



BOLETIN DE PATENTES

INSTITUTO NACIONAL DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

AÑO X
ISSN - 0325 - 6545

09 de diciembre de 2010

BOLETÍN N° 620
(Edición de 60 páginas)

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y TURISMO
SECRETARIA DE INDUSTRIA, COMERCIO Y DE LA
PEQUEÑA Y MEDIANA EMPRESA

INPI

Presidente
Contador D. Mario Roberto Aramburu

Vicepresidente
Dr. D. Mario E. Díaz

SUMARIO

| | |
|------------------------------------|---|
| Códigos | 2 |
| Publicaciones Adelantadas | 3 |
| Publicaciones Trámite Normal | 4 |

CODIGO INID PARA PATENTES Y MODELOS DE UTILIDAD

- (10) Identificación del documento
- (21) Número de Solicitud
- (22) Fecha de presentación
- (30) Datos de prioridad
- (41) Fecha de puesta a disposición del público
- (51) Clasif. Internacional de Patentes 7^{ma}. Edición
- (54) Título de la invención
- (57) Resumen
- (61) Adicional a:
- (62) Divisional de:
- (71) Solicitante:
- (72) Inventor:
- (74) Número Matricula de agente
- (83) Depósito Microorganismos

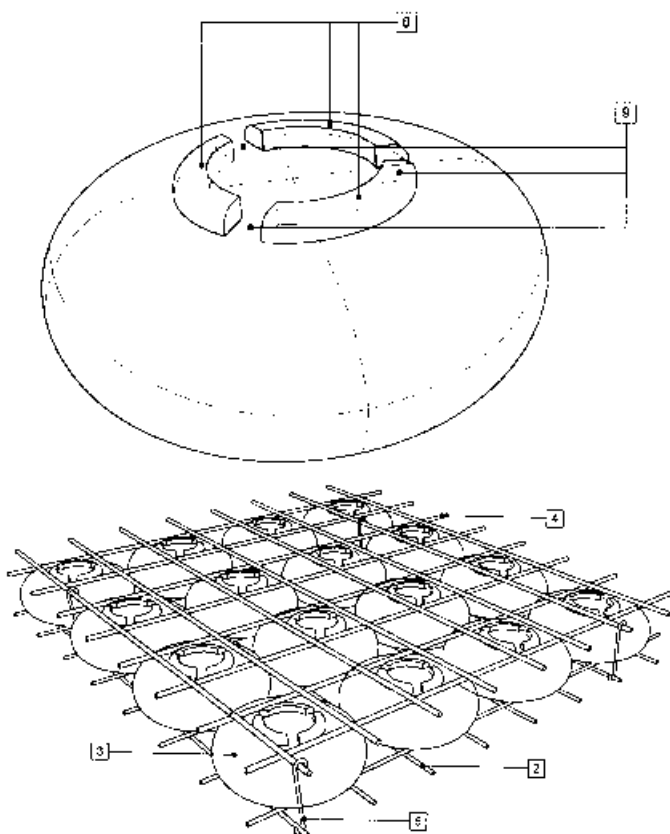
CÓDIGO DE TIPO DOC. SEGÚN DISPOSICIÓN INPI. NRO. 131/96

- A1= Solicitud de Patente Independiente
- A2= Solicitud de Patente Divisional
- A3= Solicitud de Patente Adicional
- A4= Solicitud de Modelo de Utilidad Independiente
- A5= Solicitud de Modelo de Utilidad Divisional
- A6= Solicitud de Modelo de Utilidad Adicional

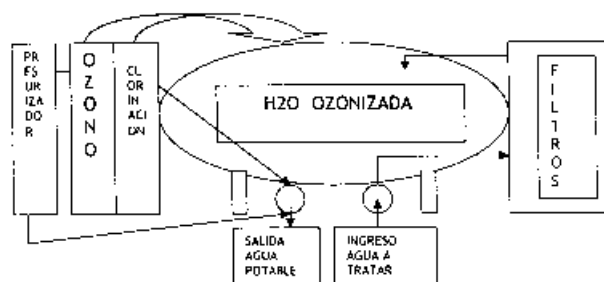
SOLICITUDES DE PATENTE

PUBLICACIONES ADELANTADAS

- (10) AR073837 A1
 (21) P090104168
 (22) 29/10/09
 (51) E04B 1/35, E04C 2/26, 5/04
 (54) METODO CONSTRUCTIVO PARA REALIZAR ESTRUCTURAS LIVIANAS, COMO SER LOSAS, PRELOSAS, PLATEAS, TABIQUES Y VIGAS, CON DISCOS ALIVIANADORES Y MALLAS DISEÑADAS ESPECIFICAMENTE PARA ESTE METODO
 (57) La presente se refiere a un método para la construcción de losas, prelosas, plateas, tabiques y vigas aligerados con discos alivianadores y utilizando mallas diseñadas específicamente para este método. El mismo permite fabricar los componentes que hacen posible la construcción de edificios con estructuras livianas de Hormigón Armado. Es aplicable en la construcción de casas, edificios, puentes, etc.. Un método constructivo de etapas del método (Losa) consiste en: 1) colocación del encofrado tradicional; 2) colocación de malla inferior de acero, separada del fondo mediante separadores plásticos; 3) colocación de discos alivianadores; 4) colocación de malla superior de acero; 5) se vinculan ambas mallas a través de ganchos; 6) hormigonado; 7) desencofrado.
 (71) LEVINTON, RICARDO HORACIO
 HUSARES 2477, (1428) CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073838 A1
 (21) P090104523
 (22) 24/11/09
 (51) C02F 1/00
 (54) SISTEMA PORTATIL BASICO PARA DESINFECCION, ELIMINACION PARCIAL DE SALES, Y POTABILIZACION PARA OBTENCION DE AGUA PARA CONSUMO HUMANO
 (57) Cuando el agua a tratar no sea químicamente apta, por la presencia de aniones o cationes indeseables o perjudiciales para el consumo humano, el sistema contará luego de la filtración con un tratamiento adicional de eliminación de cationes y aniones con resinas de intercambio que operarán continua y alternativamente en forma automática, regenerando el sistema también en forma automática, para entregar en el tanque de tratamiento con ozono el agua en condiciones químicamente aptas para consumo, operando a partir de allí el sistema en la forma descripta anteriormente.
 (71) GUIZZETTI, JUAN JOSE
 AV. AMEGHINO 432, (5300) SANTA ROSA, PROV. DE LA PAMPA, AR
 ALONSO, EDUARDO LUIS
 Bº MUDON - DUPLEX 449, MZA. 129, (8300) CONFLUENCIA, PROV. DE NEUQUEN, AR
 ALONSO, DANIEL OMAR
 Bº NATARIA 6 - CASA 8, MZA. B, (5400) RIVADAVIA, PROV. DE SAN JUAN, AR
 PEREZ, SERGIO FRANCISCO
 CASA 402, Bº 9 DE JULIO, (8316) SENILLOSA, PROV. DE NEUQUEN, AR
 (72) GUIZZETTI, JUAN JOSE - ALONSO, EDUARDO LUIS - ALONSO, DANIEL OMAR - PEREZ, SERGIO FRANCISCO
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073839 A1
 (21) P090104524
 (22) 24/11/09
 (51) C02F 1/00
 (54) SISTEMA PORTATIL BASICO PARA TRATAMIENTO DE EFLUENTES CLOACALES, CON OBTENCION DE AGUA APTA PARA USO EN RIEGO O DESCARGA A ACUIFEROS

(57) El sistema portátil básico de tratamiento de efluentes cloacales, está constituido por un sistema de piletas de tratamiento, donde en la primer piletta se logra una primera degradación a través de la ozono/oxigenación del efluente, pasando a una segunda piletta de generación de biomasa con lodos activados, de los cuales se retroalimentan parcialmente a la primera piletta. Pasa luego por rebalse a una tercera piletta de desinfección del efluente a través de una segunda ozono/oxigenación, y de allí por rebalse pasa a una cuarta piletta de decantación y depuración final, para entregar efluentes aptos para riego o vuelco a acuíferos.

(71) GUIZZETTI, JUAN JOSE

AV. AMEGHINO 432, (5300) SANTA ROSA, PROV. DE LA PAMPA, AR

ALONSO, EDUARDO LUIS

Bº MUDON - DUPLEX 449, MZA. 129, (8300) CONFLUENCIA, PROV. DE NEUQUEN, AR

ALONSO, DANIEL OMAR

Bº NATARIA 6 - CASA 8, MZA. B, (5400) RIVADAVIA, PROV. DE SAN JUAN, AR

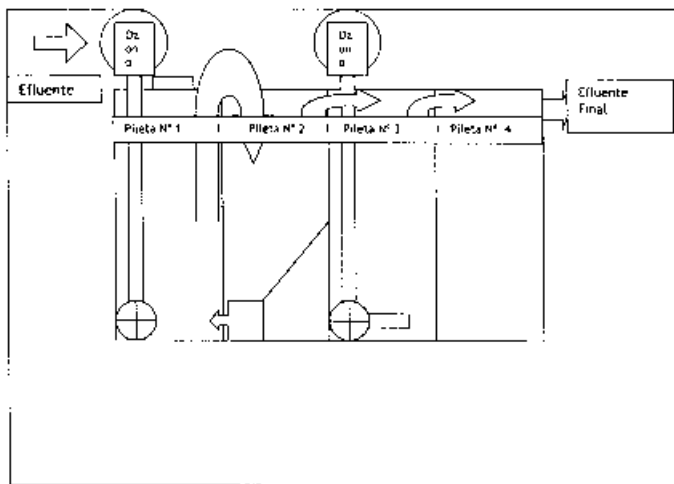
PEREZ, SERGIO FRANCISCO

CASA 402, Bº 9 DE JULIO, (8316) SENILLOSA, PROV. DE NEUQUEN, AR

(72) GUIZZETTI, JUAN JOSE - ALONSO, EDUARDO LUIS - ALONSO, DANIEL OMAR - PEREZ, SERGIO FRANCISCO

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



señuelos, llaveros náuticos o lo similar, que comprende un transistor relacionado simultáneamente a uno de los contactos de un diodo emisor de luz, a uno de los polos de la batería y a un contacto eléctrico dispuesto en la cara externa de la carcasa estanca contenedora del dispositivo, en tanto que el otro contacto del diodo se relaciona sucesivamente con el otro polo de la batería y con un segundo contacto eléctrico ubicado, al igual que el primero, en la cara externa de dicha carcasa.

(71) PAPALETTO, MAURICIO OSCAR

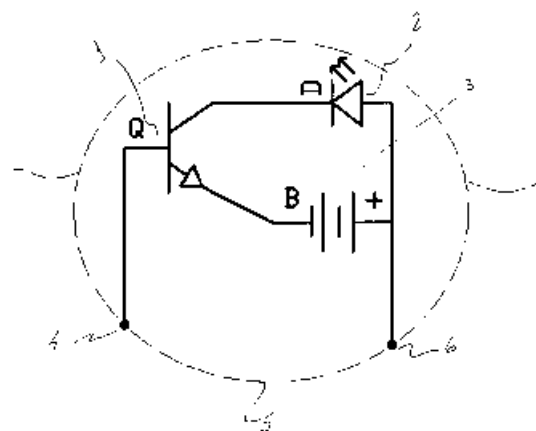
EL CIMARRON 205, (B6702KTA) LUJAN, PROV. DE BUENOS AIRES, AR

(72) PAPALETTO, MAURICIO OSCAR

(74) 491

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073841 A1

(21) P090101055

(22) 25/03/09

(30) EP 08005809.2 27/03/08

(51) C07C 215/20, C07D 209/04, 209/44, A61K 31/133, A61P 25/00

(54) HIDROXIMETILCICLOHEXILAMINAS, MEDICAMENTOS Y USO DE LOS MISMOS PARA LA FABRICACION DE MEDICAMENTOS

(57) La presente se refiere a compuestos que poseen afinidad con el receptor de opioides μ y con el receptor ORL-1, a un procedimiento para su obtención, a medicamentos que contienen estos compuestos y al uso de estos compuestos para la fabricación de medicamentos.

Reivindicación 1: Compuesto de la fórmula general (1) en la que $Y^1, Y^1, Y^2, Y^2, Y^3, Y^3, Y^4$ e Y^4 en cada caso con independencia entre sí se eligen entre el grupo formado por -H, -F, -Cl, -Br, -I, -CN, -NO₂, -CHO, -R⁰, -C(=O)R⁰, -C(=O)H, -C(=O)OH, -C(=O)OR⁰, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR⁰, -C(=O)N(R⁰)₂, -OH, -OR⁰, -OC(=O)H, -OC(=O)R⁰, -OC(=O)OR⁰, -OC(=O)NHR⁰, -OC(=O)N(R⁰)₂, -SH, -SR⁰, -S(=O)₁₋₂R⁰, -S(=O)₁₋₂OH, -S(=O)₁₋₂OR⁰, -S(=O)₁₋₂NH₂, S(=O)₁₋₂NHR⁰, o S(=O)₁₋₂N(R⁰)₂, -NH₂, -NHR⁰, -N(R⁰)₂, -N⁺(R⁰)₃, -N⁺(R⁰)₂O⁻, -NHC(=O)R⁰, -NHC(=O)OR⁰, -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR⁰, y -NHC(=O)N(R⁰)₂;

PUBLICACIONES DE TRAMITE NORMAL

(10) AR073840 A1

(21) P080104371

(22) 07/10/08

(51) A01K 93/00, 93/02

(54) UN DISPOSITIVO EMISOR DE LUZ PARA USO EN BOYAS, SEÑUELOS, LLAVEROS NAUTICOS Y LO SIMILAR

(57) Un dispositivo emisor de luz para uso en boyas,

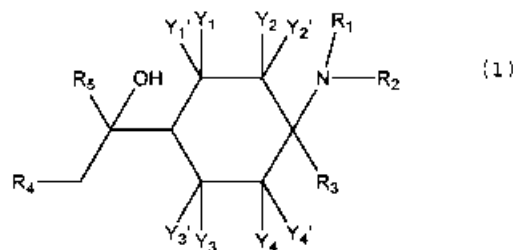
o Y¹ e Y^{1'}, o Y² e Y^{2'}, o Y³ e Y^{3'}, o Y⁴ e Y^{4'} juntos significan =O; R⁰ en cada caso con independencia significa -alifático C₁₋₈, -cicloalifático, -arilo, -heteroarilo, -(alifático C₁₋₈)-cicloalifático C₃₋₁₂, -(alifático C₁₋₈)-arilo, -(alifático C₁₋₈)-heteroarilo, -(cicloalifático C₃₋₈-alifático C₁₋₈), -(cicloalifático C₃₋₈)-arilo o (cicloalifático C₃₋₈)-heteroarilo; R¹ y R² con independencia entre sí significan -H o -alifático C₁₋₈, o R¹ y R² forman, juntos un anillo y significan -(CH₂)₂₋₄; R³ significa -R⁰; R⁴ significa -H, -F, -Cl, -Br, -I, -R⁰, -C(=O)H, -C(=O)R⁰, -C(=O)OR⁰, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR⁰, -C(=O)N(R⁰)₂, -OH, -OR⁰, -OC(=O)H, -OC(=O)R⁰, -OC(=O)OR⁰, -OC(=O)NHR⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -NH₂, -NHR⁰, -N(R⁰)₂, -N⁺(R⁰)₃, -N⁺(R⁰)₂O⁻, -NHC(=O)R⁰, -NHC(=O)OR⁰, -NHC(=O)NHR⁰, -NHC(=O)N(R⁰)₂, -NO₂, -SH, -SR⁰, -S(=O)₁₋₂R⁰, -S(=O)₁₋₂OH, -S(=O)₁₋₂OR⁰, -S(=O)₁₋₂NH₂, S(=O)₁₋₂NHR⁰, o S(=O)₁₋₂N(R⁰)₂, -OS(=O)₁₋₂R⁰, -OS(=O)₁₋₂OH, -OS(=O)₁₋₂OR⁰, -OS(=O)₁₋₂NH₂, -OS(=O)₁₋₂NHR⁰, u -OS(=O)₁₋₂N(R⁰)₂; R⁵ significa -H, -R⁰, -C(=O)H, -C(=O)R⁰, -C(O)OR⁰, -CN, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR⁰ o -C(=O)N(R⁰)₂; en la que "alifático" es en cada caso un resto hidrocarburo alifático ramificado o sin ramificar, saturado o mono- o poliinsaturado, sin sustituir o sustituido una o más veces; "cicloalifático" es en cada caso un resto hidrocarburo alicíclico, mono- o policíclico, saturado o mono- o poliinsaturado, sin sustituir o sustituido una o varias veces, cuyo número de átomos de carbono en el anillo se sitúa con preferencia en el intervalo indicado; en lo referente a "alifático" y "cicloalifático" se entiende por "sustituido una o varias veces" la sustitución única o múltiple de uno o varios átomos de hidrógeno, p. ej. la sustitución una vez, dos veces, tres veces o total por sustituyentes elegidos con independencia entre sí entre el grupo formado por -F, -Cl, -Br, -I, -CN, -NO₂, -CHO, =O, -R⁰, -C(=O)R⁰, -C(=O)H, -C(=O)OH, -C(=O)OR⁰, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR⁰, -C(=O)N(R⁰)₂, -OH, -OR⁰, -OC(=O)H, -OC(=O)R⁰, -OC(=O)OR⁰, -OC(=O)NHR⁰, -OC(=O)N(R⁰)₂, SH, -SR⁰, -SO₃H, -S(=O)₁₋₂R⁰, -S(=O)₁₋₂NH₂, -NH₂, -NHR⁰, -N(R⁰)₂, -N⁺(R⁰)₃, -N⁺(R⁰)₂O⁻, -NHC(=O)R⁰, -NHC(=O)OR⁰, -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR⁰, -NHC(=O)N(R⁰)₂ -Si(R⁰)₃ y -PO(OR⁰)₂; "arilo" significa en cada caso con independencia un sistema carbocíclico que tiene por lo menos un anillo aromático, pero sin heteroátomos en este anillo, dichos restos arilo pueden estar eventualmente condensados con otros sistemas de anillo saturados, (parcialmente) insaturados o aromáticos y cada resto arilo puede estar sin sustituir o sustituido una o varias veces; que a su vez pueden tener uno o más heteroátomos en el anillo, elegidos en cada caso con independencia entre sí, entre N, O y S, y los sustituyentes del arilo pueden ser iguales o distintos y pueden ocupar cualquier posición posible del arilo; "heteroarilo" significa un resto aromático cíclico de 5, 6 ó 7 eslabones, que contiene 1, 2, 3, 4 ó 5 heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o distintos y elegirse entre nitrógeno, oxígeno y azufre, y el heterociclo puede estar sin sustituir o

sustituido una o varias veces; en el caso de sustitución del heterociclo, los sustituyentes serán iguales o distintos y podrán ocupar cualquier posición posible del heteroarilo; y el heterociclo puede formar también parte de un sistema bi- o policíclico; en lo referente a "arilo" y "heteroarilo" se entiende por "sustituido una o varias veces" una sustitución única o múltiple de uno o más átomos de hidrógeno del sistema de anillo por sustituyentes elegidos entre el grupo formado por -F, -Cl, -Br, -I, -CN, -NO₂, -CHO, =O, -R⁰, -C(=O)R⁰, -C(=O)H, -C(=O)OH, -C(=O)OR⁰, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR⁰, -C(=O)N(R⁰)₂, -OH, -O(CH₂)₁₋₂O-, -OR⁰, -OC(=O)H, -OC(=O)R⁰, -OC(=O)OR⁰, -OC(=O)NHR⁰, -OC(=O)N(R⁰)₂, -SH, -SR⁰, -SO₃H, -S(=O)₁₋₂R⁰, -S(=O)₁₋₂NH₂, -NH₂, -NHR⁰, -N(R⁰)₂, -N⁺(R⁰)₃, -N⁺(R⁰)₂O⁻, -NHC(=O)R⁰, -NHC(=O)OR⁰, -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR⁰, -NHC(=O)N(R⁰)₂ -Si(R⁰)₃ y -PO(OR⁰)₂; en los que los átomos de N eventualmente existentes en el anillo pueden estar en cada caso oxidados; en forma de un estereoisómero individual o de una mezcla, de los compuestos libres y/o sus sales fisiológicamente compatibles.

