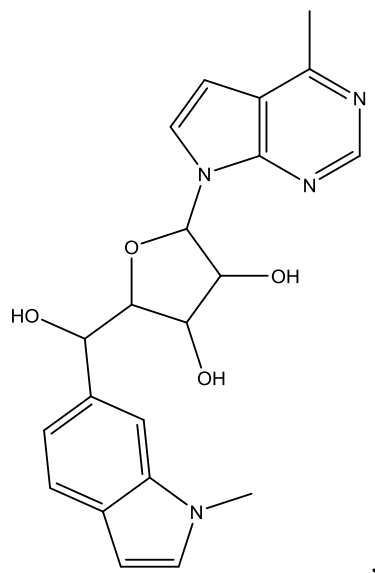
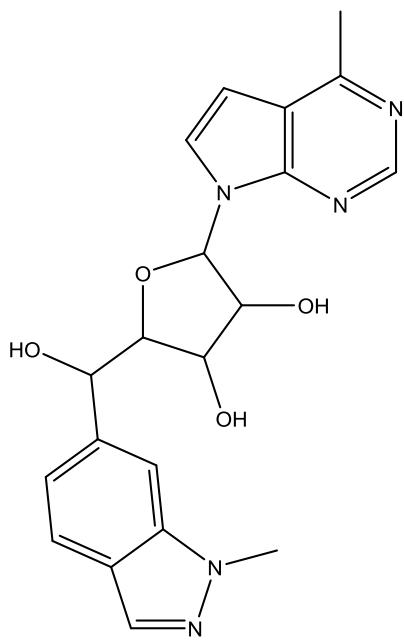
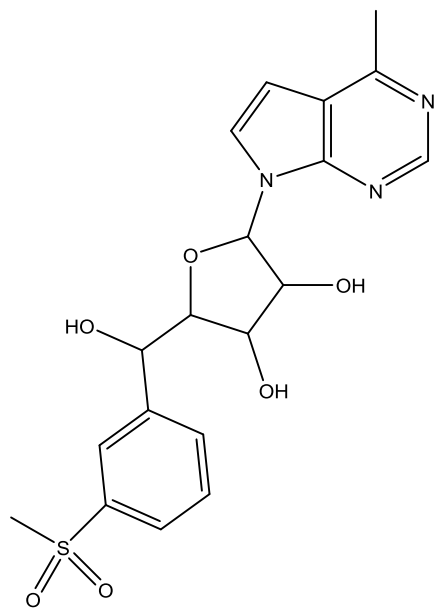
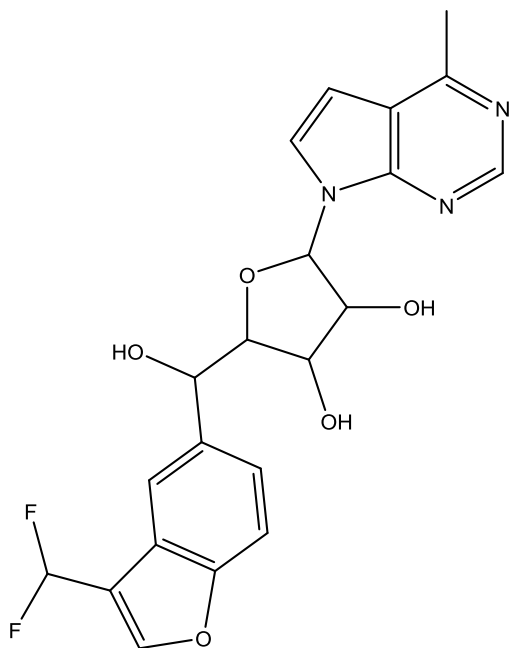


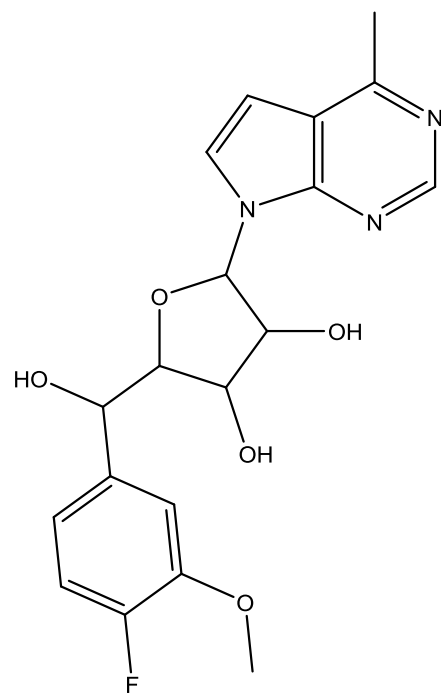
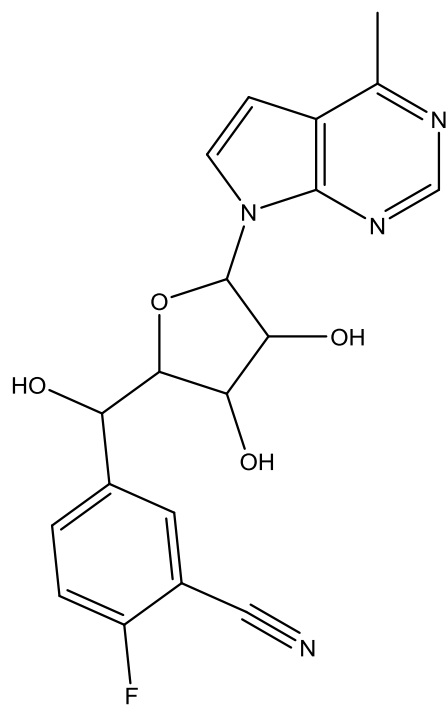
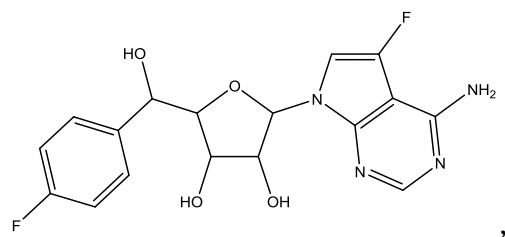
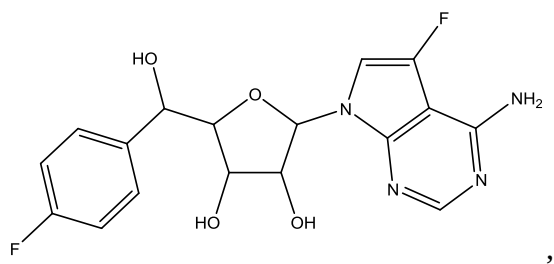