Reivindicación 8: Medicamento que contiene por lo menos un compuesto según una de las reivindicaciones de 1 a 7 en forma estereoisómero individual o de mezcla de varios de los compuestos libres y/o de sus sales fisiológicamente compatibles y eventualmente aditivos y/o adyuvantes idóneos y/o eventualmente otros principios activos.

Reivindicación 9: Uso de un compuesto según una de las reivindicaciones de 1 a 7 en forma de estereoisómero individual o de mezcla de varios, de los compuestos libres y/o de sus sales fisiológicamente compatibles, para la fabricación de un medicamento destinado al tratamiento del dolor.

- (71) GRÜNENTHAL GMBH
ZIEGLERSTRASSE 6, D-52078 AACHEN, DE
- (72) DR. ZEMOLKA, SASKIA - DR. FROMMANN, SVEN
- DR. LINZ, KLAUS - DR. ENGLBERGER, WERNER - DR. THEIL, FRITZ
- (74) 144
- (41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073842 A1
(21) P090101488
(22) 27/04/09

(30) EP 08155323.2 29/04/08

(51) C07C 233/51, 235/12, 237/12, C07D 213/55, 277/30, A61K 31/197, 31/381, 31/426, A61P 3/06, 9/12

(54) DERIVADOS DEL ACIDO 4-DIMETILAMINOBU-TIRICO, PROCESO PARA SU PREPARACION, COMPOSICIONES FARMACEUTICAS Y USO DE LOS MISMOS

(57) Estos compuestos inhiben la actividad de la carnitina-palmitoil-transferasa (CPT), en particular la actividad de la CPT2, y pueden utilizarse como medicamentos.

Reivindicación 1: Compuestos de la fórmula (1) en la que A¹ es NH o un enlace; A² se elige entre el grupo formado por un enlace, O, O(CH₂)₂O, S, SO₂, CF₂ y NR², en el que R² es hidrógeno o alquilo inferior; m es un número elegido entre 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 y 11; n es un número elegido entre 0, 1, 2, 3, 4 y 5; R¹ es arilo elegido entre fenilo y naftilo, dicho arilo está sin sustituir o sustituido por uno, dos, tres, cuatro o cinco restos elegidos entre el grupo formado por alquilo inferior, halógeno, halógeno-alquilo inferior, alcoxi inferior y fenilo, o es heteroarilo elegido entre el grupo formado por piridilo, tienilo y tiazolilo, dicho heteroarilo está sin sustituir o sustituido por uno, dos o tres restos elegidos entre alquilo inferior, halógeno, halógeno-alquilo inferior, alcoxi inferior y fenilo; y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Reivindicación 18: Un proceso para la obtención de compuestos de la fórmula (1) definidos en una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 17, dicho proceso consiste en a) condensar una amina de la fórmula (2) en la que R^p es metilo, etilo o bencilo, con un ácido carboxílico de la fórmula (3) en la que A¹ es un enlace y A², m, n y R¹ tienen los significados definidos en la reivindicación 1, en presencia de una base y un agente de condensación para obtener un compuesto de la fórmula (4), y transformar el compuesto de la fórmula (4) en un compuesto de la fórmula (1), en la que A¹ es un enlace, por hidrólisis de éster o por hidrogenación o b) condensar la amina de la fórmula (2) en la que R^p es metilo, etilo o bencilo, con un isocianato de la fórmula (5) en la que A², m, n y R¹ tienen los significados definidos en la reivindicación 1, en presencia de una base para obtener un compuesto de la fórmula (6), y transformar el compuesto de la fórmula (6) en un compuesto de la fórmula (1), en la que A¹ es NH, por hidrólisis del éster o por hidrogenación, o c) condensar la amina de la fórmula (2) en la que R^p es bencilo, con un ácido carboxílico de la fórmula (7) en la que m y R¹ tienen los significados definidos en la reivindicación 1, en presencia de una base y un agente de condensación para obtener un compuesto de la fórmula (8), y transformar el compuesto de la fórmula (8) en un compuesto de la fórmula (1) en la que es un enlace y n es el número 2 por hidrogenación.

Reivindicación 20: Composiciones farmacéuticas que contienen un compuesto de la fórmula (1) según cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 17

y un vehículo y/o adyuvante farmacéuticamente aceptable.

Reivindicación 23: El uso de los compuestos de la fórmula (1) según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 17 para la fabricación de medicamentos destinados al tratamiento terapéutico o profiláctico de enfermedades que se modulan con inhibidores de la CPT2.

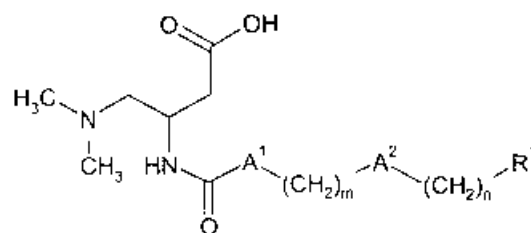
(71) F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

124 GRENZACHERSTRASSE, CH-4070 BASILEA, CH

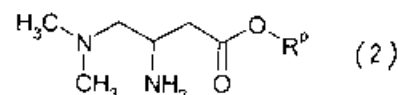
(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

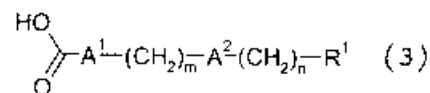
Bol. Nro.: 620



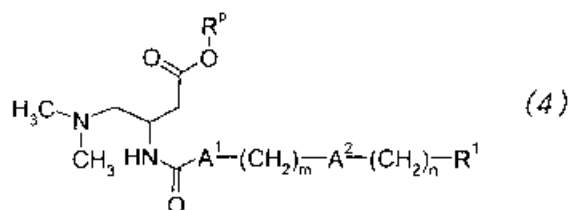
(1)



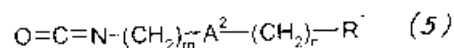
(2)



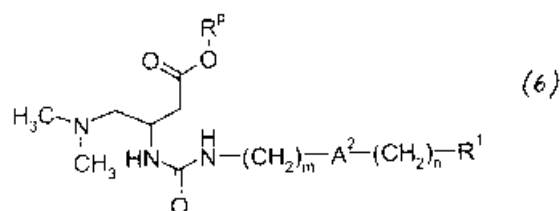
(3)



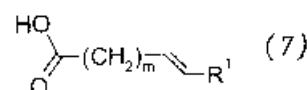
(4)



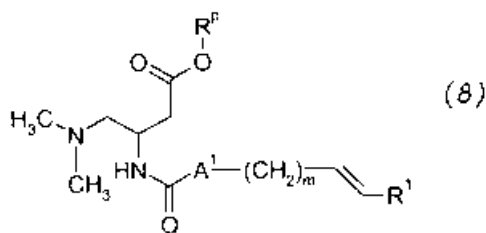
(5)



(6)



(7)

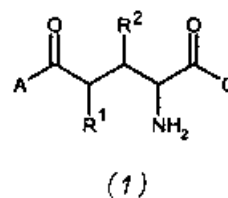


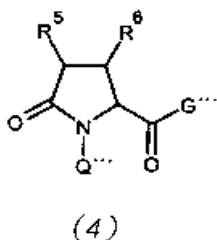
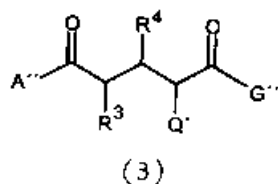
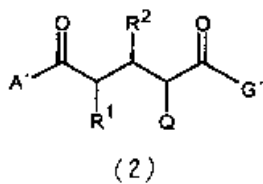
- (10) AR073843 A1
 (21) P090101803
 (22) 20/05/09
 (30) EP 08075508.5 20/05/08
 (51) C07C 229/24, 271/22, A61K 31/225, 51/04, A61P 35/00
 (54) ACIDO L-GLUTAMICO MARCADO CON [F-18] Y DERIVADOS DE L-GLUTAMINA MARCADA CON [F-18] (II), SU USO Y PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACION Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS
 (57) Compuestos y síntesis de ácido L-glutámico marcado [F-18], L-glutamato marcado [F-18], sus derivados de acuerdo con la fórmula (1) y su uso.
Reivindicación 1: Compuestos caracterizados porque responden a la fórmula general (1) en donde A representa: a) hidroxilo, b) alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, c) hidroxi-alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, d) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, e) N(alquilo C₁₋₅)₂, f) NH₂, g) N(H)-L, h) O-L o i) O-Z; G representa: a) hidroxilo, b) O-Z, c) O-alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, d) O-alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, e) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, f) O-alquinilo C₂₋₅ ramificado o no ramificado o g) trifenilmetoxi; R¹ y R² representan: a) hidrógeno, b) ¹⁸F-alcoxi C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, c) ¹⁸F-alquilo C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, d) ¹⁸F-alqueno C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, e) ¹⁸F-alquinilo C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, f) hidroxilo, g) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado o h) alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, con la condición de que uno de los sustituyentes R¹ o R² contenga un isótopo de ¹⁸F y el otro sustituyente no contenga isótopo de ¹⁸F; L representa: a) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b) alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, c) alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado o d) alquinilo C₂₋₅ ramificado o no ramificado; y Z representa un equivalente de un catión metálico, en donde n = 0, 1, 2 ó 3; y comprenden todos los diastereómeros y enantiómeros.
Reivindicación 3: Método para obtener compuestos de la fórmula general (1) de la reivindicación 1 caracterizado porque comprende disociar uno o varios grupos protectores presentes de un compuesto de la fórmula (2) de acuerdo con la reivindicación 4.
Reivindicación 8: Uso de compuestos de la fórmula (3) caracterizado porque es para preparar compuestos de la fórmula (1) ó (2) en donde A' representa: a) alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b)

hidroxi-alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, c) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, d) N(alquilo C₁₋₅)₂, e) NH₂, f) N(H)-L' o g) O-L'; G' representa: a) O-alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b) O-alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, c) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, d) O-alquinilo C₂₋₅ ramificado o no ramificado o e) trifenilmetoxi; R³ y R⁴ representa: a) hidrógeno, b) E-alcoxi C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, c) E-alquilo C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, d) E-alqueno C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, e) E-alquinilo C₆₋₁₀ ramificado o no ramificado, f) hidroxilo, g) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado o h) alcoxi C₁₋₅ ramificado o no ramificado, con la condición de que uno de los sustituyentes R³ o R⁴ contenga un E y el otro sustituyente no contenga E; E representa un grupo lábil; Q' representa: a) N(H)-ter-butoxicarbonilo, b) N(H)-aliloxicarbonilo, c) N(H)-benciloxicarbonilo, d) N(H)-etoxicarbonilo, e) N(H)-metoxicarbonilo, f) N(H)-propoxicarbonilo, g) N(H)-2,2,2-tricloroetoxicarbonilo, h) N(H)-1,1-dimetilpropinilo, i) N(H)-1-metil-1-fenil-etoxicarbonilo, j) N(H)-1-metil-1-(4-bifenilil)-etoxicarbonilo, k) N(H)-ciclobutilcarbonilo, l) N(H)-1-metilciclobutilcarbonilo, m) N(H)-vinilcarbonilo, n) N(H)-alilcarbonilo, o) N(H)-adamantilcarbonilo, p) N(H)-difenilmetilcarbonilo, q) N(H)-cinamilcarbonilo, r) N(H)-formilo, s) N(H)-benzoilo, t) N(H)-trilito, u) N(H)-p-metoxifenil-difenilmetilo, v) N(H)-di-(p-metoxifenil)-fenilmetilo, w) -N=CX'X'' o x) N-(ter-butoxicarbonilo)₂; L' representa: a) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b) alqueno C₂₋₅, ramificado o no ramificado, c) alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado o d) alquinilo C₂₋₅ ramificado o no ramificado; X' y X'' representan, independientemente entre sí, a) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b) arilo sustituido o no sustituido, c) alquilarilo sustituido o no sustituido o d) heteroarilo sustituido o no sustituido; y en donde n = 0, 1, 2 ó 3; y comprenden todos los diastereómeros y enantiómeros.

Reivindicación 12: Composiciones farmacéuticas caracterizadas porque contienen compuestos de la fórmula general (1), (2), (3) ó (4) y vehículos farmacéuticos apropiados.

- (71) BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT
 MÜLLERSTRASSE 170, D-13353 BERLIN, DE
 (72) DR. DINKELBORG, LUDGER - DR. GRAHAM, KEITH - DR. SCHMITT-WILLICH, HERIBERT - DR. FRIEBE, MATTHIAS - DR. BERNDT, MATHIAS - DR. KOGLIN, NORMAN - DR. LEHMANN, LUTZ
 (74) 734
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620





- (10) AR073844 A1
 (21) P090101804
 (22) 20/05/09
 (30) EP 08075509.3 20/05/08
 (51) C07C 229/24, 237/06, A61K 31/225, 51/02, 51/04, A61P 35/00
 (54) ACIDO L-GLUTAMICO Y DERIVADO L-GLUTAMINA (III), USO DE LOS MISMOS Y METODO PARA OBTENERLOS, COMPOSICIONES FARMACEUTICAS Y METODOS DE DIAGNOSTICO DE ENFERMEDADES
 (57) Acido glutámico fluorado (glutamato) y derivados de glutamina en donde el átomo de flúor es ^{19}F . El ácido glutámico (glutamato) y derivados de glutamina son los compuestos de la fórmula general (1) que abarcan todos los posibles derivados de diastereoisómeros y/o enantiómeros o mezclas de los mismos.

Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque responde a la fórmula general (1) donde A es a) hidroxilo, b) alcoxi C_{1-5} ramificado o no ramificado, c) hidroxi-alcoxi C_{1-5} ramificado o no ramificado, d) O-alquilo C_{1-5} -(O-alquilo C_{1-4}) $_n$ -O-alquilo C_{1-4} ramificado o no ramificado, e) N(alquil C_{1-5}) $_2$, f) NH_2 , g) N(H)-L, h) O-L o i) O-Z; y G es a) hidroxilo, b) O-Z, c) O-alquilo C_{1-5} ramificado o no ramificado, d) O-alqueno C_{2-5} ramificado o no ramificado, e) O-alquilo C_{1-5} -(O-alquilo C_{1-4}) $_n$ -O-alquilo C_{1-4} ramificado o no ramificado, o f) O-alquino C_{2-5} ramificado o no ramificado; y R^1 y/o R^2 , son independientemente en forma separada, a) hidrógeno, b) ^{19}F -alcoxi C_{1-10} ramificado o no ramificado, c) ^{19}F -alquilo C_{1-10} ramificado o no ramificado, d) ^{19}F -alqueno C_{2-10} ramificado o no ramificado, e) ^{19}F -alquino C_{2-10} ramificado o no ramificado, f) ^{19}F -arilo C_{6-10} mono o bicíclico sustituido o no sustituido, g) ^{19}F -alquil C_{6-10} arilo mono o bicíclico sustituido o no sustituido, h) ^{19}F -heteroarilo C_{5-10} mono o bicíclico sustituido o no sustituido, i) ^{19}F -alquil-heteroarilo C_{5-10} mono o bicíclico sustituido o no sustituido, j) ^{19}F -cicloalquilo C_{3-6} sustituido o no sustituido, k) ^{19}F -alquil-cicloalquilo C_{3-6} sustituido o no sustituido, l) hidroxilo, m)

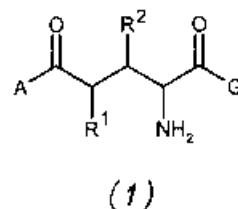
alquilo C_{1-5} ramificado o no ramificado o n) alcoxi C_{1-5} ramificado o no ramificado, donde alquilo se interrumpe opcionalmente o se reemplaza con O, S o N; con la salvedad de que uno de los sustituyentes R^1 o R^2 comprende un átomo de ^{19}F y el otro sustituyente no comprende un átomo de ^{19}F ; y L es a) alquilo C_{1-5} ramificado o no ramificado, b) alqueno C_{2-5} ramificado o no ramificado, c) O-alquilo C_{1-5} -(O-alquilo C_{1-4}) $_n$ -O-alquilo C_{1-4} ramificado o no ramificado, d) alquino C_{2-5} ramificado o no ramificado; y Z es un ión metálico equivalente, con el significado de $n = 0, 1, 2$ ó 3 ; y donde se comprenden las mezclas de todos los diastereómeros y/o enantiómeros posibles así como también los compuestos enantioméricamente puros y sales farmacéuticas de los mismos.

Reivindicación 4: Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende uno o más compuestos de la fórmula general (1) y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

Reivindicación 5: Un método para obtener uno o más compuestos de la fórmula general (1) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque comprende la reacción de un compuesto de la fórmula (1) no fluorado con un átomo de flúor o un derivado del mismo.

Reivindicación 14: Un método para el diagnóstico por imágenes de enfermedades proliferativas, caracterizado porque comprende administrarle a un individuo que lo necesita una cantidad terapéuticamente eficaz de uno o más compuestos de la fórmula general (1) según se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

- (71) BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT
 MÜLLERSTRASSE 170, D-13353 BERLIN, DE
 (72) DR. DINKELBORG, LUDGER - DR. SCHMITT-WILLICH, HERIBERT - DR. GRAHAM, KEITH - DR. FRIEBE, MATTHIAS - DR. BERNDT, MATHIAS - DR. KOGLIN, NORMAN
 (74) 734
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073845 A1
 (21) P090101805
 (22) 20/05/09
 (30) EP 08075510.1 20/05/08
 (51) C07C 229/24, 237/06, A61K 31/04, 31/195, 51/04, C07B 59/00
 (54) DERIVADOS DE ACIDO L-GLUTAMICO Y L-GLU-

TAMINA MARCADOS CON [F-18] (I), SU USO Y PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACION Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS

(57) Compuestos y síntesis de ácido L-glutámico marcado [F-18], L-glutamato marcado [F-18], sus derivados de acuerdo con la fórmula (1) y sus usos.

Reivindicación 1: Compuestos de la fórmula general (1) caracterizados porque A representa: a) hidroxilo, b) alcoxilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, c) hidroxi-alcoxilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, d) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, e) N(alquilo C₁₋₅)₂, f) NH₂, g) N(H)-L, h) O-L o i) O-Z; G representa: a) hidroxilo, b) O-Z, c) O-alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, d) O-alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, e) O-alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado, f) O-alquino C₂₋₅ ramificado o no ramificado o g) trifenilmetoxilo; R¹ y R² representan: a) hidrógeno, b) ¹⁸F-alcoxilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, c) ¹⁸F-alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, d) ¹⁸F-alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, e) ¹⁸F-alquino C₂₋₅ ramificado o no ramificado, f) hidroxilo, g) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado o h) alcoxilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, donde el alquilo está opcionalmente interrumpido por uno o más O, S, o N, con la condición de que uno de los sustituyentes R¹ o R² contenga exactamente un isótopo de ¹⁸F y el ninguno de los otros sustituyentes contenga un isótopo de ¹⁸F, con la condición de que R¹ no sea hidrógeno; L representa: a) alquilo C₁₋₅ ramificado o no ramificado, b) alqueno C₂₋₅ ramificado o no ramificado, c) alquilo C₁₋₅-(O-alquilo C₁₋₄)_n-O-alquilo C₁₋₄ ramificado o no ramificado o d) alquino C₂₋₅ ramificado o no ramificado; Z representa un equivalente de un catión metálico, y donde n = 0, 1, 2 ó 3.

Reivindicación 7: Procedimiento para preparar compuestos de la fórmula general (1) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque comprende disociar uno o más de los grupos protectores presentes en un compuesto de fórmula (2) de acuerdo con las reivindicaciones 4 a 6.

Reivindicación 11: Uso de los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque es en la preparación de un medicamento para usar como agente de diagnóstico por imágenes para enfermedades tumorales.

Reivindicación 15: Composición farmacéutica caracterizada porque contiene compuestos de la fórmula general (1), (2), (3) ó (4), y vehículos farmacéuticamente aceptables.

(71) BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT

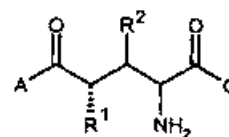
MÜLLERSTRASSE 170, D-13353 BERLIN, DE

(72) DR. DINKELBORG, LUDGER - DR. BERNDT, MATHIAS - DR. SCHMITT-WILLICH, HERIBERT - DR. FRIEBE, MATTHIAS - DR. KOGLIN, NORMAN - DR. SÜLZLE, DETLEV

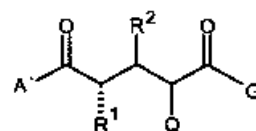
(74) 734

(41) Fecha: 09/12/2010

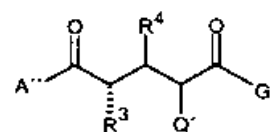
Bol. Nro.: 620



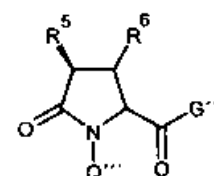
(1)



(2)



(3)



(4)

(10) AR073846 A1

(21) P090103931

(22) 13/10/09

(51) E04C 1/39, 1/00, E04B 2/00

(54) BLOQUES MODULARES CON TETONES PARA APOYO DE CAÑERIAS Y PLACAS EN PAREDES

(57) Tetones en bloques modulares para apoyo de cañerías y placas en paredes, en los que emerge de por lo menos una de las caras de los bloques por lo menos un tetón provisto de una cara sustancialmente plana paralela a la pared lateral del bloque, y otra cara sustancialmente perpendicular a dicha pared dispuesta para recibir por apoyo a los caños o elementos longiformes de distintos servicios; agua, luz, gas, etc.. Lo cual posibilita un sistema para construir paredes en las cuales se proveen a los ladrillos o bloques modulares usados para levantar las mismas de tetones robustos con cierta altura, esto posibilita un método rápido de posicionar las caños de servicios sin necesidad de hacer ranuras en las paredes y además facilitar el posicionado y fijado de las placas que revisten las paredes.

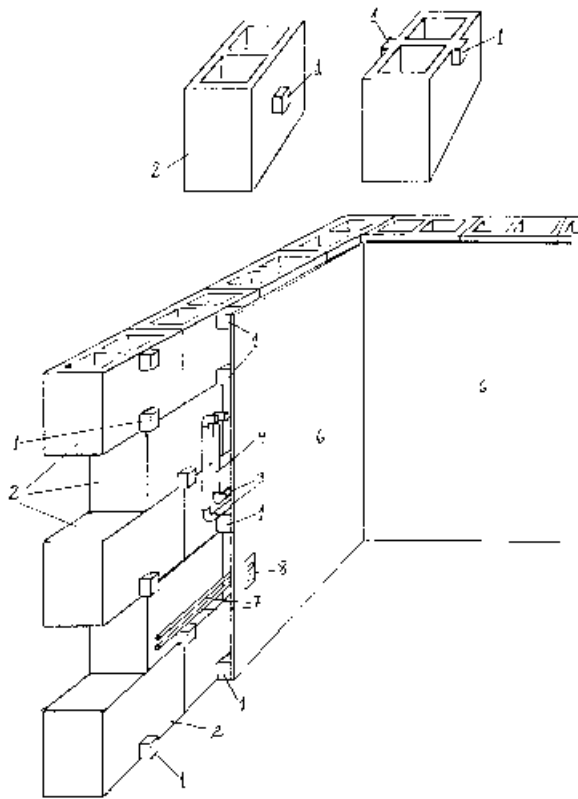
(71) FONTANO, DANIEL EDUARDO

NICANOR PAVAN 314, Bº SAN PABLO, (2900) SAN NICOLAS DE LOS ARROYOS, PROV. DE BUENOS AIRES, AR

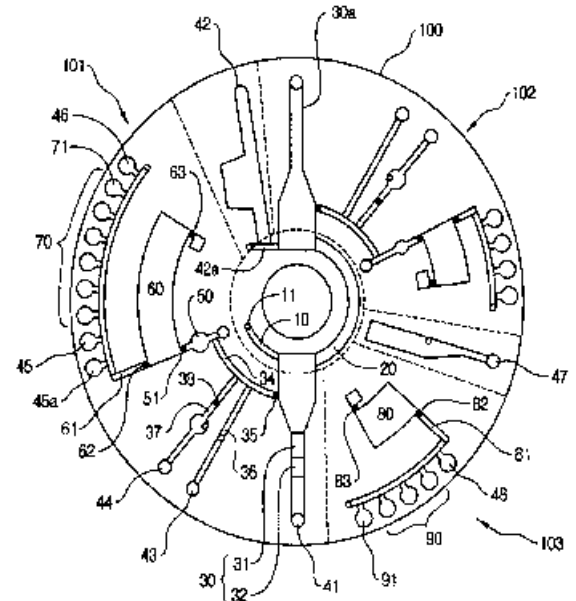
(72) FONTANO, DANIEL EDUARDO

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



- (10) AR073847 A1
 (21) P090103932
 (22) 13/10/09
 (30) KR 10-2008-100763 14/10/08
 KR 10-2009-063456 13/07/09
 (51) G01N 21/25
 (54) UN DISPOSITIVO MICROFLUIDICO Y UN METODO PARA ANALIZAR COMPONENTES CONTENIDOS EN UNA MUESTRA UTILIZANDO DICHO DISPOSITIVO
 (57) Se provee un dispositivo microfluídico que incluye; una cámara de muestra; al menos una unidad de análisis que recibe una muestra de la cámara de muestra y detecta componentes contenidos en la muestra de acuerdo con una reacción entre la muestra y un reactivo; y una cámara de detección de desnaturalización que determina la condición de almacenamiento del dispositivo microfluídico, en donde la cámara de detección de desnaturalización acomoda un material cuya absorción de luz cambia de acuerdo con la temperatura y/o su contenido de agua.
 (71) SAMSUNG ELECTRONICS CO. LTD.
 416, MAETAN-DONG, YEONGTONG-GU, SUWON-SI, GYEONGGI-DO 443-370, KR
 (72) PARK, JONG MYEON - LEE, YANG UI - CHO, YOON KYOUNG - LEE, JEONG GUN - KIM, DO GYOON - KIM, HAN SANG
 (74) 107
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073848 A1
 (21) P090103933
 (22) 14/10/09
 (30) FR 08 05721 16/10/08
 (51) A61K 31/403, A61P 25/00, 25/28
 (54) UTILIZACION DE LA 4-{3-[HEXAHIDROCICLOPENTA[C]PIRROL-2(1H)-IL]PROPOXI}BENZAMIDA PARA LA OBTENCION DE MEDICAMENTOS DESTINADOS AL TRATAMIENTO DE LOS TRASTORNOS DEL SUEÑO, COMPOSICION FARMACEUTICA
 (57) Utilización de la 4-{3-[hexadihidrociclopenta[c]pirrol-2-(1H)-il]propoxi}benzamida para la obtención de medicamentos destinados al tratamiento de los trastornos el sueño.
Reivindicación 5: Composiciones farmacéuticas que contienen 4-{3-[hexadihidrociclopenta[c]pirrol-2-(1H)-il]propoxi}benzamida, o una de sus sales de adición a un ácido o a una base farmacéuticamente aceptable, en combinación con uno o varios excipientes farmacéuticamente aceptables, útiles para el tratamiento de los trastornos del sueño que son la narcolepsia, las hipersomnias que aparecen durante el síndrome de apnea obstructiva del sueño o el síndrome de hiperactividad con déficits atencionales y las somnolencias diurnas, así como el tratamiento de los trastornos del sueño asociados al envejecimiento cerebral, a las enfermedades neurodegenerativas o a los traumatismos craneales.
Reivindicación 8: Composiciones farmacéuticas según una de las reivindicaciones 5 a 7 caracterizadas porque la 4-{3-[hexahidrociclopenta[c]pirrol-2-(1H)-il]propoxi}benzamida está presente en la forma de un oxalato o de un hidrocloruro.
 (71) LES LABORATOIRES SERVIER
 35, RUE DE VERDUN, F-92284 SURESNES CEDEX, FR
 (72) LESTAGE, PIERRE - DANOBER, LAURENCE - MOCAER, ELISABETH - ROGER, ANITA - KEIME-

GUIBERT, FLORENCE

(74) 108

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073849 A1

(21) P090103934

(22) 14/10/09

(30) NL 1036085 17/10/08

(51) B65D 83/00

(54) METODO Y DISPOSITIVO PARA DISPENSAR UN PRODUCTO

(57) La solicitud se relaciona a un método para dispensar un producto de un recipiente interno flexible, el cual es recibido en un recipiente externo relativamente rígido, en donde durante la dispensación del producto, el aire ambiental es succionado hacia un espacio intermedio localizado entre el recipiente interno y el recipiente externo, a través de al menos una abertura de ventilación. El aire ambiental succionado es atrapado en el espacio intermedio luego de la dispensación del producto. La solicitud adicionalmente se relaciona a un dispositivo para dispensar un producto, el cual comprende de un recipiente interno flexible en el cual el producto es recibido, un recipiente externo relativamente rígido en el cual el recipiente interno flexible es recibido, en donde un espacio intermedio es formado entre el recipiente interno y el recipiente externo, y al menos una abertura de ventilación formada en el recipiente externo para succionar aire ambiental hacia el interior del espacio intermedio, dicho dispositivo de dispensación está provisto con mecanismos para atrapar el aire ambiental succionado en el espacio intermedio.

(71) DISPENSING TECHNOLOGIES B.V.

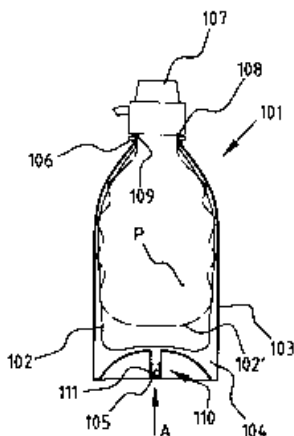
WATERBEEMD 4A, 5705 DN HELMOND, NL

(72) MAAS, WILHELMUS JOHANNES JOSEPH - HURKMANS, PETRUS LAMBERTUS WILHELMUS

(74) 144

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073850 A1

(21) P090103935

(22) 14/10/09

(30) US 12/287910 15/10/08

(51) B65D 83/14

(54) MECANISMO DE SUJECION PARA UN DISPENSADOR

(57) Un mecanismo de sujeción para un envase que incluye una brida y un conector. La brida tiene una porción superior y una porción inferior. Una pared anular está dispuesta entre la porción superior y la inferior. Una pluralidad de proyecciones se extiende desde la porción inferior. Las proyecciones están adaptadas para enganchar de forma desprendible una porción superior de un envase. Una lengüeta se extiende hacia adentro en forma radial desde la porción superior. El conector tiene un diente, donde una porción distal del diente está espaciada en forma circunferencial del conector. El diente está adaptado para asegurarse dentro de una ranura definida entre la lengüeta y la pared anular.

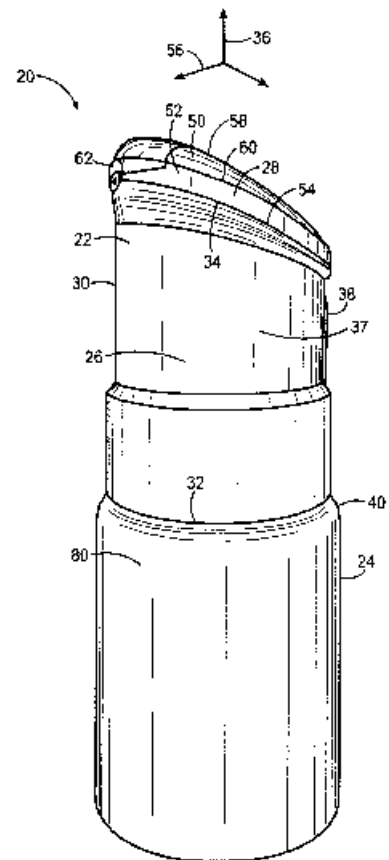
(71) S.C. JOHNSON & SON, INC.

1525 HOWE STREET, RACINE, WISCONSIN 53403-2236, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073851 A1

(21) P090103936

(22) 14/10/09

(30) SE 0802189-1 14/10/08

(51) A61K 31/465, 31/7012, 31/4545, 31/137, A61P 25/00, 25/26, 1/12

(54) FORMA DE DOSIFICACION INTRAORAL DE MULTIPLES PORCIONES Y USO DE ESTA, SISTEMA DE SUMINISTRO, FORMULACION

(57) Reivindicación 1: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones, en donde por lo menos una porción se desintegra rápidamente y por lo menos una porción se desintegra lentamente, en virtud de lo cual el tiempo de desintegración para la porción que se desintegra más lentamente es por lo menos dos veces mayor que para la porción que se desintegra más rápidamente, y en donde cada porción comprende por lo menos un elemento seleccionado de los siguientes: un componente farmacéuticamente activo, un componente que imita la nicotina, un componente amortiguador del pH, un componente regulador del pH, un saborizante, un componente de barrera, un componente de color, un componente adhesivo, un agente enmascarador del sabor, un agente blanqueador dental, un agente para mejorar el aliento, un agente para promover la salud bucal, un agente anticaries y un agente antiinflamatorio.

Reivindicación 2: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el componente farmacéuticamente activo es un componente para tratar la dependencia del tabaco.

Reivindicación 7: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 - 6, en donde al menos una de las porciones que se desintegran rápidamente y lentamente comprende un componente para crear una sensación organoléptica perceptible.

Reivindicación 13: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde (i) la porción que se desintegra rápidamente y la porción que se desintegra lentamente comprenden el mismo agente farmacéuticamente activo, o (ii) la porción que se desintegra rápidamente y la porción que se desintegra lentamente diferentes comprenden agentes farmacéuticamente activos diferentes, o (iii) la porción que se desintegra rápidamente y la porción que se desintegra lentamente, independientemente de sus respectivos tiempos de desintegración, tienen agentes farmacéuticamente activos iguales o diferentes, y/o (iv) la forma de dosificación permite incluir ingredientes no compatibles, tales como componentes saborizantes, amortiguadores de pH y agentes farmacéuticamente activos que no son compatibles, al formular dichos ingredientes en porciones separadas.

Reivindicación 21: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, que comprende un componente para tratar la dependencia del tabaco, el cual es nicotina y/o metabolitos de ésta, tales como cotinina, N'-óxido

de nicotina, nornicotina, (S)-nicotina-N-β-glucuronida y mezclas, isómeros, sales y complejos de éstos en cualquier forma, preferentemente, seleccionado del grupo que comprende una sal de nicotina, la forma de base libre de la nicotina, un derivado de nicotina, tal como un intercambiador catiónico de nicotina, un complejo de inclusión de nicotina o nicotina en cualquier enlace no covalente, nicotina unida a zeolitas, nicotina unida a celulosa o microesferas de almidón, un profármaco de nicotina y/o mezclas de éstos.

Reivindicación 22: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con la reivindicación 21, en donde el complejo de inclusión de nicotina es un complejo de ciclodextrina, en donde la ciclodextrina usada se selecciona entre α-, β- y γ-ciclodextrina, derivados hidroxipropílicos de α-, β- y γ-ciclodextrina, sulfoalquiléter ciclodextrinas, tales como sulfobutiléter β-ciclodextrina, ciclodextrinas alquiladas, tales como la β-ciclodextrina metilada aleatoriamente, y ciclodextrinas ramificadas, tales como glucosil- y maltos-β-ciclodextrina.

Reivindicación 26: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, que comprende un componente para tratar la dependencia del tabaco está seleccionado a partir de uno o más de vareniclina, bupropión, nortriptilina, doxepina, fluoxetina, imipramina, moclobemida y/o citisina.

Reivindicación 36: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 26, en donde por lo menos una porción que se desintegra rápidamente además comprende un componente amortiguador del pH y/o un componente regulador del pH seleccionado de un carbonato que incluye bicarbonato o sesquicarbonato, glicinato, fosfato, glicerofosfato o citrato de un metal alcalino, tal como potasio o sodio, o amonio, que incluye fosfato trisódico, fosfato ácido disódico, fosfato tripotásico, fosfato ácido dipotásico, e hidróxido de calcio, glicinato de sodio, trometamol o un aminoácido; y mezclas de éstos.

Reivindicación 43: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 26 y 31 - 42, en donde el agente farmacéuticamente activo dentro de la porción que se desintegra rápidamente está seleccionado a partir del grupo formado por zinc, clorhexidina, L. reuteri, nistatina, anfotericina, miconazol, fenilefrina, dextrometorfán, pseudoefedrina, acetaminofeno, ibuprofeno, ketoprofeno, loperamida, famotidina, carbonato de calcio, simeticona, clorfeniramina, metocarbonal, clofedanol, ácido ascórbico, mentol, pectina, diclonina, y benzocaína, y sales farmacéuticamente aceptables y derivados de éstos.

Reivindicación 46: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 26 y 31 - 45

que tiene capa(s) entre porciones que comprende(n) un material comestible similar a un adhesivo.

Reivindicación 47: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con la reivindicación 46, en donde el material comestible similar a un adhesivo comprende un ingrediente seleccionado del grupo formado por polietilenglicol, óxido de polietileno, policaprolactona, cera de carnaúba, cera microcristalina, oppanol, cera de goma laca y cera de abeja.

Reivindicación 48: Una forma de dosificación intraoral de múltiples porciones de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 26 y 31 - 47, en donde al menos una porción que se desintegra rápidamente comprende por lo menos un agente farmacéuticamente activo seleccionado del grupo de fenilefrina, dextrometorfán, clorfeniramina, clofedanol y pseudoefedrina, y en donde por lo menos una porción que se desintegra lentamente comprende por lo menos un agente farmacéuticamente activo seleccionado del grupo de mentol, nicotina, diclonina, pectina, benzocaína, timol, salicilato de metilo y eucaliptol.

Reivindicación 52: Una formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 26 y 31 - 51, que comprende nicotina y/o metabolitos de ésta, tales como cotinina, N'-óxido de nicotina, nornicotina, (S)-nicotina-N-β-glucurónido y mezclas, isómeros, sales y complejos de éstos en cualquier forma para uso en terapia, en donde la terapia es el tratamiento de una enfermedad seleccionada del grupo formado por dependencia del tabaco o de la nicotina, enfermedad de Alzheimer, enfermedad de Crohn, enfermedad de Parkinson, síndrome de Tourette, colitis ulcerosa y control de peso después de dejar de fumar.

Reivindicación 54: Una formulación de acuerdo con la reivindicación 53, caracterizado porque comprende nicotina y *Lactobacillus reuteri*.