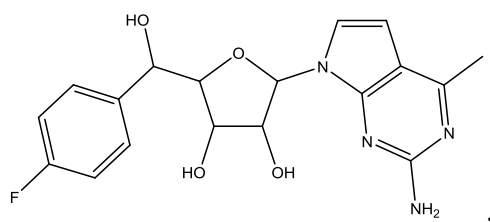
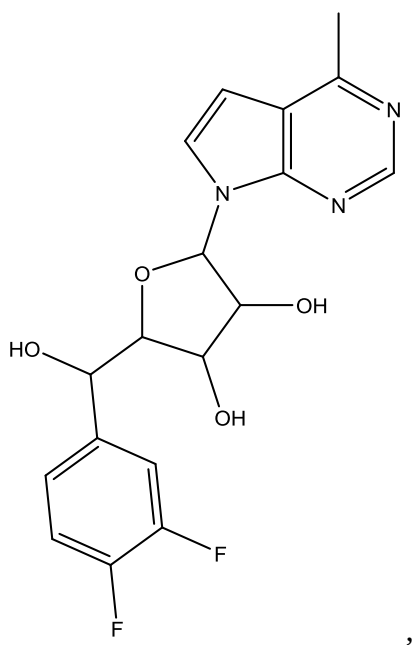
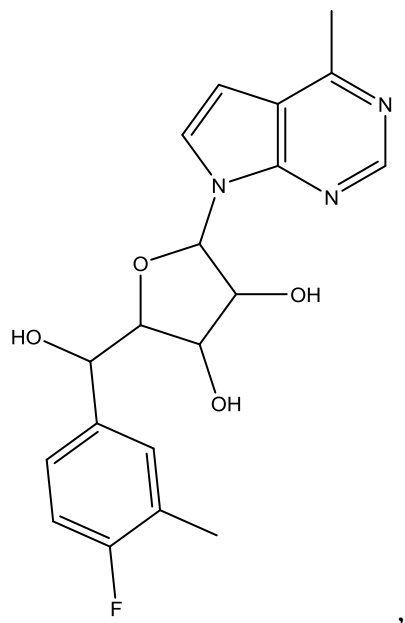
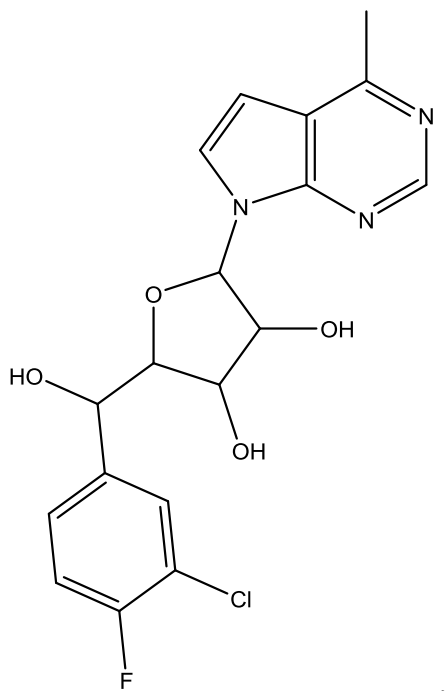


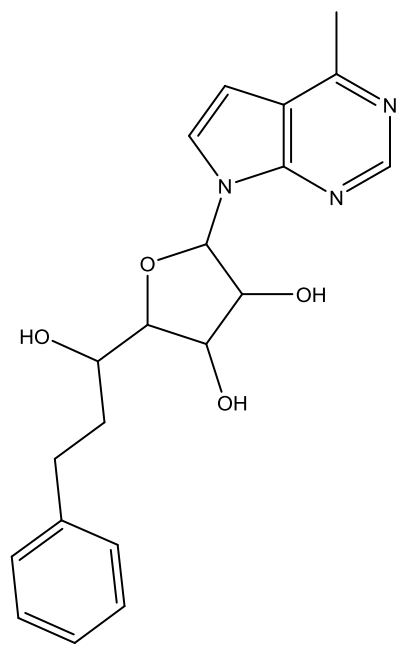
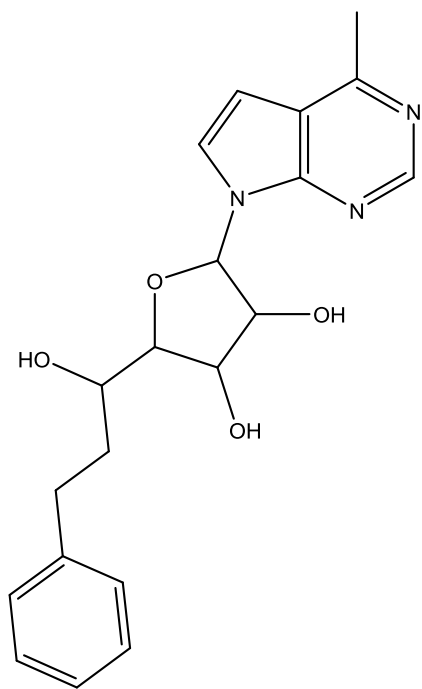
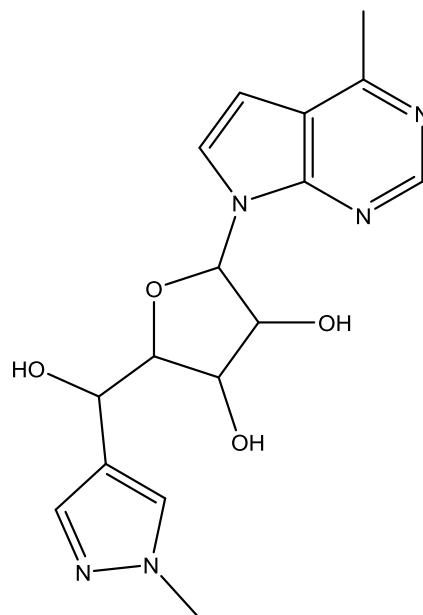
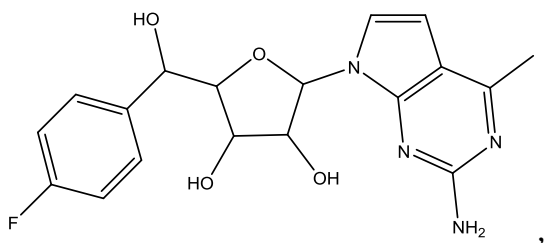


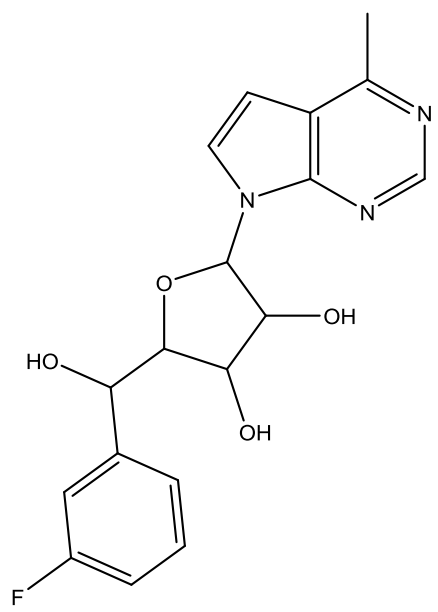
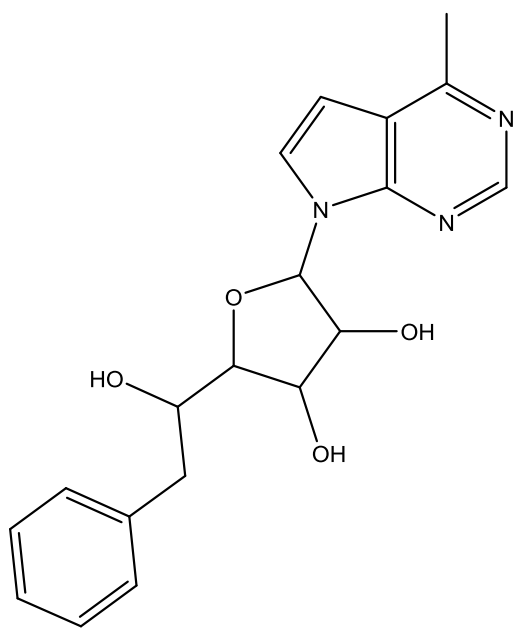
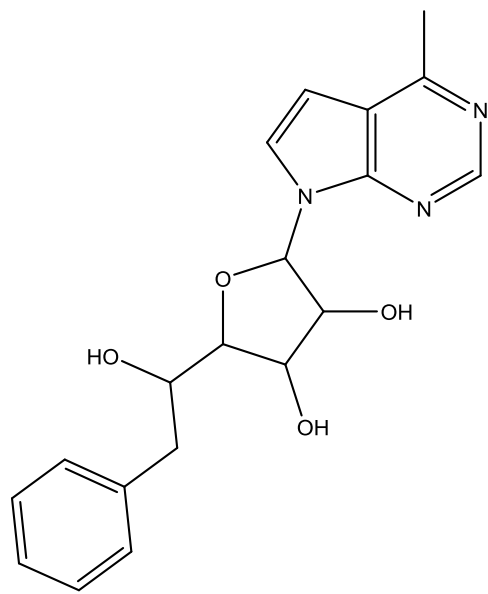
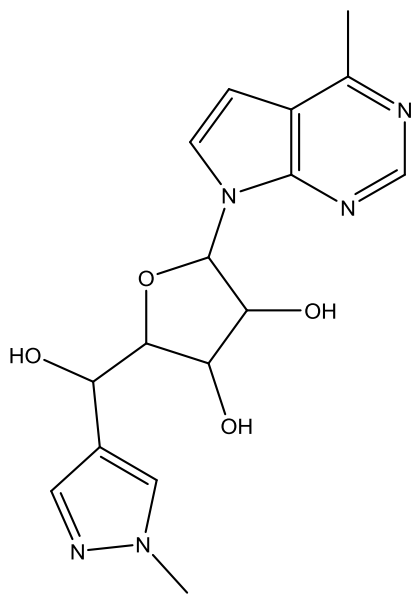