Reivindicación 55: Una formulación de acuerdo con la reivindicación 53, caracterizado porque comprende terbutalina y loratadina.

(71) MCNEIL AB

NORRBROPLATSEN 2, S-251 09 HELSINGBORG, SE

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073852 A1

(21) P090103937

(22) 14/10/09

(30) US 61/106513 17/10/08

(51) A61K 39/395, 31/517, C07K 16/28, 16/18, A61P 35/00

(54) TERAPIA DE COMBINACION, USO DE UN ANTAGONISTA DE C-MET Y UN ANTAGONISTA DE VEGF

(57) Reivindicación 1: Uso de un antagonista de c-met y un antagonista de VEGF, caracterizado porque es

para la manufactura de un medicamento útil para tratar cáncer en un sujeto.

Reivindicación 4: El uso de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el anticuerpo es monovalente y comprende una región Fc, en donde la región Fc comprende un primer y un segundo polipéptido, en donde el primer polipéptido comprende la secuencia de Fc representada en la figura 9 (SEQ ID N° 12) y el segundo polipéptido comprende la secuencia representada en la figura 10 (SEQ ID N° 13).

Reivindicación 8: El uso de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el anticuerpo es MetMab.

Reivindicación 10: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 8, en donde el antagonista de VEGF es una proteína del receptor de VEGF soluble, o uno de sus fragmentos de unión a VEGF, o una proteína del receptor de VEGF quimérico.

Reivindicación 14: El uso de acuerdo con la reivindicación 13, en donde el anticuerpo monoclonal es un anticuerpo quimérico, completamente humano o humanizado.

Reivindicación 15: El uso de acuerdo con la reivindicación 14, en donde el anticuerpo anti-VEGF es bevacizumab, anticuerpo de la serie G6, anticuerpo de la serie B20, o sus fragmentos de unión de VEGF.

Reivindicación 17: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, que además comprende el uso de un antagonista de EGFR al sujeto.

Reivindicación 18: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR tiene una fórmula general (1), de acuerdo con US 5.757.498, que se incorpora en la presente por referencia, en donde: m es 1, 2 ó 3; cada R¹ se selecciona de modo independiente del grupo que consiste en hidrógeno, halo, hidroxilo, hidroxiamino, carboxilo, nitro, guanidino, ureido, ciano, trifluorometilo, y -alquilen C₁₋₄-W-fenilo en donde W es un enlace único, O, S o NH; o cada R¹ se selecciona de modo independiente de R⁹ y alquilo C₁₋₄ sustituido con ciano, en donde R⁹ se selecciona del grupo que consiste en R⁵, -OR⁶, -NR⁶R⁶, -C(O)R⁷, -NHOR⁵, -OC(O)R⁶, ciano, A y -YR⁵; R⁵ es alquilo C₁₋₄; R⁶ es de modo independiente hidrógeno o R⁵; R⁷ es R⁵, -OR⁶ o NR⁶R⁶; A se selecciona de piperidino, morfolino, pirrolidino, 4-R⁶-piperazin-1-ilo, imidazol-1-ilo, 4-piridon-1-ilo, -(alquilen C₁₋₄)(CO₂H), fenoxi, fenilo, fenilsulfanilo, alqueno C₂₋₄, y -(alquilen C₁₋₄)C(O)NR⁶R⁶; e Y es S, SO, o SO₂; en donde los residuos alquilo de R⁵, -OR⁶ y -NR⁶R⁶ están opcionalmente sustituidos con uno a tres sustituyentes halo y los residuos alquilo de R⁵, -OR⁶ y -NR⁶R⁶ están opcionalmente sustituidos con 1 ó 2 grupos R⁹, y en donde los residuos alquilo de dichos sustituyentes opcionales están opcionalmente sustituidos con halo o R⁹, con la condición de que dos heteroátomos no están unidos al mismo átomo de carbono; o cada R¹ se selecciona de modo independiente de -NHSO₂R⁵, ftalimido-alquilo C₁₋₄-sulfonilamino, benzamido, bencensulfonil-

amino, 3-fenilureido, 2-oxopirrolidin-1-ilo, 2,5-dioxopirrolidin-1-ilo y R¹⁰-alcanoilamino C₂₋₄ en donde R¹⁰ se selecciona de halo, -OR⁶, alcanoiloxi C₂₋₄, -C(O)R⁷, y -NR⁶R⁶; y en donde dichos grupos R¹ -NHSO₂R⁵, ftalimido-C₁₋₄ alquilsulfonilamino, benzamido, bencensulfonilamino, 3-fenilureido, 2-oxopirrolidin-1-ilo, 2,5-dioxopirrolidin-1-ilo, y R¹⁰-alcanoilamino C₂₋₄ están opcionalmente sustituidos con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alquilo C₁₋₄, ciano, metansulfonilo y alcoxi C₁₋₄; o dos grupos R¹ se toman juntos con los carbonos a los que están unidos para formar un anillo de 5-8 miembros que incluye 1 ó 2 heteroátomos seleccionados de O, S y N; R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alcoxi C₁₋₄, -NR⁶R⁶, y -SO₂R⁵; n es 1 ó 2 y cada R³ se selecciona de modo independiente de hidrógeno, halo, hidroxilo, alquilo C₁₋₆, -NR⁶R⁶ y alcoxi C₁₋₄, en donde los residuos alquilo de dichos grupos R³ están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alcoxi C₁₋₄, -NR⁶R⁶, y -SO₂R⁵; y R⁴ es azido o -(etinil)-R¹¹ en donde R¹¹ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con hidroxilo, -OR⁶, o -NR⁶R⁶.

Reivindicación 20: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR de fórmula (1) es N-(3-etinilfenil)-6,7-bis(2-metoxietoxi)-4-quinazolinamina.

Reivindicación 21: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR N-(3-etinilfenil)-6,7-bis(2-metoxietoxi)-4-quinazolinamina está en forma de sal HCl.

Reivindicación 23: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR es 4-(3'-cloro-4'-fluoroanilino)-7-metoxi-6-(3-morfolinopropoxi)quinazolina.

Reivindicación 24: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR es N-[3-cloro-4-[(3-fluorofenil)metoxi]fenil]-6-[5-[[[2-(metilsulfonil)etil]amino]metil]-2-furanil]-4-quinazolinamina.

Reivindicación 25: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el antagonista de EGFR es 4-(4-bromo-2-fluoroanilino)-6-metoxi-7-(1-metilpiperidin-4-ilmetoxi)quinazolina.

Reivindicación 26: El uso de acuerdo con la reivindicación 17, en donde el anticuerpo cmet es MetMab, el antagonista de EGFR es N-(3-etinilfenil)-6,7-bis(2-metoxietoxi)-4-quinazolinamina y el antagonista de VEGF es bevacizumab.

Reivindicación 27: El uso de cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el cáncer se selecciona del grupo que consiste en cáncer de mamas, cáncer colorrectal, cáncer rectal, cáncer pulmonar de células no pequeñas, linfoma no Hodgkins, cáncer de células renales, cáncer prostático, cáncer hepático, cáncer pancreático, sarcoma de tejido blando, sarcoma de kaposi, carcinoma carcinoide, cáncer de cabeza y cuello, cáncer gástrico, melanoma, cáncer ovárico,

mesotelioma, y mieloma múltiple.

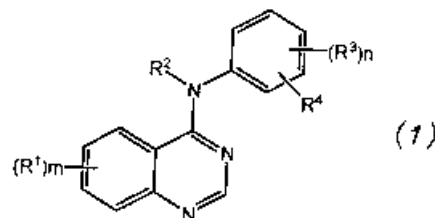
(71) GENENTECH, INC.

1 DNA WAY, SOUTH SAN FRANCISCO, CALIFORNIA 94080-4990, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073853 A1

(21) P090103938

(22) 14/10/09

(30) US 61/106495 17/10/08

US 61/152570 13/02/09

(51) A61K 39/395, 31/517, C07K 16/28, 16/18, A61P 35/00

(54) METODO DE TRATAMIENTO, USO

(57) **Reivindicación 1:** Uso de un anticuerpo anti-c-met a una dosis de aproximadamente 15 mg/kg cada tres semanas, caracterizado porque es para la manufactura de un medicamento útil para tratar cáncer en un sujeto.

Reivindicación 2: Uso de (a) un anticuerpo anti-c-met a una dosis de aproximadamente 15 mg/kg cada tres semanas; y (b) un antagonista de EGFR, caracterizado porque es para la manufactura de un medicamento útil para tratar cáncer en un sujeto.

Reivindicación 3: El uso de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en donde el anticuerpo comprende una sola rama de unión al antígeno y comprende una región Fc, en donde la región Fc comprende un primer y un segundo polipéptido de Fc, en donde el primer y el segundo polipéptido de Fcs están presentes en un complejo y forman una región Fc que aumenta la estabilidad de dicho fragmento de anticuerpo en comparación con una molécula de Fab que comprende dicha rama de unión al antígeno.

Reivindicación 7: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 6, en donde el anticuerpo es MetMab.

Reivindicación 8: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 2 - 7, en donde el antagonista de EGFR tiene una fórmula general (1), de acuerdo con US 5.757.498, que se incorpora en la presente por referencia, en donde: m es 1, 2 ó 3; cada R¹ se selecciona de modo independiente del grupo que consiste en hidrógeno, halo, hidroxilo, hidroxiamino, carboxi, nitro, guanidino, ureido, ciano, trifluorometilo, y -alquilen C₁₋₄-W-fenilo en donde W es un enlace único, O, S o NH; o cada R¹ se selecciona de modo independiente de R⁹ y alqui-

lo C₁₋₄ sustituido con ciano, en donde R⁹ se selecciona del grupo que consiste en R⁵, -OR⁶, -NR⁶R⁶, -C(O)R⁷, -NHOR⁵, -OC(O)R⁶, ciano, A y -YR⁵; R⁵ es alquilo C₁₋₄; R⁶ es de modo independiente hidrógeno o R⁵; R⁷ es R⁵, -OR⁶ o NR⁶R⁶; A se selecciona de piperidino, morfolino, pirrolidino, 4-R⁶-piperazin-1-ilo, imidazol-1-ilo, 4-piridon-1-ilo, -(alquilen C₁₋₄)(CO₂H), fenoxi, fenilo, fenilsulfanilo, alqueno C₂₋₄, y -(alquilen C₁₋₄)C(O)NR⁶R⁶; e Y es S, SO, o SO₂; en donde los residuos alquilo de R⁵, -OR⁶ y -NR⁶R⁶ están opcionalmente sustituidos con uno a tres sustituyentes halo y los residuos alquilo de R⁵, -OR⁶ y -NRR⁶ están opcionalmente sustituidos con 1 ó 2 grupos R⁹, y en donde los residuos alquilo de dichos sustituyentes opcionales están opcionalmente sustituidos con halo o R⁹, con la condición de que dos heteroátomos no estén unidos al mismo átomo de carbono; o cada R¹ se selecciona de modo independiente de los grupos R¹-NHSO₂R⁵, ftalimido-alquil C₁₋₄-sulfonilamino, benzamido, bencensulfonilamino, 3-fenilureido, 2-oxopirrolidin-1-ilo, 2,5-dioxopirrolidin-1-ilo y R¹⁰-alcanoilamino C₂₋₄ en donde R¹⁰ se selecciona de halo, -OR⁶, alcanoiloxi C₂₋₄, -C(O)R⁷, y -NR⁶R⁶; y en donde dichos grupos R¹ -NHSO₂R⁵, ftalimido-C₁₋₄ alquilsulfonilamino, benzamido, bencensulfonilamino, 3-fenilureido, 2-oxopirrolidin-1-ilo, 2,5-dioxopirrolidin-1-ilo, y R¹⁰-alcanoilamino C₂₋₄ que están opcionalmente sustituidos con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alquilo C₁₋₄, ciano, metansulfonilo y alcoxi C₁₋₄; o dos grupos R¹ se toman juntos con los carbonos a los que están unidos para formar un anillo de 5-8 miembros que incluye 1 ó 2 heteroátomos seleccionados de O, S y N; R² es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alcoxi C₁₋₄, -NR⁶R⁶, y -SO₂R⁵; n es 1 ó 2 y cada R³ se selecciona de modo independiente de hidrógeno, halo, hidroxilo, alquilo C₁₋₆, -NR⁶R⁶ y alcoxi C₁₋₄, en donde los residuos alquilo de dichos grupos R³ están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de modo independiente de halo, alcoxi C₁₋₄, -NR⁶R⁶, y -SO₂R⁵; y R⁴ es azido o -(etinil)-R¹¹ en donde R¹¹ es hidrógeno o alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con hidroxilo, -OR⁶, o -NR⁶R⁶.

Reivindicación 10: El uso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde el antagonista de EGFR de fórmula (1) es N-(3-etinilfenil)-6,7-bis(2-metoxietoxi)-4-quinazolinamina.

Reivindicación 11: El uso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde el antagonista de EGFR N-(3-etinilfenil)-6,7-bis(2-metoxietoxi)-4-quinazolinamina está en forma de sal HCl.

Reivindicación 13: El uso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde el antagonista de EGFR es 4-(3'-cloro-4'-fluoroanilino)-7-metoxi-6-(3-morfolinopropoxi)quinazolina.

Reivindicación 14: El uso de acuerdo con la reivindicación 6, en donde el antagonista de EGFR es N-[3-cloro-4-[(3-fluorofenil)metoxi]fenil]-6-[5-[[[2-metil-

sulfonil)etilamino]metil]-2-furanil]-4-quinazolinamina.

Reivindicación 15: El uso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde el antagonista de EGFR es 4-(4-bromo-2-fluoroanilino)-6-metoxi-7-(1-metilpiperidin-4-ilmetoxi)quinazolina.

Reivindicación 16: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 15, en donde el cáncer se selecciona del grupo que consiste en cáncer pulmonar de células no pequeñas, cáncer de células renales, cáncer pancreático, carcinoma gástrico, cáncer de vejiga, cáncer esofágico, mesotelioma, melanoma, cáncer de mamas, cáncer tiroideo, cáncer colorrectal, cáncer de cabeza y cuellos, osteosarcoma, cáncer prostático, o glioblastoma.

Reivindicación 19: El uso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 18, que además comprende administrar un tercer agente terapéutico al sujeto.

Reivindicación 21: El uso de acuerdo con la reivindicación 20, en donde el tercer agente terapéutico es un antagonista de VEGF.

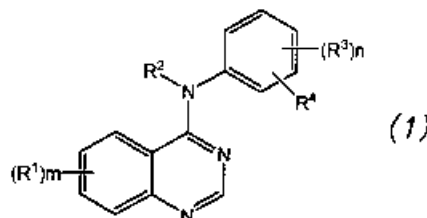
(71) GENENTECH, INC.

1 DNA WAY, SOUTH SAN FRANCISCO, CALIFORNIA 94080-4990, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073854 A1

(21) P090103940

(22) 14/10/09

(30) GB 0818763.5 14/10/08

GB 0903378.8 27/02/09

(51) D01D 5/00, D01F 2/24, 8/02, C08J 5/18

(54) PROCESO PARA LA MANUFACTURA DE FIBRAS A BASE DE CELULOSA Y LAS FIBRAS OBTENIDAS DE ESE MODO

(57) Un método para el hilado de una fibra que comprende nanofibrillas de celulosa estando alineadas a lo largo del eje principal de la fibra a partir de una suspensión liotrópica de nanofibrillas de celulosa, lográndose dicha alineación de nanofibrillas a través de la extensión de la fibra extruida desde una matriz, hilera o aguja, donde dicha fibra es secada bajo extensión y las nanofibrillas alineadas se agregan para formar una estructura continua. Las fibrillas utilizadas en este método pueden ser extraídas de un material rico en celulosa tal como

la madera. La solicitud también se refiere a una fibra a base de celulosa obtenida de acuerdo con este método y se refiere a una fibra celulósica la cual contiene por lo menos 90% en peso de celulosa cristalizada.

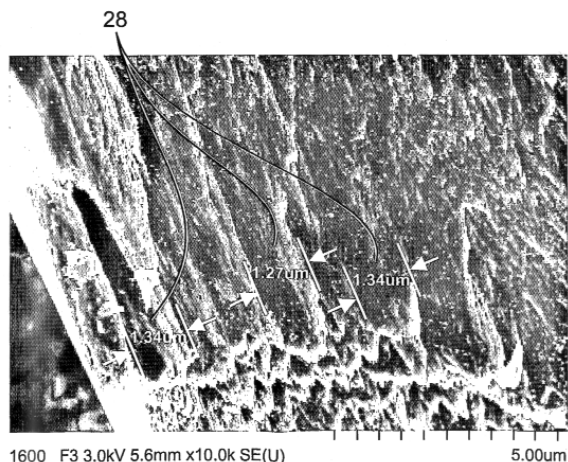
(71) THE COURT OF EDINBURGH NAPIER UNIVERSITY

MERCHISTON TOWER, COLINTON ROAD, EDINBURGH EH10 5DT, GB

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073855 A1

(21) P090103941

(22) 14/10/09

(30) US 61/105316 14/10/08

(51) C12N 15/52, A01H 5/00, 5/10, C12Q 1/25, A23J 1/00, C11B 1/04

(54) UTILIZACION DE DESATURASAS DE ACIDOS GRASOS DE HEMISELMIS SPP.

(57) Métodos y composiciones que se relacionan con enzimas desaturasas que modulan la cantidad y ubicación de enlaces dobles en ácidos grasos poliinsaturados de cadena larga (AGPI-CL). En particular métodos y composiciones para mejorar los perfiles de ácidos grasos omega-3 en productos y partes de plantas utilizando enzimas desaturasas exógenas y ácidos nucleicos que codifican dichas enzimas. En realizaciones particulares, las enzimas desaturasas exógenas utilizadas son $\Delta 5$ desaturasas de *Hemiselmis* spp.. También se proporcionan composiciones de aceite de soja mejoradas que tienen EPA derivado de plantas que portan los genes de interés.

(71) MONSANTO TECHNOLOGY, LLC

800 NORTH LINDBERGH BOULEVARD, ST. LOUIS, MISSOURI 63167, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073856 A2

(21) P090103942

(22) 14/10/09

(30) US 60/315281 27/08/01

(51) C12N 15/56, 9/26

(54) POLINUCLEOTIDO QUE CODIFICA UN POLIPEPTIDO CON ACTIVIDAD DE α -AMILASA Y CASETE DE EXPRESION QUE LO COMPRENDE

(57) Polinucleótido que comprende: a) la secuencia establecida en SEQ ID N° 2, o b) un polinucleótido que tiene al menos 99% de identidad de secuencias respecto de la secuencia de polinucleótido establecida en SEQ ID N° 2, donde el polinucleótido codifica un polipéptido con actividad de α -amilasa. Casete de expresión que lo comprende ligado operativamente a un promotor y a una secuencia de señal donde la secuencia de señal dirige la α -amilasa a un compartimiento específico que permite que la α -amilasa se localice de una manera que no entrará en contacto con su sustrato.

(62) AR036370A1

(71) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058 BASILEA, CH

(74) 1262

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073857 A2

(21) P090103943

(22) 14/10/09

(30) US 60/530478 16/12/03

US 60/591975 29/07/04

(51) C12N 15/29, 5/14, 15/82, A01H 5/00, 5/10, 1/00

(54) METODO PARA SUPRIMIR UN FENOTIPO EN LA PROGENIE DE UN PAR DE PLANTAS PROGENITORAS, PAR DE PLANTAS DE CRUZAMIENTO, CELULAS Y SEMILLAS O PROGENIE RELACIONADAS

(57) Método para suprimir un fenotipo en la progenie de un par de plantas progenitoras, donde: (a) dicho fenotipo se expresa en cada una de dichas plantas progenitoras, (b) el genoma de cada planta progenitora se manipula con el fin de inactivar el gen que afecta el fenotipo de interés; y (c) el gen inactivado en el primer progenitor codifica un producto génico diferente de aquél del gen inactivado en el segundo progenitor. Se obtiene un par de plantas de cruzamiento que presentan un fenotipo común y una planta transgénica. Método para generar plantas que carecen de un fenotipo particular, a partir de progenitores que presentan dicho fenotipo. Método para producir semillas de una planta híbrida. Método para identificar la función del producto un gen de interés expresado en una célula. Método

para propagar una planta de mantenimiento. Elemento regulador para la expresión preferencial de un polinucleótido unido operativamente a polen en desarrollo. Método para evitar la transmisión de un transgen de interés a las gametas de un organismo transgénico.

(62) AR047149A1

(71) PIONEER HI-BRED INTERNATIONAL, INC.

7100 N.W. 62ND AVENUE, P.O. BOX 1014, JOHNSTON, IOWA 50131-1014, US

(74) 1262

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073858 A1

(21) P090103944

(22) 14/10/09

(30) DE 10 2008 052 057.8 16/10/08

(51) C08C 19/20, 19/44, C08L 19/00, B60C 1/00

(54) CAUCHOS DIENICOS FUNCIONALIZADOS

(57) La presente solicitud se refiere a cauchos diénicos funcionalizados y a su fabricación, a mezclas de caucho que contienen estos cauchos diénicos funcionalizados, así como a su uso para la fabricación de vulcanizados de caucho que sirven particularmente para la fabricación de cuerpos de moldeo de caucho muy reforzados. Se prefiere especialmente el empleo en la fabricación de neumáticos que presentan una resistencia a la rodadura especialmente baja, una resistencia al deslizamiento en húmedo especialmente alta y resistencia a la abrasión.

(71) LANXESS DEUTSCHLAND GMBH

D-51369 LEVERKUSEN, DE

(74) 1197

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073859 A1

(21) P090103945

(22) 14/10/09

(30) PCT/IB2008/002718 14/10/08

(51) G08B 13/24

(54) PROCEDIMIENTO Y SISTEMA PARA LA IDENTIFICACION DE ARTICULOS

(57) El procedimiento y el correspondiente sistema divulgados para la identificación de un artículo en una línea de producción de acuerdo con la solicitud se basa en histogramas de color establecidos a partir de una imagen digital del artículo, que se comparan, basándose en campo por campo, con números mínimo y máximo de píxeles por campo permitidos para la identificación con un artículo de referencia.

(71) SICPA HOLDING S.A.

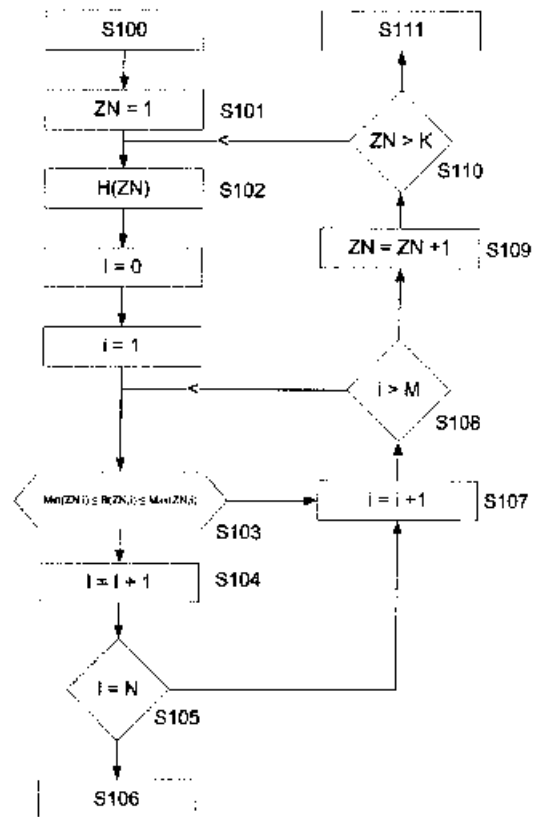
AVENUE DE FLORISSANT 41, CH-1008 PRILLY, CH

(72) SANNIER, GAËL

(74) 1056

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073860 A1

(21) P090103947

(22) 14/10/09

(30) US 61/107236 21/10/08

(51) A23G 9/02

(54) PROCEDIMIENTO PARA ELABORAR UNA BEBIDA CONGELADA A PARTIR DE UNA CONFITURA CONGELADA CON AUMENTO DEL AREA DE SUPERFICIE Y HUECOS

(57) Un método para elaborar una bebida congelada al disponer una confitura congelada en un recipiente teniendo la confitura congelada una forma tridimensional con una relación de área de superficie a volumen mayor que el mismo volumen de confitura congelada que adopta la forma del recipiente y estando dispuesta en el recipiente para proveer uno o más espacios o cavidades abiertas incluyendo al menos uno que se extiende a través o alrededor de la confitura congelada hasta el fondo del recipiente. Los espacios o cavidades abiertas permiten que el líquido penetre y se introduzca en la confitura congelada para facilitar el mezclado del líquido y la confitura congelada para formar la bebida congelada cuando se desea.

(71) NESTEC S.A.

AVENUE NESTLE 55, CH-1800 VEVEY, CH

(74) 194

(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073861 A1
(21) P090103948
(22) 14/10/09
(30) FR 08 56965 14/10/08
FR 08 56966 14/10/08
(51) C08L 27/06, 33/08
(54) COMPOSICION A BASE DE POLIMERO DE HALURO DE VINILO
(57) Composición que comprende por lo menos un polímero de haluro de vinilo y entre 0,1 y 5% en peso, con relación al peso del polímero de haluro de vinilo, de por lo menos un polímero de por lo menos un éster acrílico que se obtiene por polimerización en solución en un medio líquido que comprende por lo menos un agente de transferencia de cadenas que se selecciona entre los hidrocarburos C₃ - C₂₀ que contienen por lo menos una función alcohol secundario. Proceso para su fabricación, artículo que se obtiene comenzando a partir de esta composición y uso de esta composición para fabricar hojas y películas por calandrado o para fabricar perfiles por extrusión. Proceso para la fabricación de un polímero de por lo menos un éster acrílico que se puede utilizar en la composición.
(71) SOLVAY (SOCIETE ANONYME)
33, RUE DU PRINCE ALBERT, B-1050 BRUXELLES, BE
(72) BODART, VINCENT - BLOYAERT, CLAUDINE - DOMPAS, DIRK
(74) 1102
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073862 A1
(21) P090103949
(22) 14/10/09
(30) US 61/105189 14/10/08
(51) C07D 471/22, 498/22, 513/22, A61K 31/535, A61P 31/04
(54) COMPUESTOS HETEROCICLICOS ESPIROFUSIONADOS PARA EL TRATAMIENTO DE INFECCIONES BACTERIANAS
(57) Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque responde a la fórmula (1), o una sal aceptable farmacéuticamente del mismo, donde: el Anillo A es anillo heterocíclico no aromático de 5 a 7 miembros fusionado, donde dicho anillo heterocíclico no aromático de 5 a 7 miembros fusionado se sustituye opcionalmente sobre carbono con uno o más R⁴, y donde cualquier porción -NH- de dicho anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros se sustituye opcionalmente con R⁴; W se selecciona entre -O-, -NH-, -S-, y -S(O)₂-; X se selecciona entre N y C-R²; Y se selecciona entre N y C-R³; R¹ se selecciona entre H, halo, -CN, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, -OR^{1a}, -SR^{1a},

-N(R^{1a})₂, -N(R^{1a})C(O)R^{1b}, -N(R^{1a})N(R^{1a})₂, -NO₂, -N(R^{1a})OR^{1a}, -ON(R^{1a})₂, -C(O)H, -C(O)R^{1b}, -C(O)₂R^{1a}, -C(O)N(R^{1a})₂, -C(O)N(R^{1a})(OR^{1a}), -OC(O)N(R^{1a})₂, -N(R^{1a})C(O)₂R^{1a}, -N(R^{1a})C(O)N(R^{1a})₂, -OC(O)R^{1b}, -S(O)R^{1b}, -S(O)₂R^{1b}, S(O)₂N(R^{1a})₂, -N(R^{1a})S(O)₂R^{1b}, -C(R^{1a})=N(R^{1a}), y -C(R^{1a})=N(OR^{1a}), donde dichos alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, se sustituyen opcionalmente sobre carbono con uno o más R¹⁰, y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R¹⁰; R^{1a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H, alquilo C₁₋₆, carbociclilo, y heterociclilo, donde dichos alquilo C₁₋₆, carbociclilo, y heterociclilo en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R¹⁰, y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R¹⁰; R^{1b} en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, donde dichos alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R¹⁰, y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R¹⁰; R² se selecciona entre H, halo, y -CN; R³ se selecciona entre H, halo, -CN, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, -OR^{3a}, -SR^{3a} y -N(R^{3a})₂, donde dichos alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, y alquinilo C₂₋₆, se sustituyen opcionalmente sobre carbono con uno o más R³⁰; R^{3a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H y alquilo C₁₋₆, donde dicho alquilo C₁₋₆ en cada caso se sustituye opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R³⁰; R⁴ en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, -OR^{4a}, -SR^{4a}, -N(R^{4a})₂, -N(R^{4a})C(O)R^{4b}, -N(R^{4a})N(R^{4a})₂, -NO₂, -N(R^{4a})-OR^{4a}, -O-N(R^{4a})₂, -C(O)H, -C(O)R^{4b}, -C(O)₂R^{4a}, -C(O)N(R^{4a})₂, -C(O)N(R^{4a})(OR^{4a}), -OC(O)N(R^{4a})₂, -N(R^{4a})C(O)₂R^{4a}, -N(R^{4a})C(O)N(R^{4a})₂, -OC(O)R^{4b}, -S(O)R^{4b}, -S(O)₂R^{4b}, S(O)₂N(R^{4a})₂, -N(R^{4a})S(O)₂R^{4b}, -C(R^{4a})=N(R^{4a}), y -C(R^{4a})=N(OR^{4a}), donde dichos alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, carbociclilo, heterociclilo, se sustituyen opcionalmente sobre carbono con uno o más R⁴⁰, y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R⁴⁰; R⁴ en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C₁₋₆, carbociclilo, heterociclilo, -C(O)H, -C(O)R^{4b}, -C(O)₂R^{4a}, -C(O)N(R^{4a})₂, -S(O)R^{4b}, -S(O)₂R^{4b}, -S(O)₂N(R^{4a})₂, -C(R^{4a})=N(R^{4a}), y -C(R^{4a})=N(OR^{4a}), donde dichos alquilo C₁₋₆, carbociclilo, y heterociclilo, en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R⁴⁰, y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R⁴⁰; R^{4a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H, alquilo C₁₋₆, carbociclilo, y heterociclilo, donde dichos alquilo C₁₋₆, carbociclilo, y heterociclilo en cada caso se sustituyen opcionalmente en

forma independiente sobre carbono con uno o más R^{40} , y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R^{40} ; R^{4b} en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo, donde dichos alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R^{40} , y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R^{40} ; R^{10} en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, heterociclilo, -OR^{10a}, -SR^{10a}, -N(R^{10a})₂, -N(R^{10a})C(O)R^{10b}, -N(R^{10a})N(R^{10a})₂, -NO₂, -N(R^{10a})OR^{10a}, -O-N(R^{10a})₂, -C(O)H, -C(O)R^{10b}, -C(O)₂R^{10a}, -C(O)N(R^{10a})₂, -C(O)N(R^{10a})(OR^{10a}), -OC(O)N(R^{10a})₂, -N(R^{10a})C(O)₂R^{10a}, -N(R^{10a})C(O)N(R^{10a})₂, -OC(O)R^{10b}, -S(O)R^{10b}, -S(O)₂R^{10b}, S(O)₂N(R^{10a})₂, -N(R^{10a})S(O)₂R^{10b}, -C(R^{10a})=N(R^{10a}), y -C(R^{10a})=N(OR^{10a}), donde dichos alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo, en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R^a , y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R^a ; R^{10a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H, alquilo C_{1-6} , carbociclilo, y heterociclilo, donde dichos alquilo C_{1-6} , carbociclilo, y heterociclilo en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R^a , y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R^a ; R^{10b} en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo, donde dichos alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo en cada caso se sustituyen opcionalmente en forma independiente sobre carbono con uno o más R^a , y donde cualquier porción -NH- de dicho heterociclilo se sustituye opcionalmente con R^a ; R^{30} en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , -OR^{30a}, -SR^{30a}, y -N(R^{30a})₂; R^{30a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H y alquilo C_{1-6} ; R^{40} en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, heterociclilo, -OR^{40a}, -SR^{40a}, -N(R^{40a})₂, -N(R^{40a})C(O)R^{40b}, -N(R^{40a})N(R^{40a})₂, -NO₂, -N(R^{40a})OR^{40a}, -O-N(R^{40a})₂, -C(O)H, -C(O)R^{40b}, -C(O)₂R^{40a}, -C(O)N(R^{40a})₂, -C(O)N(R^{40a})(OR^{40a}), -OC(O)N(R^{40a})₂, -N(R^{40a})C(O)₂R^{40a}, -N(R^{40a})C(O)N(R^{40a})₂, -OC(O)R^{40b},

S(O)R^{40b}, -S(O)₂R^{40b}, S(O)₂N(R^{40a})₂, -N(R^{40a})S(O)₂R^{40b}, -C(R^{40a})=N(R^{40a}), y -C(R^{40a})=N(OR^{40a}), R^{40} en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C_{1-6} , carbociclilo, heterociclilo, -C(O)H, -C(O)R^{40b}, -C(O)₂R^{40a}, -C(O)N(R^{40a})₂, -S(O)R^{40b}, -S(O)₂R^{40b}, -S(O)₂N(R^{40a})₂, -C(R^{40a})=N(R^{40a}), y -C(R^{40a})=N(OR^{40a}); R^{40a} en cada caso se selecciona en forma independiente entre H, alquilo C_{1-6} , carbociclilo, y heterociclilo; R^{40b} en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo; R^a en cada caso se selecciona en forma independiente entre halo, -CN, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, heterociclilo, -OR^m, -SR^m, -N(R^m)₂, -N(R^m)C(O)Rⁿ, -N(R^m)N(R^m)₂, -NO₂, -N(R^m)OR^m, -O-N(R^m)₂, -C(O)H, -C(O)Rⁿ, -C(O)₂R^m, -C(O)N(R^m)₂, -C(O)N(R^m)(OR^m), -OC(O)N(R^m)₂, -N(R^m)C(O)₂R^m, -N(R^m)C(O)N(R^m)₂, -OC(O)Rⁿ, -S(O)Rⁿ, -S(O)₂Rⁿ, S(O)₂N(R^m)₂, -N(R^m)S(O)₂Rⁿ, -C(R^m)=N(R^m), y -C(R^m)=N(OR^m), R^a en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C_{1-6} , carbociclilo, heterociclilo, -C(O)H, -C(O)Rⁿ, -C(O)₂R^m, -C(O)N(R^m)₂, -S(O)Rⁿ, -S(O)₂Rⁿ, -S(O)₂N(R^m)₂, -C(R^m)=N(R^m), y -C(R^m)=N(OR^m); R^m en cada caso se selecciona en forma independiente entre H, alquilo C_{1-6} , carbociclilo, y heterociclilo; y R^n en cada caso se selecciona en forma independiente entre alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , carbociclilo, y heterociclilo.

(71) ASTRAZENECA AB

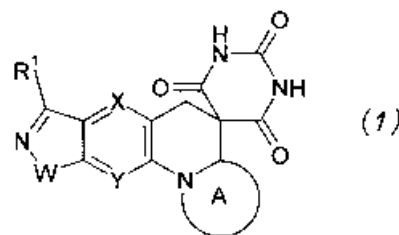
S-151 85 SÖDERTÄLJE, SE

(72) BARVIAN, KEVIN - BASARAB, GREGORY STEVEN - ZHOU, FEI - GOWRAVARAM, MADHUSUDHAN READY - HAUCK, SHEILA IRENE

(74) 108

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073863 A1

(21) P090103952

(22) 14/10/09

(30) GB 0818758.5 14/10/08

(51) H01M 10/0525

(54) UN METODO PARA PRODUCIR UN SULFURO DE METAL DE TRANSICION CON CONTENIDO DE LITIO, EL USO DE DICHO SULFURO DE METAL DE TRANSICION FORMADO POR DICHO METODO, UN ELECTRODO OBTENIDO MEDIANTE DICHO USO Y UNA BATERIA DE ION DE LITIO QUE COMPRENDE DICHO ELECTRODO

(57) La presente solicitud provee un proceso conveniente para realizar un sulfuro de metal de transición con contenido de litio involucrando calentar al menos un sulfuro de metal de transición con un compuesto con contenido de litio, en donde al compuesto con contenido de litio es seleccionado de uno o más óxido de litio, sulfato de litio, carbonato de litio, hidróxido de litio anhidro, monohidrato de hidróxido de litio, oxalato de litio, nitrato de litio y cualquier material que es un precursor para cualquiera de estos compuestos con contenido de litio.

(71) ITI SCOTLAND LIMITED

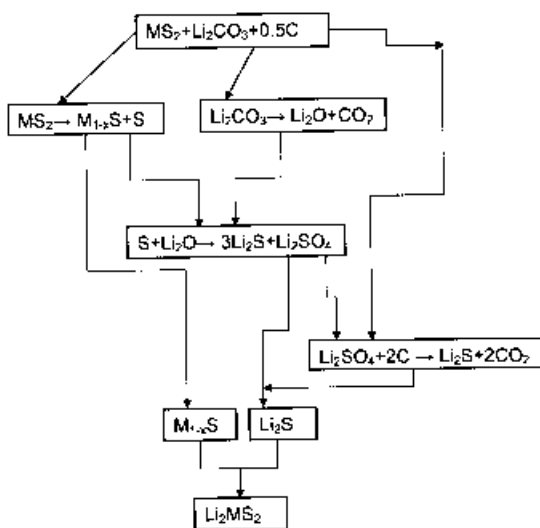
191 WEST GEORGE ST., GLASGOW, STRATHCLYDE G2 2LB, GB

(72) BARKER, JEREMY - KENDRICK, EMMA

(74) 107

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073864 A1

(21) P090103953

(22) 14/10/09

(30) GB 0818758.5 14/10/08

(51) H01M 10/0525

(54) UNA COMPOSICION QUE COMPRENDE AL MENOS UN SULFURO DE METAL DE TRANSICION CON CONTENIDO DE LITIO Y CARBONO, SU USO, UN ELECTRODO HECHO MEDIANTE DICHO USO Y UNA BATERIA DE ION DE LITIO QUE COMPRENDE DICHA COMPOSICION

(57) La presente solicitud provee composiciones que comprenden al menos un sulfuro de metal de transición con contenido de litio y carbono, en donde partículas de carbono están dispersadas al nivel microscópico en partículas individuales de sulfuro de metal de transición con contenido de litio.