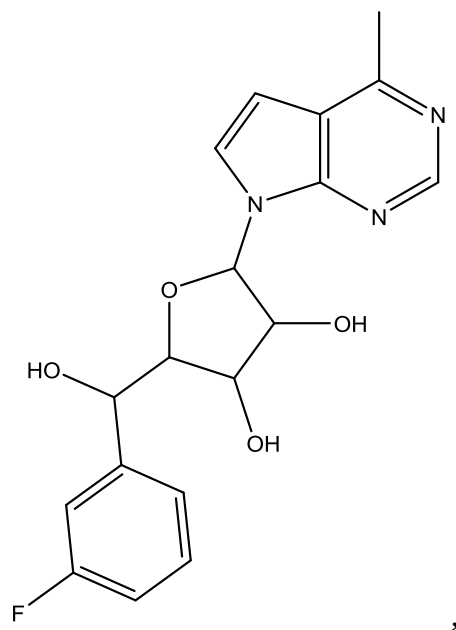
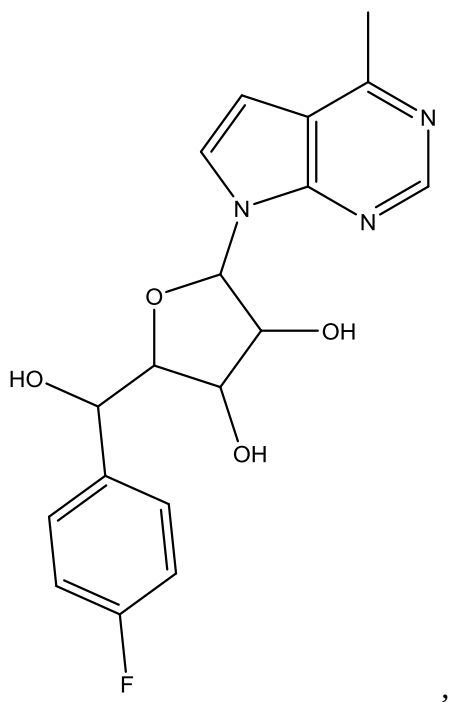
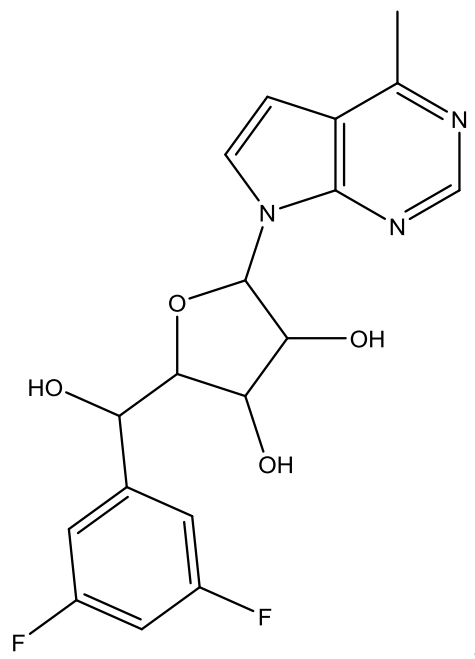
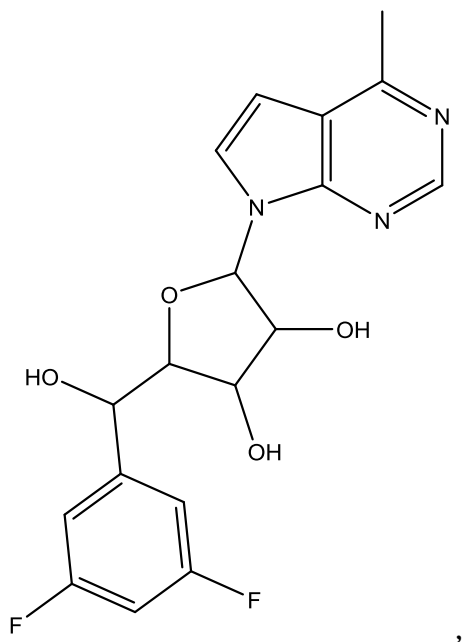


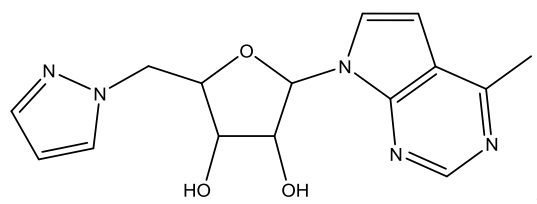
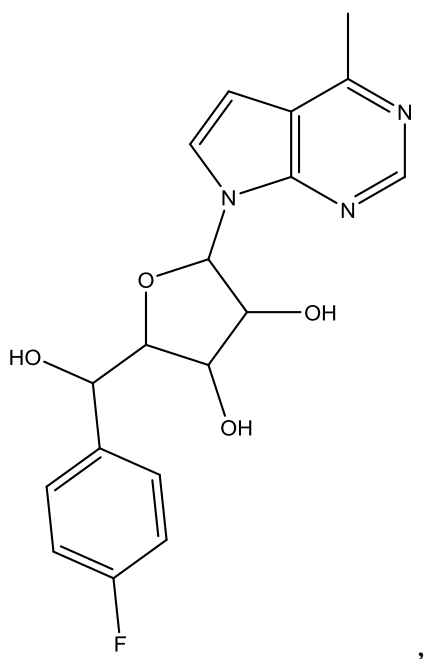
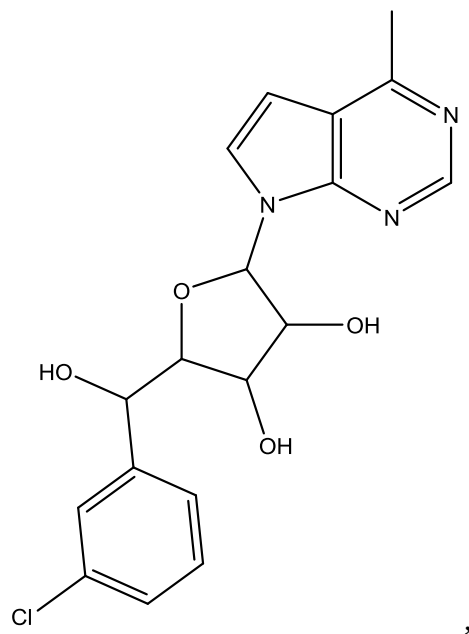
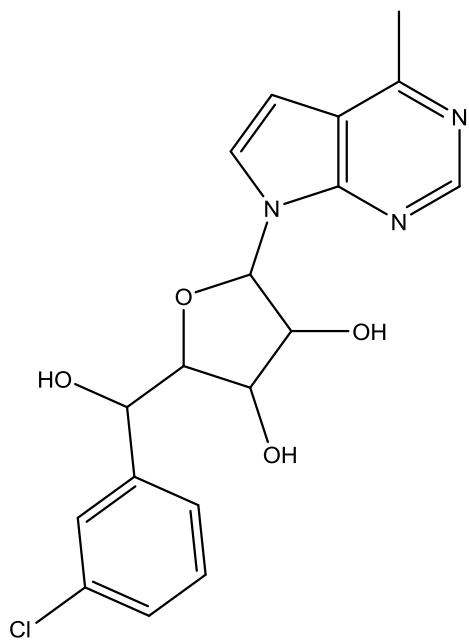