(71) ITI SCOTLAND LIMITED

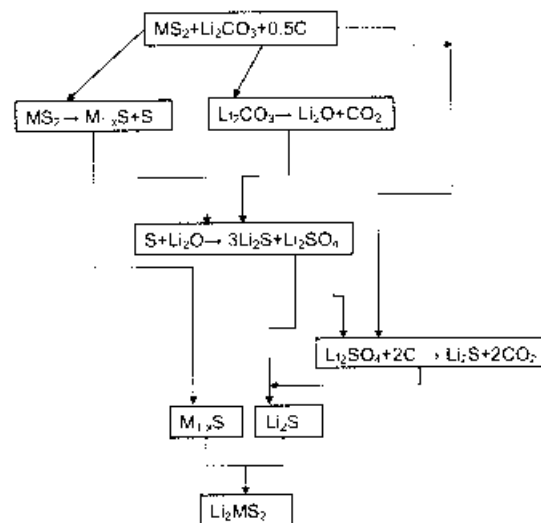
191 WEST GEORGE ST., GLASGOW, STRATHCLYDE G2 2LB, GB

(72) BARKER, JEREMY - KENDRICK, EMMA

(74) 107

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073865 A1

(21) P090103954

(22) 14/10/09

(30) GB 0818758.5 14/10/08

(51) H01M 10/0525

(54) UN METODO PARA PRODUCIR SULFURO DE LITIO

(57) Reivindicación 1: Un método para producir sulfuro de litio caracterizado porque comprende el paso de calentar juntos uno o más componentes que contienen litio y sulfuro, en donde el paso de calentar es realizado en una temperatura de 600 a 1500°C, y donde además los compuestos que contienen litio son seleccionados de uno o más óxido de litio, carbonato de litio, hidróxido de litio anhidro, monohidrato de hidróxido de litio, oxalato de litio, nitrato de litio, y cualquier otro material que sea precursor para cualquiera de estos compuestos que contienen litio durante el paso de calentamiento.

(71) ITI SCOTLAND LIMITED

191 WEST GEORGE ST., GLASGOW, STRATHCLYDE G2 2LB, GB

(72) BARKER, JEREMY - KENDRICK, EMMA

(74) 107

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073866 A1

(21) P090103955

(22) 14/10/09

(30) GB 0818758.5 14/10/08

GB 0906601.0 17/04/09

(51) H01M 10/0525, 4/136

(54) UN METODO PARA PRODUCIR UN SULFURO DE METAL DE TRANSICION CON CONTENIDO

DE LITIO, SU USO, UN ELECTRODO HECHO MEDIANTE DICHO USO Y UNA BATERIA DE ION DE LITIO PRODUCIDA MEDIANTE DICHO METODO

(57) La presente solicitud provee un proceso conveniente para realizar un sulfuro de metal de transición con contenido de litio involucrando calentar al menos un sulfuro de metal de transición con sulfato de litio o cualquier material que sea un precursor para sulfato de litio, bajo condiciones de reacción de reducción, en donde el estado de oxidación del metal de transición no es reducido durante el proceso de reacción.

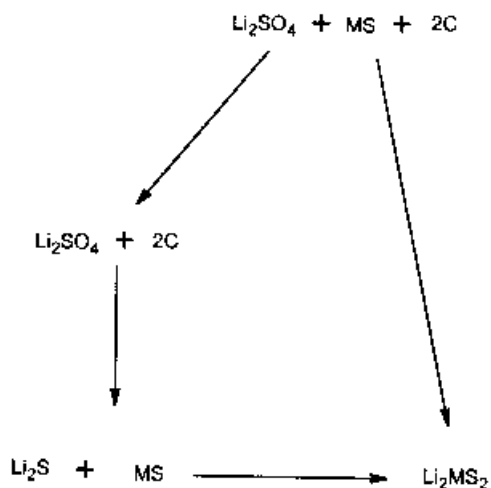
(71) ITI SCOTLAND LIMITED
191 WEST GEORGE ST., GLASGOW, STRATHCLYDE G2 2LB, GB

(72) BARKER, JEREMY - KENDRICK, EMMA

(74) 107

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073867 A1

(21) P090103956

(22) 15/10/09

(51) E04C 1/00, E04G 11/46

(54) BLOQUE EN MALLA A SER UTILIZADO PREFERENTEMENTE EN LOSAS DE HORMIGON ARMADO

(57) Bloque realizado preferentemente en metal o plástico, cuya finalidad es actuar a modo de encofrado perdido preferentemente en losas de hormigón armado. Para cumplir con dicho propósito, el mismo está compuesto por una estructura reticulada. En la cara superior, la retícula se encarga de proveer sustento a una malla para contener al hormigón que se vuelque por encima. En la cara inferior, la estructura sirve de sustento a otra malla que actúa como anclaje del revoque de cielorraso que se aplica a modo de castigado. El dispositivo cuenta con bajo peso y está compuesto por una sola pieza de tal manera que sea más fácil su manipulación. Se utiliza preferentemente tanto en

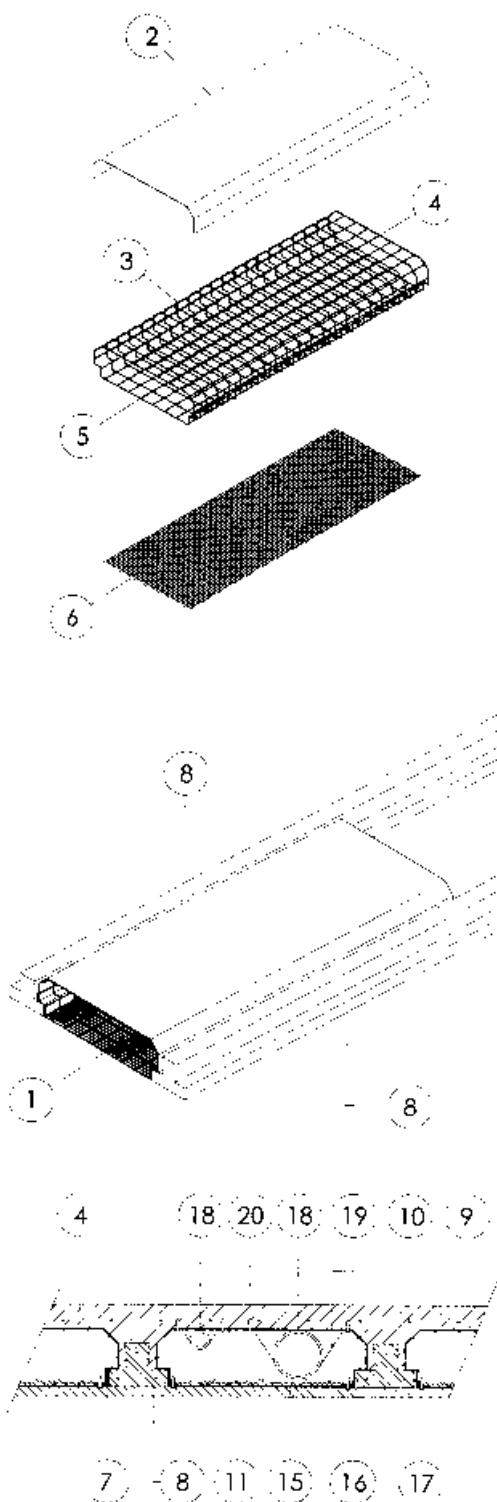
losas de viguetas como en losas armadas en una o dos direcciones. Por ejemplo, en losas de viguetas el bloque se lo utiliza en grupo y uno tras otro, en el espacio comprendido entre viguetas.

(71) GIGENA, CESAR GABRIEL
TALCAHUANO 870, Bº 25 DE MAYO, (4400) SALTA, PROV. DE SALTA, AR

(72) GIGENA, CESAR GABRIEL

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



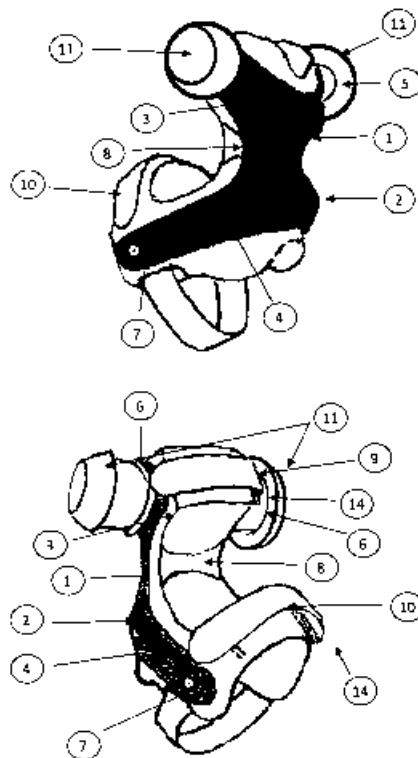
- (10) AR073868 A1
 (21) P090103959
 (22) 15/10/09
 (30) EP 08166751.1 16/10/08
 (51) A61K 7/075
 (54) COMPOSICION DE CHAMPU ACONDICIONADOR
 (57) Champú acondicionador acuoso que comprende tensioactivo de limpieza y una red de gel acondicionador, la red de gel acondicionador comprende partículas, donde entre el 40 y el 100% en volumen de las partículas en la red de gel tiene un diámetro comprendido entre 10 nm y 1 µm. Champú acondicionador acuoso que comprende tensioactivo de limpieza y una fase de gel acondicionador estructurada, la fase de gel estructurada comprende partículas, donde entre el 40 y el 100% en volumen de las partículas en la red de gel tiene un diámetro comprendido entre 10 nm y 1 µm.
 (71) UNILEVER N.V.
 WEENA 455, 3013 AL ROTTERDAM, NL
 (72) CHUCHOTIROS, APIRUDEE - GILES, COLIN CHRISTOPHER DAVID
 (74) 108
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073869 A1
 (21) P090103961
 (22) 15/10/09
 (30) IN 2233/2008 17/10/08
 (51) B01D 24/10
 (54) FILTRO DE BLOQUE DE CARBON
 (57) La presente solicitud se refiere a un proceso para elaborar filtros de bloque de carbón químicamente combinados con impregnación metálica. En particular, la presente solicitud se refiere a un proceso para preparar un filtro de bloque de carbón moldeado impregnado con un metal seleccionado entre plata, cobre y cinc, con un nivel de variación relativamente bajo en cuanto al contenido metálico entre los bloques, una desviación relativamente inferior con respecto al contenido metálico teórico y en el cual el grado de lixiviación del metal del bloque durante el uso, resulta relativamente bajo.
 (71) UNILEVER N.V.
 WEENA 455, 3013 AL ROTTERDAM, NL
 (72) DAVE, PARTHIV RIPUDAMAN - MUKHERJEE, DEBASIS - SRIVASTAVA, MADALASA
 (74) 108
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073870 A1
 (21) P090103962
 (22) 15/10/09
 (51) A63B 71/08, 71/12, A41D 13/06
 (54) DISPOSITIVO APLICADO AL TALON, APTO PARA

REALIZAR EJERCICIOS FISICOS

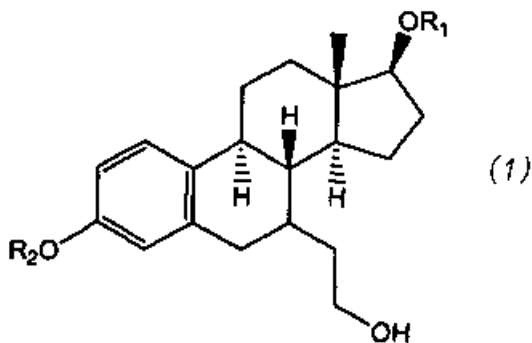
- (57) El dispositivo aplicado al talón, apto para realizar ejercicios físicos (denominado Talonera Lastrada), está caracterizado por una estructura rígida, un acolchado y dos topes. La estructura rígida presenta una forma ergonómica a la parte posterior del pie calzado y del tobillo, la cual utiliza al talón como principal punto de apoyo de la sobrecarga. El peso se vincula a través de los dos ejes de carga, ubicados por encima de los maléolos tibiales; el acolchado presenta dos correas (una superior y otra inferior) que permiten sujetar la talonera al pie. La correa superior sujeta a la parte baja de la pierna y la correa inferior, rodea el pie (desde la planta hasta el empeine) inmovilizando al tobillo, fijando firmemente la sobrecarga y permitir el apoyo plantar; el tope sujeta la sobrecarga a la estructura rígida por medio de un perno roscado.
 (71) LAVORATO, MIGUEL ANGEL
 SILVIO RUGGIERI 2944, PISO 4º DTO. "B" - TORRE NAVONA, CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
 (72) LAVORATO, MIGUEL ANGEL
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073871 A1
 (21) P090103963
 (22) 15/10/09
 (30) US 61/105626 15/10/08
 (51) C07J 1/00, 31/00
 (54) INTERMEDIARIO DE FULVESTRAN
 (57) Se relaciona con un compuesto de la fórmula (1) en donde R¹ representa H o un grupo acetilo y R² representa un grupo metilo, acetilo o bencilo; con su

preparación y con su uso en la preparación de fulvestrant.

- (71) SYNTHON B.V.
MICROWEG 22, 6545 CM NIJMEGEN, NL
(72) ETTEMA, GERRIT JAN BOUKE - GIELING,
REINERUS GERARDUS
(74) 144
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073872 A1
(21) P090103965
(22) 15/10/09
(30) DE 10 2008 051 834.4 17/10/08
DE 10 2008 053 048.4 24/10/08
DE 10 2009 038 210.0 20/08/09
(51) A61K 38/16, 38/28, A61P 3/10
(54) COMBINACION DE UNA INSULINA Y UN AGONISTA DE GLP-1, METODO PARA TRATAR UN PACIENTE, DISPOSITIVO Y KIT
(57) Reivindicación 1: Un medicamento que comprende al menos una insulina y al menos un agonista de GLP-1, en donde el medicamento se formula y/o se prepara de manera tal que comprende la insulina y el agonista de GLP-1, cada uno en una cantidad predeterminada y se puede administrar en una dosis adaptada al requerimiento individual de un paciente.
Reivindicación 14: Un medicamento reivindicado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde la al menos una insulina es independientemente seleccionada de insulinas humanas, sus análogos, derivados, y metabolitos.
Reivindicación 15: Un medicamento reivindicado de acuerdo con la reivindicación 14, en donde la al menos una insulina es independientemente seleccionada del grupo que consiste de Gly(A21)-Arg(B31)-Arg(B32) insulina humana, Lys^{B28}Pro^{B29} insulina humana, B28 Asp insulina humana, y B29Lys(ε-tetradecanoil), desB30 insulina humana.
Reivindicación 16: Un medicamento reivindicado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el al menos un agonista de GLP-1 es independientemente seleccionado del grupo que consiste de GLP-1, sus análogos y derivados, exendina-3, sus análogos y derivados

exendina-4, sus análogos y derivados, y sus sales farmacológicamente tolerables.

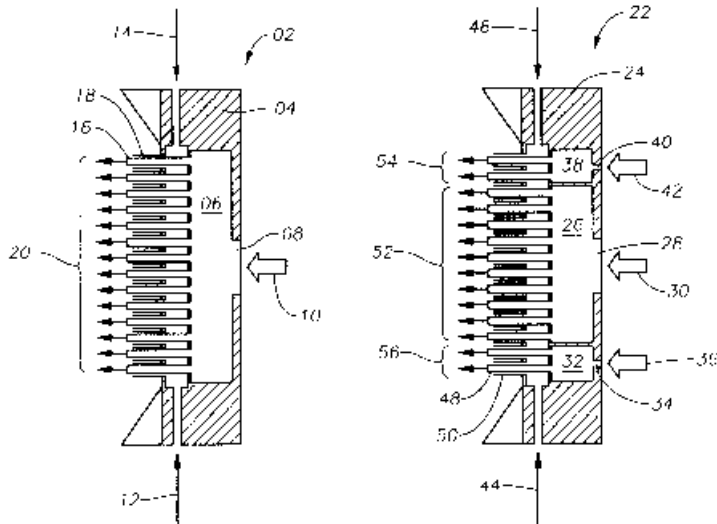
Reivindicación 17: Un medicamento reivindicado de acuerdo con la reivindicación 16, en donde el al menos un agonista de GLP-1 es independientemente seleccionado del grupo que consiste de exendina-4, desPro³⁶exendina-4(1-39)-Lys₆-NH₂ [AVE0010], y Arg³⁴,Lys²⁶(N^ε(γ-glutamil(N^α-hexadecanoil)))GLP-1(7-37) [liraglutida], y sus sales farmacológicamente tolerables.

Reivindicación 23: El uso de al menos una insulina y al menos un agonista de GLP-1 para preparar un producto medicinal para tratar un paciente con diabetes, más particularmente diabetes tipo 1 ó 2, para ajustar la concentración de glucosa sanguínea en ayunas, posprandial y/o posabsortiva, para mejorar la tolerancia a la glucosa, para prevenir la hipoglucemia, para prevenir la pérdida de función de las células β pancreáticas, para la pérdida de peso y/o para prevenir el aumento de peso.

- (71) SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH
BRÜNINGSTRASSE 50, D-65929 FRANKFURT, DE
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

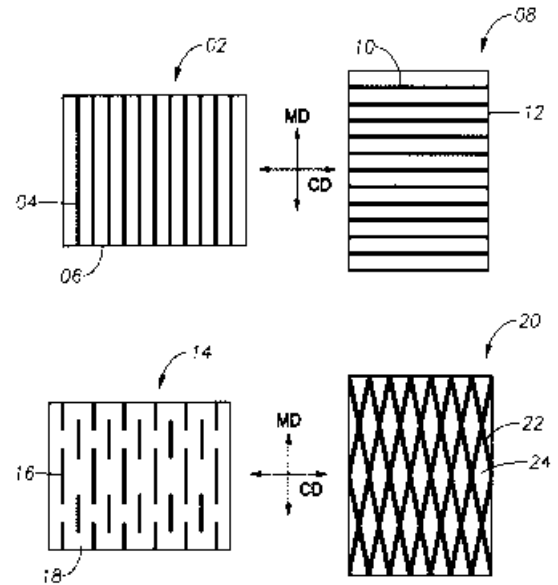
- (10) AR073873 A1
(21) P090103966
(22) 15/10/09
(30) US 61/156078 27/02/09
US 61/171135 21/04/09
(51) B32B 5/26, 7/02, 25/10, 27/32
(54) MATERIALES LAMINADOS IN SITU DE MULTIPLES CAPAS NO TRAMADOS Y METODO PARA SU PRODUCCION
(57) Se describe en la presente solicitud un material laminado hilado en fusión que comprende dos o más capas de géneros hilados en fusión, donde las capas adyacentes entre sí son enredadas in situ entre sí a fin de definir una región interfacial de fibras mixtas entre las capas. Se describe además en esta solicitud un método para la elaboración de un material laminado in situ hilado en fusión, que comprende el hilado en fusión simultáneo de dos o más fusiones poliméricas adyacentes entre sí, a fin de formar géneros adyacentes, donde las capas adyacentes entre sí son enredadas in situ entre sí a fin de formar una región interfacial de fibras mixtas entre las capas. Asimismo, se describe en esta solicitud un aparato de hilado en fusión que comprende una o más matrices, donde cada matriz comprende dos o más zonas de hilado en fusión, donde cada zona comprende una pluralidad de boquillas que están fluidamente conectadas a la zona correspondiente, y donde cada zona está fluidamente conectada a una extrusora de fusión.
(71) EXXONMOBIL CHEMICAL PATENTS INC.
5200 BAYWAY DRIVE, BAYTOWN, TEXAS 77522, US
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