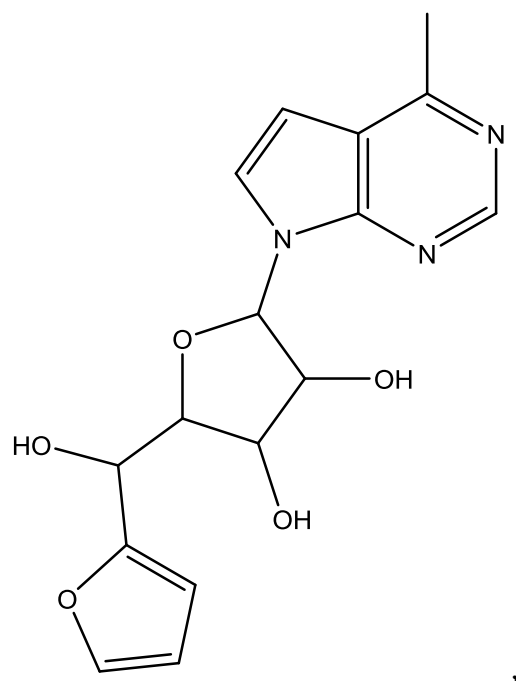
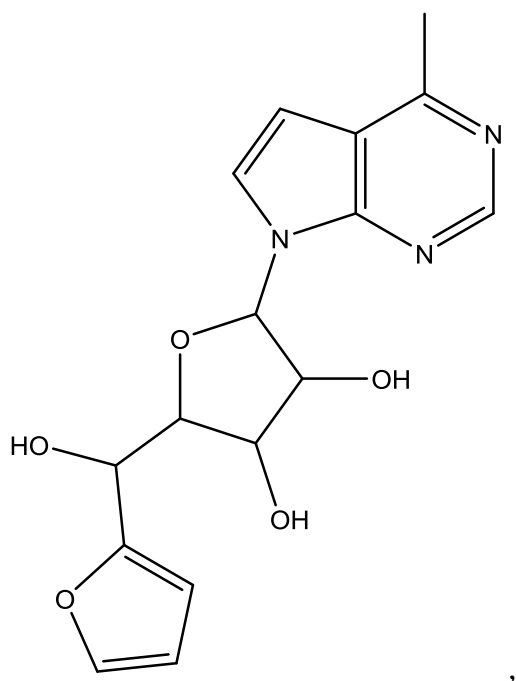
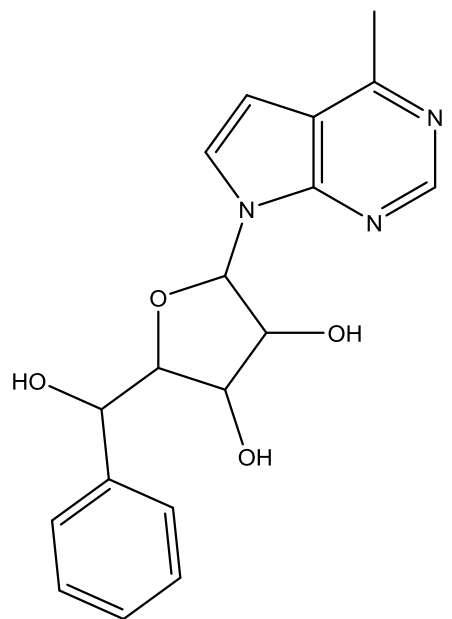
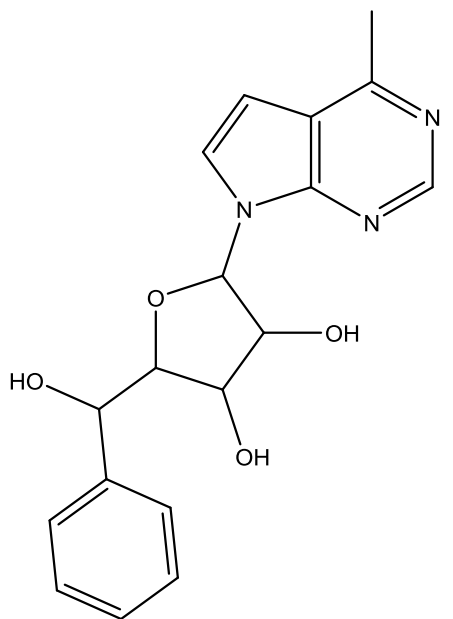


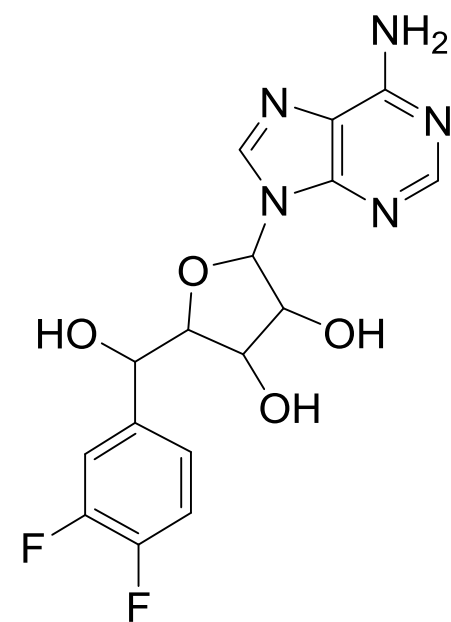
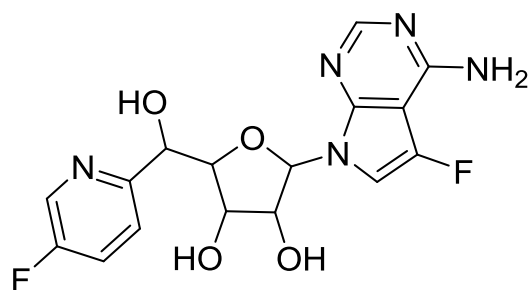
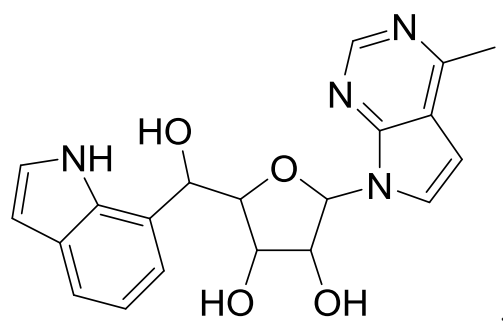
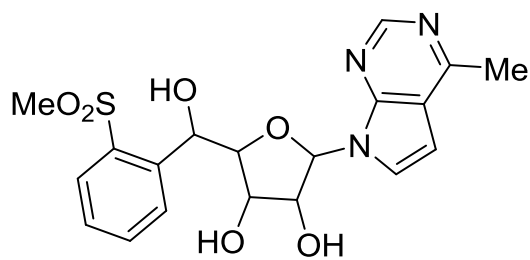