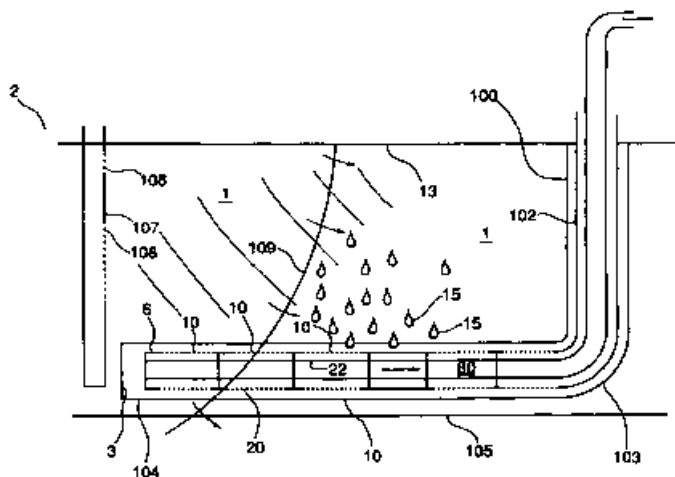
(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



- (10) AR073874 A1
 (21) P090103967
 (22) 15/10/09
 (30) US 61/156078 27/02/09
 US 61/171135 21/04/09
 (51) B32B 5/26, 7/02, 25/10, 27/32
 (54) MATERIALES LAMINADOS NO TRAMADOS BIAXIALMENTE ELASTICOS QUE TIENEN ZONAS INFLEXIBLES
 (57) Se divulga un método para impartir restricción en un material laminado no tramado biaxialmente elástico, y el material laminado restringido en sí mismo, donde el método comprende la provisión de un material laminado no tramado biaxialmente elástico que comprende por lo menos un género elástico hilado en fusión y por lo menos una película o un género extensible; y la fusión de por lo menos, o preferentemente, solo una porción del género o los géneros elásticos hilados en fusión, con por lo menos uno de los géneros extensibles, a fin de crear por lo menos una zona inflexible. Convenientemente, el género o los géneros elásticos hilados en fusión y por lo menos una película o un género extensible son biaxialmente elásticos, y se denominan "no tramados" debido a la capa o las capas de elastómero hilado en fusión. El género elástico hilado en fusión puede comprender un elastómero a base de poliolefina o una combinación de un elastómero con un termoplástico.
 (71) EXXONMOBIL CHEMICAL PATENTS INC.
 5200 BAYWAY DRIVE, BAYTOWN, TEXAS 77522, US
 (74) 195

- (10) AR073875 A1
 (21) P090103968
 (22) 15/10/09
 (30) CA 2641281 17/10/08
 US 12/285980 17/10/08
 (51) E21B 43/00, 43/08
 (54) SEGMENTOS DE REVESTIMIENTO DE POZOS PARA EL MEJORAMIENTO IN SITU Y LA RECUPERACION DE HIDROCARBUROS, Y METODO DE MEJORAMIENTO IN SITU Y RECUPERACION
 (57) Un segmento de revestimiento de pozos para el uso en procesos de recuperación de hidrocarburos. Se proveen un miembro de revestimiento externo elongado, habitualmente cilíndrico, y un miembro de revestimiento interno elongado ubicado en forma concéntrica dentro del miembro de revestimiento externo. Se provee catalizador mejorador de hidrocarburos en el espacio intersticial entre los dos miembros. Los miembros de revestimiento externos pueden estar acoplados entre sí en forma de rosca. Se provee un sello deslizante entre el revestimiento externo y el revestimiento interno, a fin de alojar el crecimiento térmico diferencial entre los dos revestimientos. Se provee además un proceso para el uso de los segmentos de revestimiento de pozos que tienen catalizador mejorador de hidrocarburos previamente allí colocado, al igual que un método para la fabricación de un segmento de revestimiento de pozo.
 (71) ARCHON TECHNOLOGIES LTD.
 1900, 111 - 5TH AVENUE S.W., CALGARY, ALBERTA T2P 3Y6, CA
 (74) 195
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



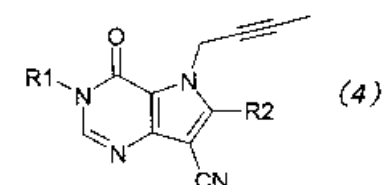
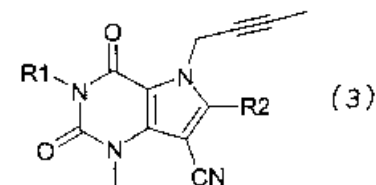
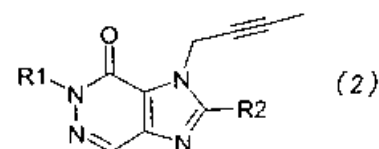
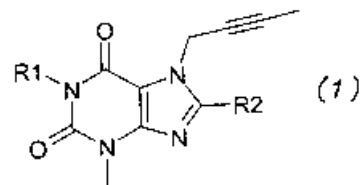
- (10) AR073876 A1
 (21) P090103973
 (22) 15/10/09
 (30) EP 08166829.5 16/10/08
 US 61/105919 16/10/08
 EP 09167304.6 05/08/09
 (51) A61K 31/552, 31/132, 31/145, 31/426, 31/198, 38/00, A61P 3/10
 (54) TRATAMIENTO DE LA DIABETES EN PACIENTES CON CONTROL GLUCEMICO INSUFICIENTE A PESAR DE LA TERAPIA CON UN FARMACO ORAL O NO ORAL ANTIDIABETICO
 (57) Determinados inhibidores de DPP-4 son particularmente adecuados para tratar y/o prevenir enfermedades metabólicas, en particular la diabetes, en pacientes con control glucémico insuficiente a pesar de una terapia con un fármaco antidiabético oral y/o no oral.

Reivindicación 1: Un inhibidor de DPP-4, que es de fórmula (1), (2), (3) ó (4) en las que R¹ indica ([1,5]naftiridin-2-il)metilo, (quinazolin-2-il)metilo, (quinoxalin-6-il)metilo, (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, 2-ciano-bencilo, (3-ciano-quinolin-2-il)metilo, (3-ciano-piridin-2-il)metilo, (4-metil-pirimidin-2-il)metilo o (4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metilo y R² indica 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo, (2-amino-2-metil-propil)-metilamino o (2-(S)-amino-propil)-metilamino, o su sal farmacéuticamente aceptable; caracterizado porque se utiliza para tratar y/o prevenir enfermedades metabólicas en pacientes con control glucémico insuficiente a pesar de la terapia con uno o más fármacos antidiabéticos orales o no orales convencionales seleccionados de metformina, sulfonilureas, tiazolidinodionas, glinidas, bloqueadores de α-glucosidasa, GLP-1 o análogos de GLP-1, e insulina a análogos de insulina.

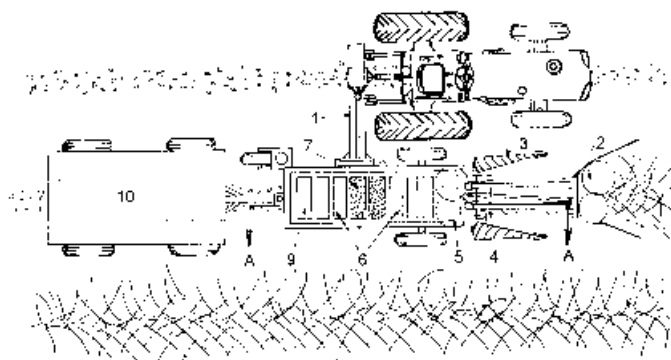
Reivindicación 22: El inhibidor de DPP-4 según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21, caracterizado porque dicho inhibidor de DPP-4 se selecciona del grupo que consiste en: 1-[(4-metilquinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-{3-(R)-aminopiperidin-1-il}xantina, 1-[[[1,5]naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2butin-1-il)-8-((R)-

aminopiperidin-1-il)xantina, 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, 2-((R)3-aminopiperidin-1-il)-3-(but-2-inil)-5-(4-metilquinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidroimidazo[4,5-d]piridazin-4-ona, 1-[(4-metilquinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metilpropil)metilamino]xantina, 1-[(3-cianoquinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, 1-(2-cianobencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, 1-[(4-metilquinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-aminopropil)metilamino]xantina, 1-((3-cianopiridin-2-il)metil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, 1-[(4-metilpirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, 1-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina y 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-aminopiperidin-1-il)xantina, o una de sus sales farmacéuticamente aceptable.

- (71) BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH
 BINGER STRASSE 173, D-55216 INGELHEIM, DE
 (72) GRAEFE-MODY, EVA ULRIKE - KLEIN, THOMAS - MARK, MICHAEL - WOERLE, HANS-JUERGEN
 (74) 194
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073877 A1
 (21) P090103974
 (22) 15/10/09
 (51) A01D 45/10
 (54) MAQUINA COSECHADORA DE CAÑAS DE AZUCAR ENTERAS ACCIONADA MEDIANTE UNA UNIDAD MOTRIZ INDEPENDIENTE
 (57) Una máquina cosechadora de cañas de azúcar enteras accionada mediante una unidad motriz independiente, la cual se acopla en forma lateral y paralela a la unidad motriz o tractor mediante una barra transversal articulada y que comprende un dispositivo despuntador de las cañas y un conjunto orientador de las mismas que las ordena y posiciona para ser cortadas a ras del suelo por un dispositivo cortador de base, el cual entrega las cañas cortadas a un conjunto de rodillos y cepillos rotativos que giran a velocidades tales que las trasladan y le producen el deshojado o deschalado manteniéndolas enteras; los cuales rodillos pueden estar revestidos de caucho u otro material elástico semejante con relieves en su superficie para trasladar más eficientemente las cañas sin dañarlas, y opcionalmente un carro o acoplado que forma un conjunto en tándem enganchado con la cosechadora y que recibe las cañas limpias, las almacena y transporta hasta el lugar de descarga.
- (71) INSTITUTO NACIONAL DE TECNOLOGIA AGROPECUARIA
 RIVADAVIA 1439, (C1033AAE) CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
- (72) ING. AGR. PILATTI, ORLANDO
 (74) 895
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073878 A1
 (21) P090103976
 (22) 15/10/09
 (51) C12N 15/74, 15/54, 9/12, C07K 14/195, A23L 1/305
 (54) VARIANTES DE LA ENZIMA LIPIDO ACILTRANSFERASA DE AEROMONAS SPP., METODO PARA PRODUCIRLAS Y USOS DE LAS MISMAS
 (57) Se provee un método para preparar una variante de una enzima lípido aciltransferasa, que comprende expresar en un organismo huésped una

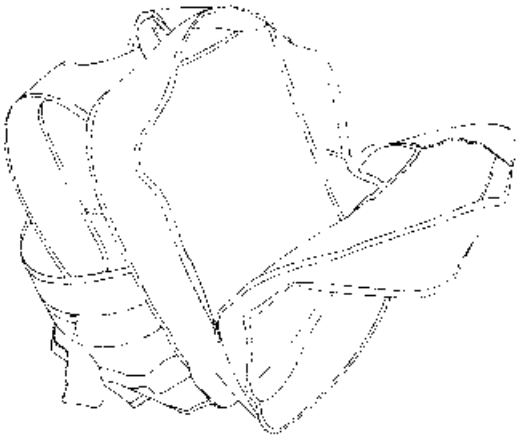
secuencia de nucleótidos que tiene al menos 90% de identidad con una secuencia de nucleótidos que codifica una lípido aciltransferasa progenitora y que comprende al menos una modificación (apropiadamente, al menos dos modificaciones) en una o más posiciones que, en la secuencia de aminoácidos codificada, corresponden a uno o más aminoácidos localizados a) en la región del cañón de la enzima (es decir, preferiblemente los residuos de aminoácidos 31, 27, 85, 86, 119, y 120); y/o b) en el sitio de inserción 1 (es decir, los residuos de aminoácidos 22-36); y/o c) en el sitio de inserción 2 (es decir, los residuos de aminoácidos 74-88), donde la región del cañón, el sitio de inserción 1 y/o el sitio de inserción 2 se definen como las regiones que, cuando se alinean sobre la base de la estructura primaria o terciaria, corresponden a la región del cañón, el sitio de inserción 1 o el sitio de inserción 2 (o a los residuos de aminoácidos correspondiente descritos con anterioridad) de la enzima que se detalla en la presente documentación como SEQ ID. N° 16 ó 6. Las modificaciones preferidas son una o más de las siguientes: L31Q, H, N, T, F Y o C (preferiblemente L31 Q), M27R, G, H, K, Y, D, N, V, C, Q, L, E, S o F (preferiblemente M27V); y, V85H, R, D o E; I86R, Y S, V, I, A, T, M, F, C o L (preferiblemente I86S o A); A119T o I; Y120K o E; W122S, L o A (preferiblemente W122L); E201R; Q245S; F235A o V; W232G o S; y/o A236G o E. Uso de dichas variantes en la preparación de alimentos, de liso-fosfolípidos, liso-glicolípidos y de desgomado enzimático de aceites vegetales o comestibles, entre otros.

- (71) DANISCO A/S
 LANGEBROGADE 1, DK-1001 COPENHAGEN K, DK
- (72) MILLER - THOUHAHL - BRUNSTEDT - SORENSEN - SOE - BOTT - VEDEL - WITTSCHIEBEN - POULSEN - MIKKELSEN - JENSEN - LARSEN - CERVIN - LORENTZEN
- (74) 465
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073879 A4
 (21) M090103977
 (22) 15/10/09
 (30) CO 08-110064 15/10/08
 (51) A41D 13/01, 15/00, A45F 4/02
 (54) SISTEMA DE CHALECO TIPO ARNES FUSIONADO DE MANERA INTEGRAL CON UN COMPARTIMENTO EXPANDIBLE DISPUESTO SOBRE SU PARTE POSTERIOR
 (57) La presente solicitud se relaciona con un sistema que consiste de un chaleco del tipo arnés fusionado de manera integral con un compartimento expandible dispuesto en su parte posterior. De esta manera, el sistema de la presente permite al usuario cargar de manera proporcional cualquier clase de artículos discretos, tales como documentos, prendas, objetos, etc.. El sistema de la pre-

sente además incluye pequeños compartimentos accesorios dispuestos en las tirantas del chaleco para la contención de otros artículos pequeños, tales como llaves, teléfonos celulares, anteojos, entre otros. El sistema de la presente es versátil, sencillo, económico, cómodo para el usuario, fácil de vestir, práctico y seguro con respecto a los sistemas convencionales de éste tipo. Además, en realizaciones preferidas, el sistema de la presente cuenta con bandas reflectivas de seguridad que cumplen con las disposiciones regulatorias en materia de seguridad vial, cuando es usado por conductores de motocicletas o bicicletas.

- (71) TOBON GAVIRIA, ROSAURA
CARRERA 70 # 49-77, BOGOTA D.C., CO
(72) TOBON GAVIRIA, ROSAURA
(74) 754
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

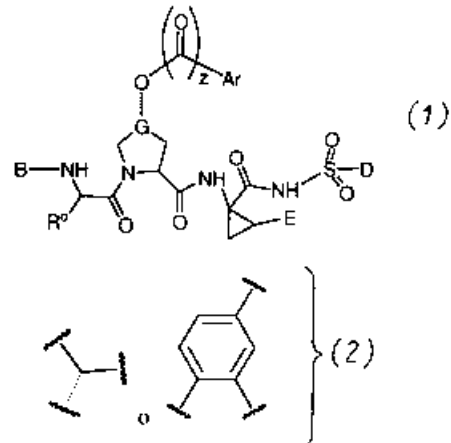


- (10) AR073880 A1
(21) P090103978
(22) 15/10/09
(30) US 61/105746 15/10/08
US 61/236741 25/08/09
(51) C07D 209/44, 215/22, 235/26, 277/66, 277/68,
C07K 5/08, A61P 31/14
(54) UN COMPUESTO HETEROCICLICO, COMPOSICION FARMACEUTICA QUE LO COMPONE Y METODOS PARA INHIBIR LA PROTEASA NS3/NS4 Y PARA INCREMENTAR LA FUNCION HEPATICA CON DICHO COMPUESTO Y METODO PARA TRATAR FIBROSIS HEPATICA CON LOS MISMOS
(57) También se describen métodos terapéuticos, composiciones, medicamentos y formas de dosificación relacionados con los mismos.

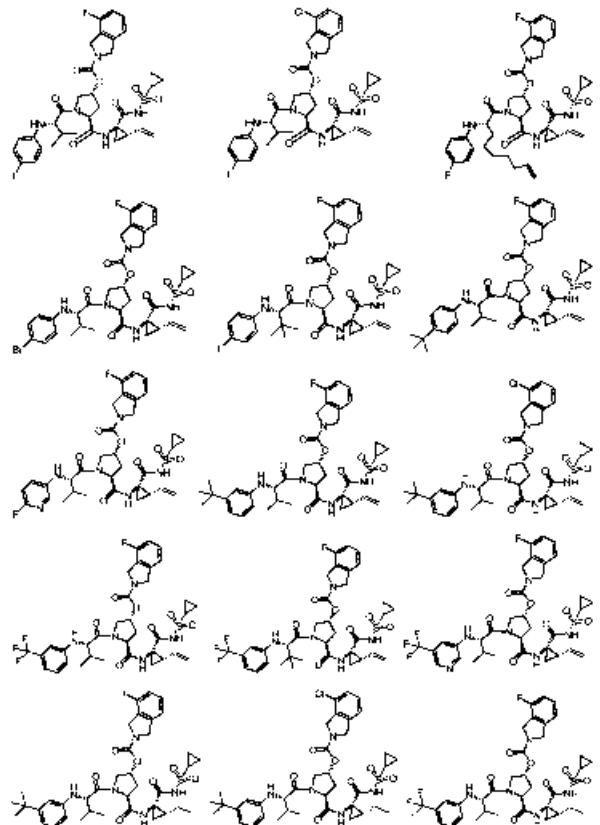
Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque se representa por la fórmula (1) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde Ar es heteroarilo bicíclico fusionado opcionalmente sustituido, arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido o isoindolinilo opcionalmente sustituido; z es 0 ó 1; G

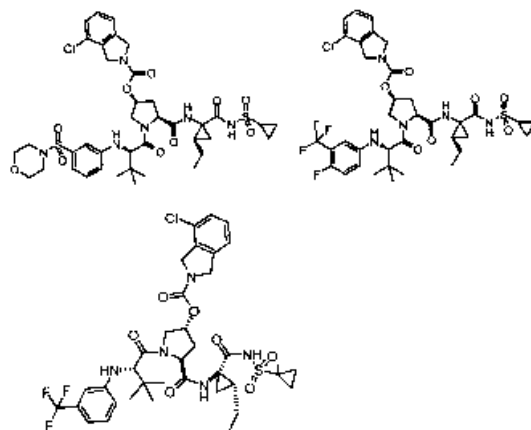
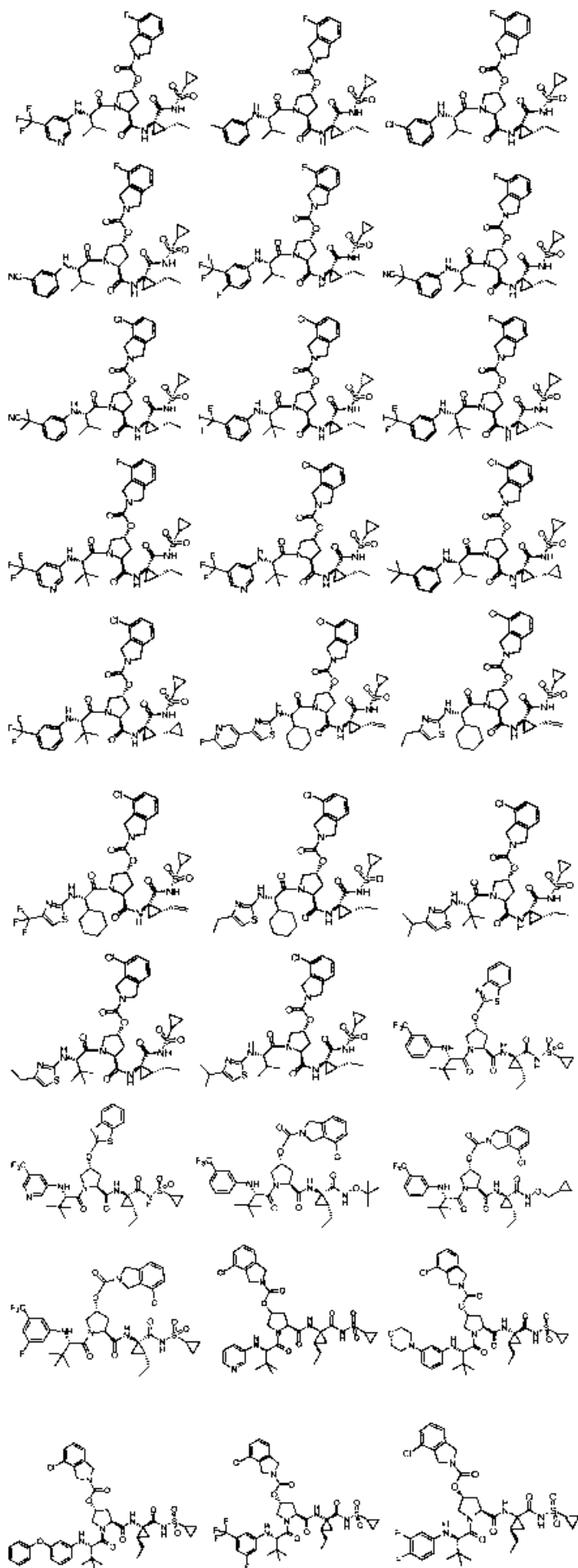
es un resto del grupo fórmulas (2); B es arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido; R^o es H o hidrocarbilo C₁₋₁₂; D es alquilo C₁₋₁₀ o NR¹¹R¹², en donde R¹¹ y R¹² son independientemente H o alquilo C₁₋₅ y en donde R¹¹ y R¹² se pueden conectar para formar uno o más anillos; y E es hidrocarbilo C₁₋₆; con la condición de que el compuesto no sea seleccionado del grupo de fórmulas (3).