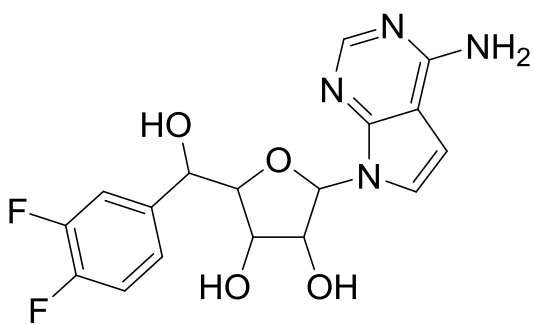




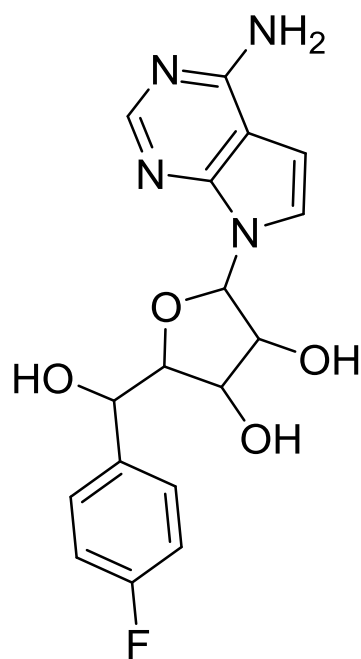




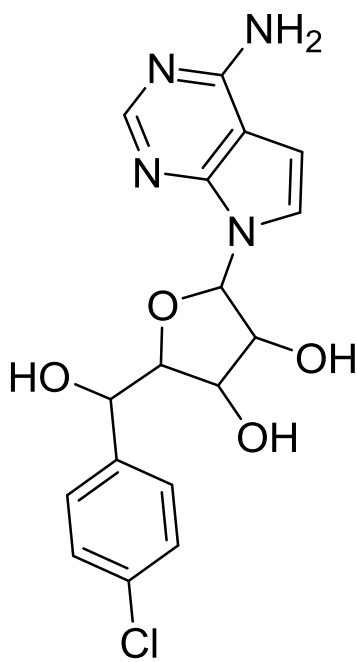




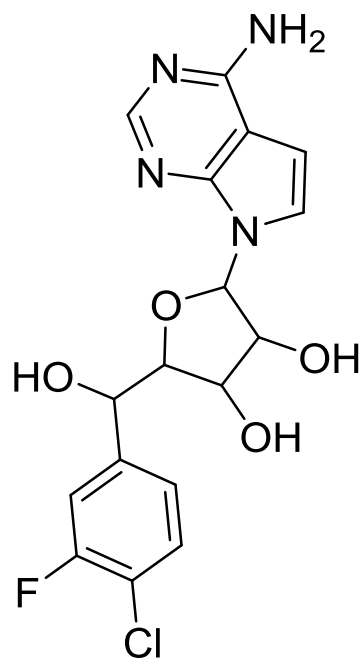
,



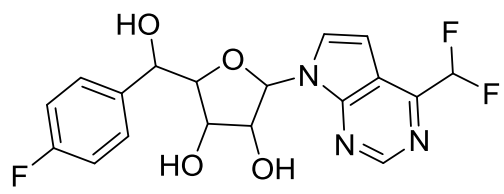
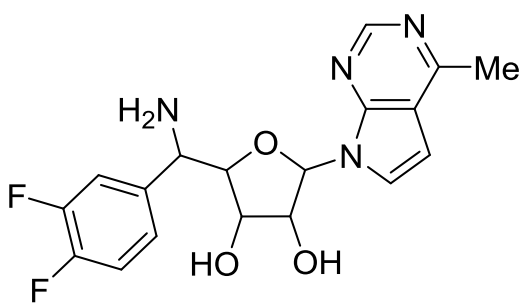
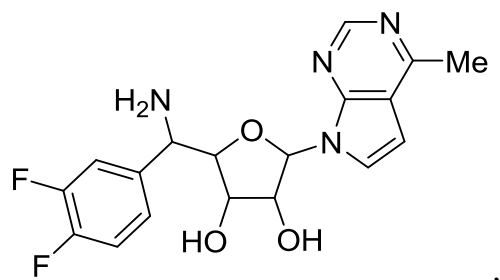
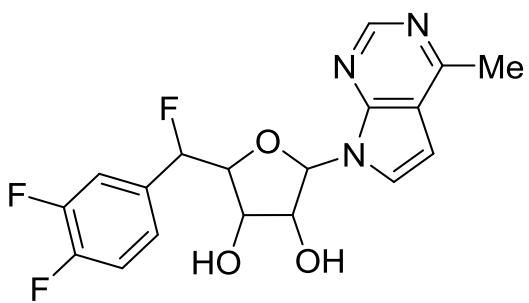
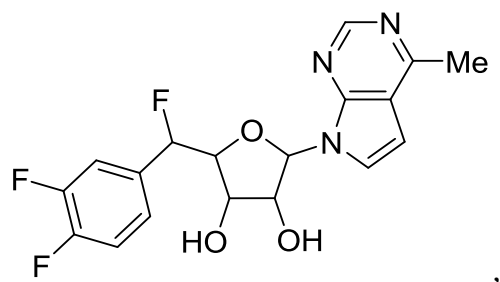
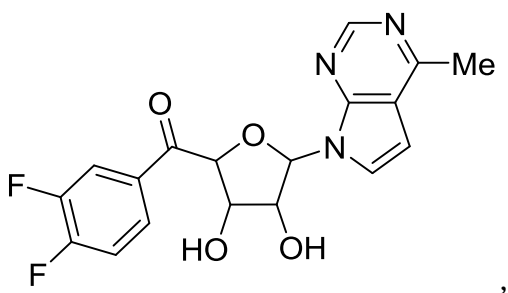
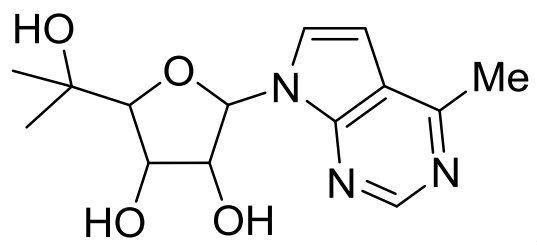
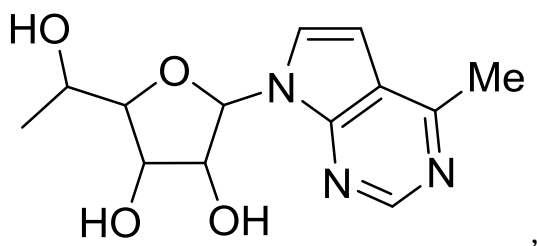
,

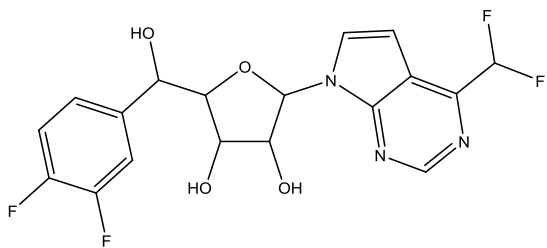


,

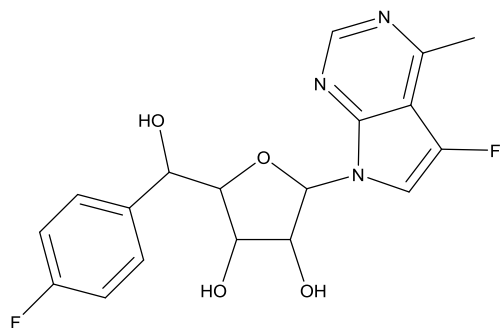


,

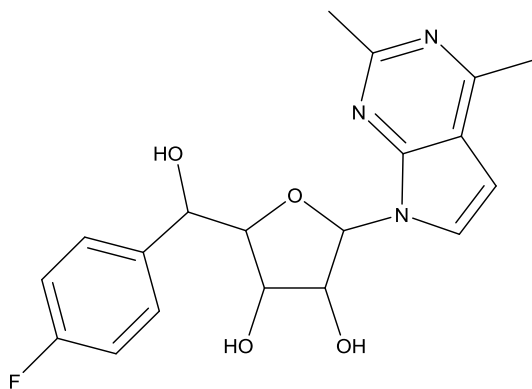




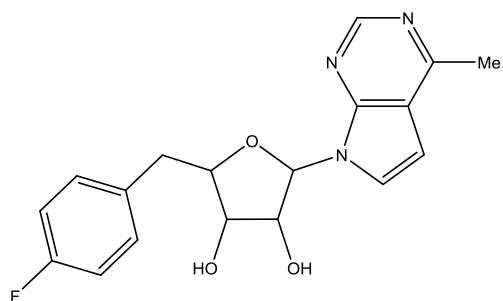
,



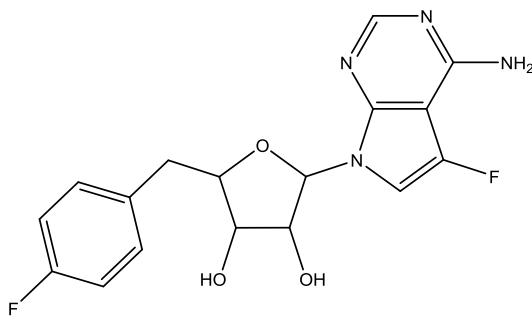
,



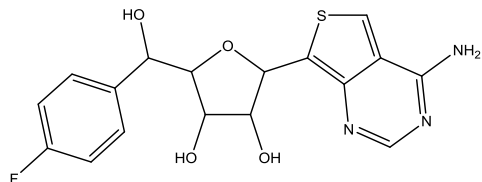
,



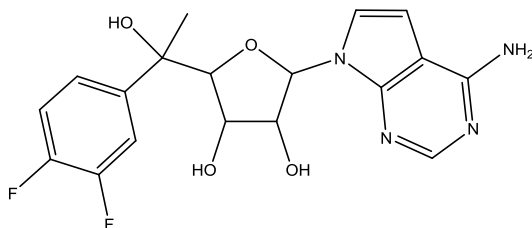
,



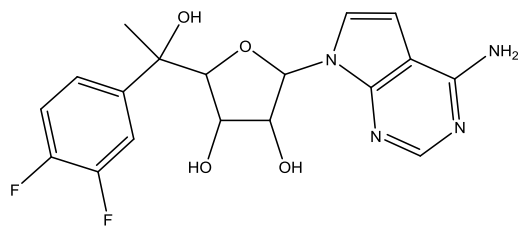
,



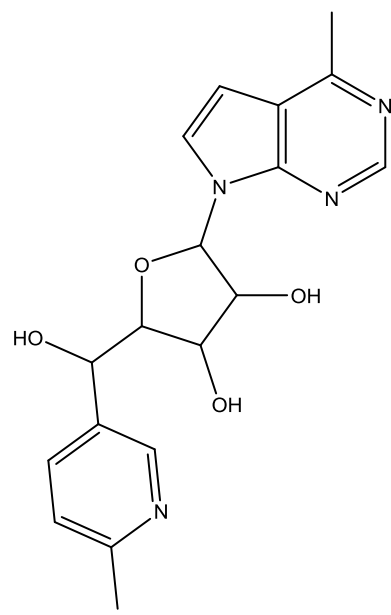
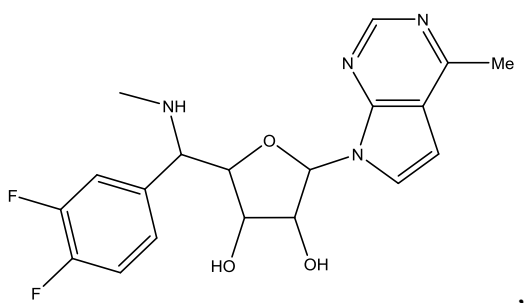
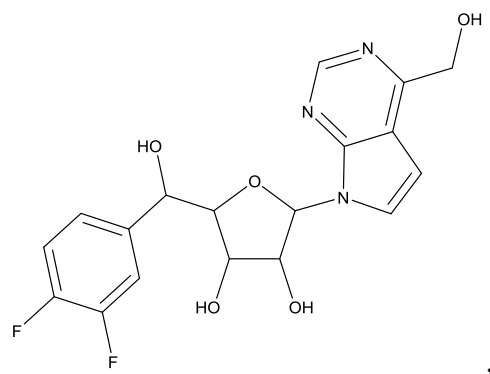
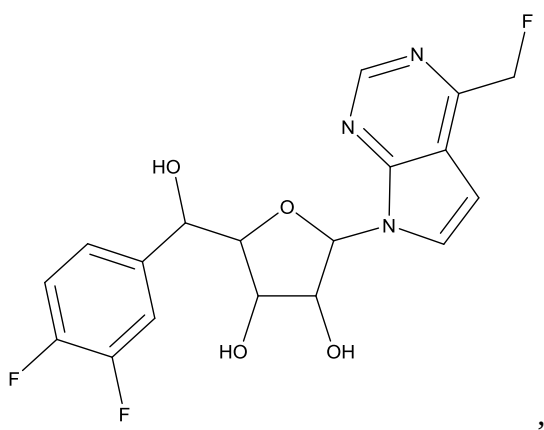
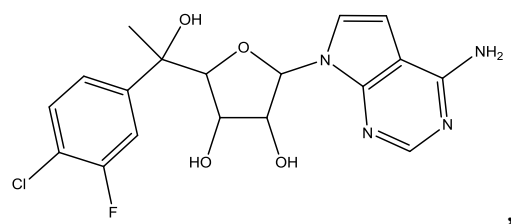
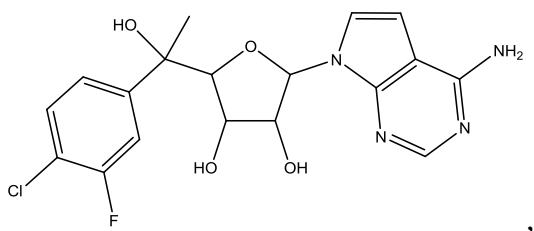
,

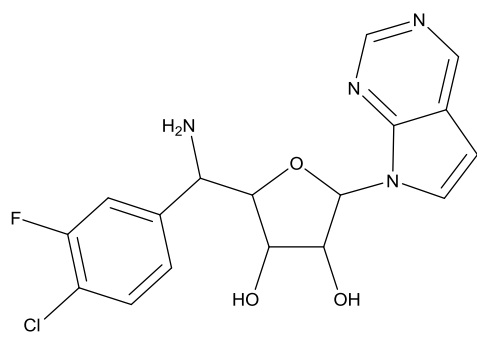
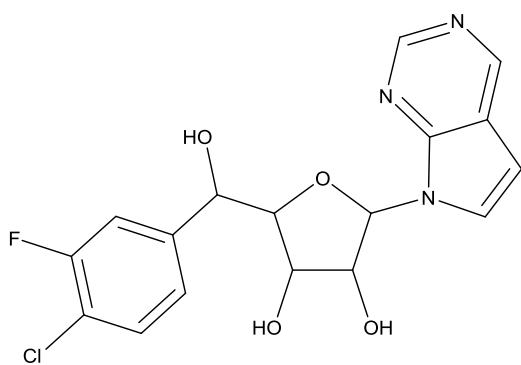
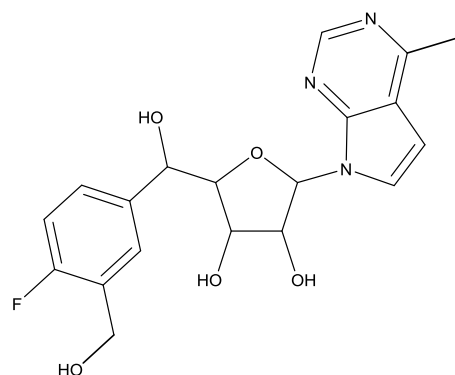
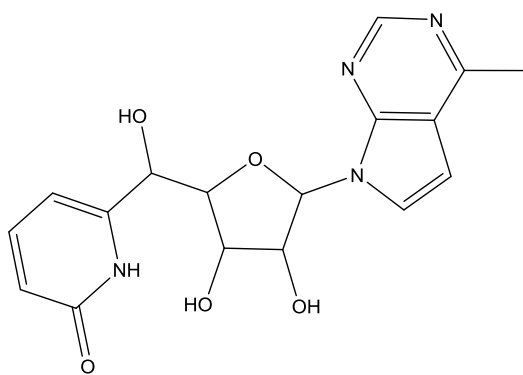
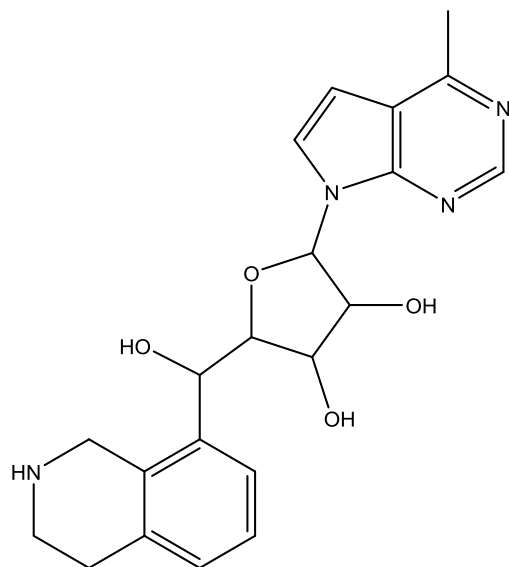
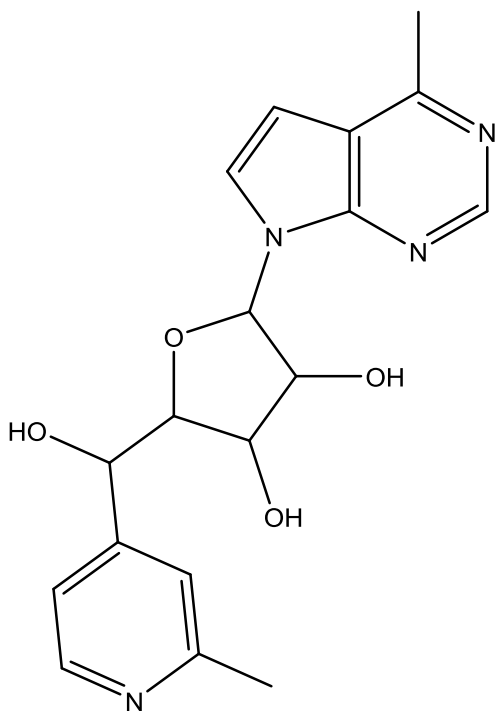


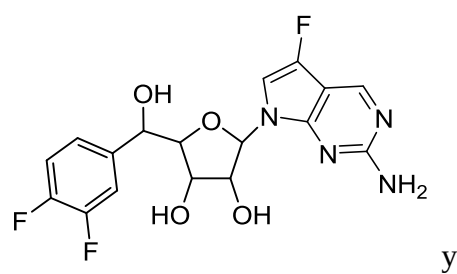
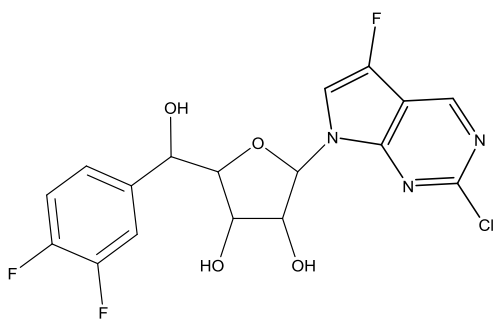
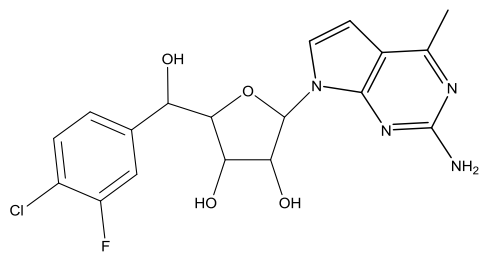
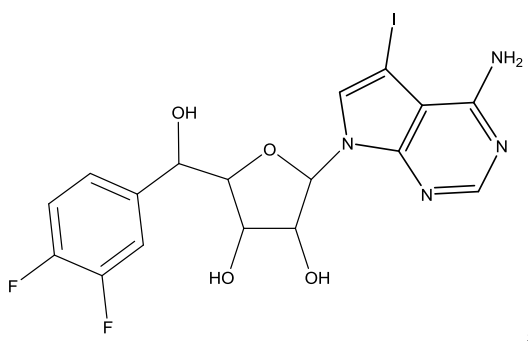
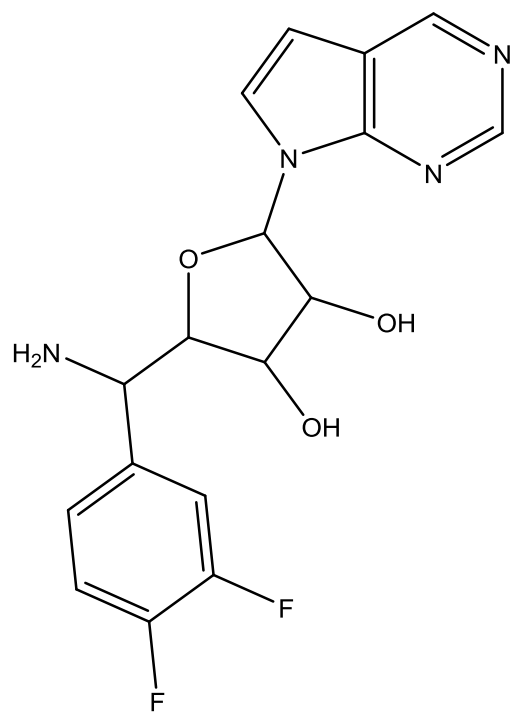
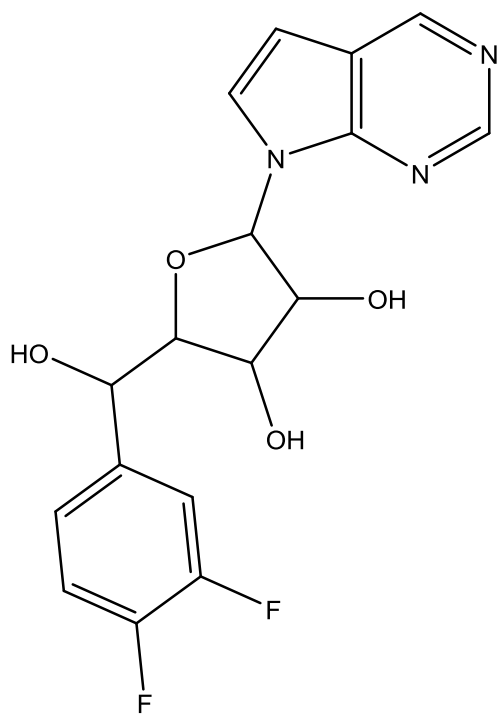
,

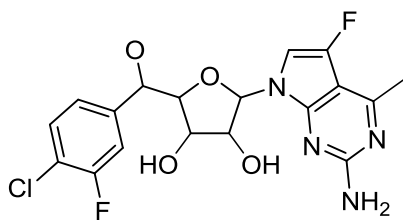


,









o una sal aceptable desde el punto de vista farmacéutico.

19. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-18, o una sal de este aceptable desde el punto de vista farmacéutico, y un portador aceptable desde el punto de vista farmacéutico.

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re.: Expediente No. NC2017/0008403

Solicitud de Patente de Invención titulada: “DERIVADOS DE NUCLEOSIDOS SUSTITUIDOS”.

Solicitante: PFIZER, INC.

Nuestra Ref.: P2017/000174

RESPUESTA AL OFICIO No. 12464, NOTIFICADO EL 24 DE AGOSTO DE 2017
(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo de prórroga previsto en el artículo 39 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar la solicitud. Así entonces, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto se eliminan las Reivindicaciones 20 a 25.

Valga anotar que la modificación efectuada al Capítulo Reivindicatorio cumple a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que ésta de ninguna manera implica una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud original.

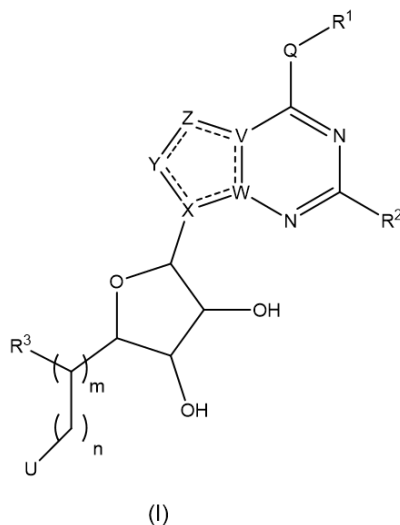
2. a- El Examinador señala que el título es demasiado general puesto que contiene la referencia “nucleósidos” y contiene materia no patentable. Además, el Examinador sugiere modificar el resumen, teniendo en cuenta que debe estar redactado de manera que permita una comprensión clara del problema técnico a resolver.

b- i) Siguiendo las sugerencias del Examinador, y con el ánimo de facilitar el trámite, el título de la invención se modifica de la siguiente manera:

“DERIVADOS DE NUCLEOSIDOS SUSTITUIDOS”

ii) En cuanto el resumen de la invención, este se modifica de la siguiente manera:

“Compuestos de Fórmula general (I):



procesos para la preparación de estos compuestos, composiciones que contienen estos compuestos, y los usos de estos compuestos. Donde V es N o C, donde si V forma un doble enlace, V es carbono; W es N o C, donde si W forma un doble enlace W es carbono; X es N o C donde, si X forma un doble enlace, X es carbono; V es N o C, donde si V forma un doble enlace, V es carbono; Y es CR¹⁰, N, NR¹⁰, O ó S.”

Por lo tanto considero superadas las objeciones del Examinador a este respecto.

3 a- El Examinador señala que de acuerdo a la tasa pagada por el solicitante el examen de patentabilidad se realizará únicamente sobre las 10 primeras reivindicaciones.

b- Llamo respetuosamente la atención del Examinador sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado, el cual contiene un total de 19 reivindicaciones, por lo que me permito adjuntar el comprobante de pago correspondiente nueve (9) reivindicaciones adicionales. Por lo tanto, solicito respetuosamente que todas las reivindicaciones presentadas sean tenidas en cuenta por la SIC al momento de realizar el examen de patentabilidad.

4. a- El Examinador eleva las siguientes objeciones respecto al Capítulo Reivindicatorio:

- el Capítulo Reivindicatorio no es claro, ya que presenta 5 reivindicaciones donde en cada una de éstas reclaman un elemento diferente de la invención. El Examinador sugiere mencionar en las Reivindicaciones 2 a 5 características específicas para los compuestos de la Fórmula (I), de tal manera que sean dependientes de la Reivindicación 1 (independiente);
- las Reivindicaciones 1 a 5 no son concisas porque las definiciones de los sustituyentes tales como “(C₁-C₈)alquilo”, “(C₁-C₈)haloalquilo”, “hidroxi”, “(C₁-C₈)alcoxi”, “(C₅-C₁₂)arilo”, “heteroarilo de 5-12 miembros”, “(C₃-C₁₀)cicloalquilo”, “heterociclilo de 3-12 miembros”, “(C₁-C₈)alquilo-N(R⁶)₂”, “O(C₂-C₈)alquil-N(R⁶)₂”, entre otros se consideran generales, puesto que a partir de los mismo se pueden obtener múltiples compuestos posibles que cumplen con dichas características pero no están adecuadamente soportados en el Capítulo Descriptivo. El Examinador sugiere limitar la materia reclamada a los sustituyentes soportados en el Capítulo Descriptivo;
- las Reivindicaciones 6 a 8 no son claras puesto que no reclaman las características técnicas esenciales de los compuestos de Fórmula (II). El Examinador sugiere mencionar cuales son y adicionar características específicas de los compuestos de la Fórmula (II) presentes en la Reivindicación 5;
- el Capítulo Reivindicatorio reclama materia no patentable.

b- i) En primer lugar, llamo respetuosamente la atención de la Examinadora sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto que comprende un total de 19 reivindicaciones, así como la tasa correspondiente a las nueve (9) reivindicaciones adicionales.

ii) Ahora bien, sea esta la oportunidad de manifestar respetuosamente que cualquier requerimiento relacionado con los requerimientos sustantivos, tales como la patentabilidad del Capítulo Reivindicatorio, que se realicen en la etapa del examen de forma (Art. 38 D486) es irregular, pues dicho examen de forma solamente pretende la verificación de

requerimientos específicos, valga la redundancia, **formales** listados en los Artículos 26 y 27 de la Decisión 486, y no un análisis de fondo de la solicitud que se debe realizar en virtud del Artículo 45 (por ejemplo, análisis de la claridad, soporte o unidad de invención).

Es decir, en relación con la evaluación de requisitos de forma, la Decisión 486 sólo se refiere al cumplimiento de las disposiciones de los Artículos 26 y 27, tal como que el Examinador verifique que la solicitud **contenga** una o más reivindicaciones, **independientemente** del contenido técnico o extensión de las mismas, un título, el petitorio, cesiones, poderes, entre otros.

Lo anterior se encuentra claramente establecido en el Manual Andino de Patentes (MAP), en donde establece con respecto al Examen de Forma de las reivindicaciones que “*En esta etapa del examen, de igual manera que para la descripción, **no se analizan la claridad ni concisión de las reivindicaciones**. Basta con que el examinador de forma reconozca algo que parezca un capítulo reivindicatorio, estos requisitos se vuelven importantes en el momento de entrar a analizar la solicitud en el examen de fondo ya que mediante ellas se medirá la extensión de la patente*”¹ (énfasis fuera de texto). De hecho, el MAP establece respecto al Examen de Forma que dicho examen consiste en la verificación de: Petitorio, Descripción, Reivindicaciones, Dibujos, Resumen, Poderes (si fuere el caso), Copia del contrato de acceso o de uso de conocimiento tradicionales (si fuere el caso), Certificado de depósito del material biológico (si fuere el caso), Documento de cesión de derechos del inventor al solicitante e Idioma.²

Por lo tanto, si bien, con el fin de facilitar el trámite proporciono **voluntariamente** un Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto al presente memorial, considero que las objeciones elevadas por el Examinador respecto a la claridad y la patentabilidad de las reivindicaciones en esta etapa del trámite son injustificados y se extralimitan según las disposiciones legales aplicables pues la claridad y patentabilidad, de las reivindicaciones **no deben** ser estudiadas durante el examen de forma y no le corresponde al solicitante pronunciarse sobre ello en esta etapa del trámite.

De hecho, vale la pena resaltar que el Solicitante **no ha pedido** formalmente que la SIC examine si la invención es patentable, tal como lo establece el Artículo 44 de la Decisión 486, el cual señala que “*Dentro del plazo de seis meses contados desde la publicación de la solicitud, independientemente que se hubieren presentado oposiciones, **el solicitante deberá pedir que se examine si la invención es patentable***. Los Países Miembros podrán cobrar una tasa para la

¹ Manual Andino de Patentes. Sección 5.3.

² Ibídem, Sección 5, subsecciones 5.1 a 5.10, p. 25 a 28

realización de este examen. Si transcurriera dicho plazo sin que el solicitante hubiera pedido que se realice el examen, la solicitud caerá en abandono” (énfasis fuera del texto).

En este sentido, dado que la solicitud no ha sido publicada y el solicitante **tampoco** ha solicitado que se realice el examen de patentabilidad, ni mucho menos se ha pagado la tasa para realizar dicho examen, respetuosamente considero que el Solicitante no debe pronunciarse sobre aspectos relacionados con la claridad ni patentabilidad de las reivindicaciones en respuesta al presente examen de forma, y por el contrario, sólo está en la obligación de responder a aquellas objeciones enmarcadas bajo los Artículos 26, 27 y 38 de la Decisión 486.

iii) Sin perjuicio de lo anterior, me permito resaltar que el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto ya no comprende materia excluida de patentabilidad puesto que se eliminan las Reivindicaciones 20 a 25. Por lo tanto, me permito manifestar que el Capítulo Reivindicatorio Modificado aquí adjunto cumple con los requisitos de patentabilidad de la Decisión 486.

5. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de forma han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de forma y proceda con la publicación de la solicitud de acuerdo con el Artículo 40 de la Decisión 486.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexos:

- Capítulo Reivindicatorio Modificado;
- Recibo de pago correspondiente a nueve (9) reivindicaciones adicionales.