- (71) INTERMUNE, INC.
3280 BAYSHORE BOULEVARD, BRISBANE, CALIFORNIA 94005, US
(72) STOYCHEVA, ANTITSA - SEIWERT, SCOTT - BEIGELMAN, LEONID - BUCKMAN, BRAD - SEREBRYANY, VLADIMIR
(74) 1555
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



GRUPO (3)





- (10) AR073881 A1
 (21) P090103979
 (22) 15/10/09
 (30) EP 08382043.1 15/10/08
 US 61/140282 23/12/08
 (51) C07D 487/04, A61K 31/519, A61P 29/00, 37/00, 37/08
 (54) DERIVADOS DE PIRAZOLOPIRIMIDINA ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR H4
 (57) Derivados de pirazolo-pirimidina útiles como antagonistas del receptor H4 de la histamina. Se proveen además composiciones farmacéuticas que los comprenden, su uso en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de enfermedades relacionadas y un proceso para su preparación.
- Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado por la fórmula (1) donde: R¹ y R² forman, junto con el átomo de N al que estén unidos, un grupo heterocíclico saturado seleccionado de: (i) un grupo heterocíclico que contiene 2 átomos de N y no contiene ningún otro heteroátomo, donde dicho grupo heterocíclico puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C₁₋₄; y (ii) un grupo heterocíclico que contiene 1 átomo de N y no contiene ningún otro heteroátomo, donde dicho grupo heterocíclico está sustituido con un grupo -NR^aR^b y puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C₁₋₄; pudiendo ser dichos grupos heterocíclicos (i) y (ii) monocíclicos de 4 a 7 miembros, bicíclicos con puente de 7 a 8 miembros o bicíclicos condensados de 8 a 12 miembros; o R¹ representa H o alquilo C₁₋₄, y R² representa azetidino, pirrolidino, piperidino o azepanilo, que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C₁₋₄; R^a representa H o alquilo C₁₋₄; R^b representa H o alquilo C₁₋₄; o R^a y R^b forman, junto con el átomo de N al que están unidos, un grupo azetidino, pirrolidino, piperidino o azepanilo que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C₁₋₄; R³ representa H o NH₂; R⁵ puede estar situado o en N¹ o N² del anillo de pirazol; cuando R⁵ está unido a N¹, o R⁴ representa R⁶ y R⁵ representa R⁷, o R⁴ representa R⁷ y R⁵ representa R⁸, o R⁴ y R⁵ pueden estar unidos juntos formando un grupo alqueno C₃₋₅ que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos

alquilo C₁₋₆; cuando R⁵ está unido a N², R⁴ representa R⁶ y R⁵ representa R⁷; R⁶ representa H, alquilo C₁₋₁₁, cicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, heterocicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, aril-alquilo C₀₋₁₁, heteroaril-alquilo C₀₋₁₁, aril-NH-alquilo C₀₋₁₁, heteroaril-NH-alquilo C₀₋₁₁, R⁹-alquilo C₀₋₁₁ o R¹⁰-W-alquilo C₀₋₁₁; R⁷ representa H, alquilo C₁₋₆, cicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₆, alcoxi C₁₋₆-alquilo C₁₋₆ o (cicloalquil C₃₋₈-alquil C₀₋₆)-O-alquilo C₁₋₆; R⁸ representa cicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, heterocicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, aril-alquilo C₀₋₁₁, heteroaril-alquilo C₀₋₁₁, aril-NH-alquilo C₂₋₁₁, heteroaril-NH-alquilo C₂₋₁₁, R⁹-alquilo C₂₋₁₁ o R¹⁰-W-alquilo C₂₋₁₁; R⁹ representa -CONR¹¹R¹¹, -NR¹¹COR¹¹, -NR¹¹SO₂R¹¹, -SO₂NR¹¹R¹¹, -NR¹¹CONR¹¹R¹¹, -CONHSO₂R¹¹, -CO₂R¹¹, -SO₂R¹¹, -NR¹¹R¹¹ o 1H-tetrazol-5-ilo; R¹⁰ representa H, alquilo C₁₋₁₁, R¹¹-O-alquilo C₁₋₁₁, cicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, heterocicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₁₁, aril-alquilo C₀₋₁₁, heteroaril-alquilo C₀₋₁₁, aril-NH-alquilo C₂₋₁₁, heteroaril-NH-C₂₋₁₁ alquilo o R⁹-alquilo C₁₋₁₁; R¹¹ representa H, alquilo C₁₋₆, cicloalquil C₃₋₈-alquilo C₀₋₆ o aril-alquilo C₀₋₆; W representa O, S, SO o SO₂; donde, en R⁶, R⁸ y R¹⁰ cualquier grupo alquilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, y cualquier grupo cicloalquilo y heterocicloalquilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁₋₆, halógeno, arilo y R⁹; arilo representa fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos R¹²; heteroarilo representa un anillo aromático, monocíclico de 5 ó 6 miembros o bicíclico de 8 a 12 miembros, que contiene hasta cuatro heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, oxígeno y azufre, que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más grupos R¹²; y cada R¹² representa independientemente alquilo C₁₋₆, halógeno, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, CN, hidroxil-alquilo C₀₋₆, CO₂R¹¹-alquilo C₀₋₆, CONHSO₂R¹¹-alquilo C₁₋₆, (1H-tetrazol-5-il)-alquilo C₀₋₆, -CONR¹¹R¹¹, -SO₂NR¹¹R¹¹, -SO₂-alquilo C₁₋₆, -NR¹¹SO₂-alquilo C₁₋₆, -NR¹¹CONR¹¹R¹¹, -NR¹¹COR¹¹ o -NR¹¹R¹¹; o una de sus sales.

(71) PALAU PHARMA S.A.

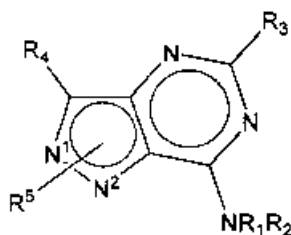
AV. CAMI REIAL, 51-57, E-08184 PALAU-SOLITA I PLEGAMANS, BARCELONA, ES

(72) VIRGILI BERNADO, MARINA - CARCELLER GONZALEZ, ELENA

(74) 107

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(1)

(10) AR073882 A4

(21) M090103981

(22) 16/10/09

(51) F24C 13/00, F24H 8/00, 6/00

(54) APARATO PARA RECUPERAR CALOR DE LOS GASES DE ESCAPE DE LOS CALEFACTORES CON SALIDA AL EXTERIOR

(57) Dispositivo para recuperar calor de los gases de escape de los calefactores con salida al exterior destinado a producir el aprovechamiento útil de las calorías que se pierden en los gases de salida de los calefactores y otros aparatos térmicos con salida de los mismos al exterior consta de un intercambiador de calor gas-líquido de tubos de metal (1) de forma cilíndrica y tamaño especial de modo que pueda ser colocado en el interior de los tubos de escape (2) de los gases de salida de los calefactores (3) y conectado por cañerías (4) formando un circuito cerrado por donde circula un líquido a un radiador convencional existente en el mercado (5) que transmite ese calor recuperado al ambiente y en cuyo circuito se encuentra un líquido que circula por convección natural que es incorporado desde el tapón roscado (6) y posee además una válvula aliviadora da seguridad (7).

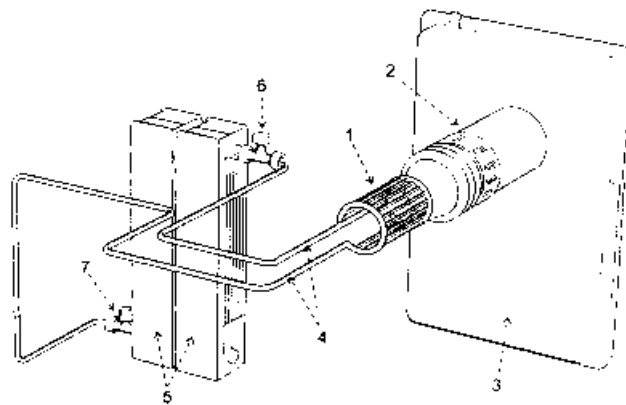
(71) KOFMAN, PABLO FEDERICO

ARRUABARRENA 213, (3200) CONCORDIA, PROV. DE ENTRE RIOS, AR

(72) KOFMAN, PABLO FEDERICO

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073883 A1

(21) P090103982

(22) 16/10/09

(51) F23D 14/20

(54) QUEMADOR DE GRAN VELOCIDAD PARA INTERCAMBIO DE CALOR POR CONVECCION

(57) Quemador de gran velocidad para intercambio de calor por convección, que consiste esencialmente en un quemador (1) de gran eficacia que se utilizará preferentemente en la calefacción de hornos y unidades industriales, en el mantenimiento de la temperatura de unidades calientes o en el refres-

camiento controlado de éstos, con saliente para un sistema interno de calentamiento y mezcla excelente del aire y gas básicamente hecho posible por un reborde (2), dotado con orificios (3), capaces de promover, ente otras variables, la estabilidad de la llama en una gama extensa de relaciones de mezcla de ambos componentes.

Reivindicación 1: Quemador de gran velocidad para intercambio de calor por convección, caracterizado por poseer un reborde (2) dotado con orificios (3) con área estandarizada, mismo con exceso de aire; reduce la velocidad de la llama y del calor excesivo del aire y del gas, propiciando la mezcla excelente antes de la ignición; para tal, el quemador (1) posee una entrada de aire en la región posterior, que se obliga a pasar a través de dos series de orificios (3) en la región anular externa de la zona de admisión y calentamiento del gas combustible; al frente de la entrada de aire, un tabique (A) desvía el aire del contacto directo con el gas; la generación del aire caliente en etapas ocurre en una primera etapa en la región de salida del reborde (2) con la admisión del gas en la primera vía (4) recibe el aire en la parte interna del reborde (2) donde pasa por una secuencia de desviaciones (6), durante las cuales el gas pierde la presión y la velocidad que facilitan su mezcla con el aire en esta misma región; con la mezcla lograda, una bujía de ignición (7) produce una chispa responsable por el principio de la llama en la salida del reborde (2); la mezcla del aire restante después de la estabilización de la llama, en la región externa al reborde (2) genera aire caliente en una segunda etapa, la segunda vía (5) del gas es utilizada para la admisión del gas directamente al frente de la llama para generar el aire caliente en una tercera etapa y es utilizada durante la operación del quemador solamente cuando la llama tendrá longitud bastante para cubrir a este punto de entrada auxiliar del gas, de manera que la llama principal sirve como llama piloto para la ignición del gas auxiliar.

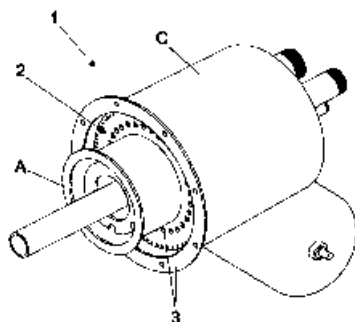
(71) LEITE PASSOS, RICARDO
RUA JOAO SPINELLO, 52, MAUA, SAO CAETANO DO SUL, SP, BR

(72) LEITE PASSOS, RICARDO

(74) 996

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073884 A1

(21) P090103983

(22) 16/10/09

(30) JP 2008-279014 30/10/08

(51) C22C 38/00

(54) TUBO DE ACERO INOXIDABLE DE ALTA RESISTENCIA EXCELENTE EN RESISTENCIA A LA FISURACION BAJO TENSION POR SULFUROS Y A LA CORROSION DE GAS DE ACIDO CARBONICO EN ALTA TEMPERATURA

(57) El problema a ser resuelto es la provisión de un tubo de acero inoxidable de alta resistencia que posee resistencia a la corrosión suficiente en un ambiente de gas ácido carbónico de alta temperatura y una excelente resistencia a la fisuración bajo tensión por sulfuros a temperatura normal. El tubo de acero inoxidable consiste de, en peso %, C: $\leq 0,05\%$, Si: $\leq 1,0\%$, P: $\leq 0,05\%$, S: $< 0,002\%$, Cr: $> 16\%$ y $\leq 18\%$, Mo: $> 2\%$ y $\leq 3\%$, Cu: 1% a $3,5\%$, Ni: $\geq 3\%$ y $< 5\%$, Al: $0,001\%$ a $0,1\%$ y O: $\leq 0,001\%$, Mn: $\leq 1\%$ y N: $\leq 0,05\%$, y Mn y N en los rangos definidos satisfacen en la fórmula (1):

$$[\text{Mn}] \times ([\text{N}] - 0,00045) \leq 0,001 \quad (1)$$

y el balance siendo Fe e impurezas; y la micro estructura de metal de tubo de acero inoxidable principalmente incluye una fase martensítica e incluye 10 a 40% de una fase ferrítica por fracción de volumen y 10% o menos de una fase retenida por fracción de volumen. En donde los símbolos de elementos respectivamente representan los contenidos (unidad: % en peso) de los elementos en el acero.

(71) SUMITOMO METAL INDUSTRIES, LTD.

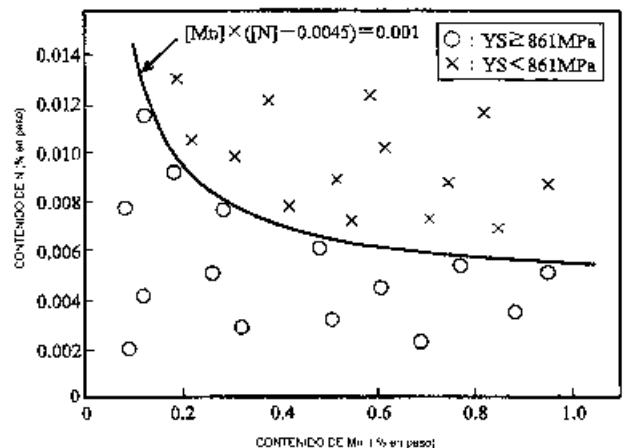
5-33, KITAHAMA 4-CHOME, CHUO-KU, OSAKA-SHI, OSAKA 541-0041, JP

(72) KONDO, KUNIO - AMAYA, HISASHI - TAKABE, HIDEKI - OHE, TARO

(74) 952

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

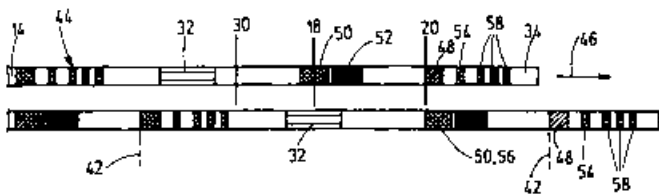


(10) AR073885 A1

(21) P090103985

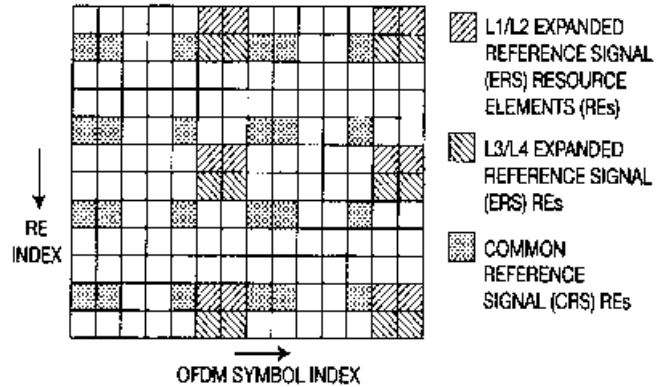
- (22) 16/10/09
 (30) EP 08166955.8 17/10/08
 (51) G01N 35/00, 33/487
 (54) UNIDAD DE CINTA DE PRUEBA Y APARATO DE CINTA DE PRUEBA
 (57) Se refiere a una unidad de cinta de prueba con una cinta de soporte (34) flexible que se puede enrollar hacia adelante mediante un accionamiento de cinta (16), sobre la cual se encuentran ubicados una multiplicidad de campos de prueba (32) para análisis, para ser cargados con líquido corporal en un sector de cinta (42) correspondiente. Se propone que cada sector de cinta (42) presente varias marcas de posición (44) que se pueden explorar por medio de un sensor de cinta (20) y de este modo se pueden identificar por medio de un parámetro de medición, para diferentes posiciones de función. Además un aparato de cinta de prueba para el procesamiento de una unidad de cinta de este tipo.

- (71) F. HOFFMANN-LA ROCHE AG
 124 GRENZACHERSTRASSE, CH-4070 BASILEA, CH
 (72) PORSCH, ULRICH - MANSER, UDO - LORENZ, ROBERT - KEHR, ULRICH - TREINZEN, ANDREE - MILTNER, KARL - STEINACHER, BEDA - SIEBER, STEFAN
 (74) 108
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073886 A1
 (21) P090103986
 (22) 16/10/09
 (30) US 61/105971 16/10/08
 (51) H04L 25/02
 (54) METODO Y APARATO PARA UNA UNIDAD DE TRANSMISION / RECEPCION INALAMBRICA PARA UNA TRANSMISION DE SEÑAL ESPECIFICA DE PILOTE Y UNIDAD DE TRANSMISION / RECEPCION INALAMBRICA PARA INTENSIFICAR LA POTENCIA DE SEÑAL ESPECIFICA DE PILOTE
 (57) Se describen un método y aparato para proveer una estimación de canal mejorada para unidades inalámbricas de transmisión/recepción (WTRUs) que requieren una estimación de canal mejorada (por ejemplo, WTRUs de borde de célula), mediante la asignación de elementos de recursos (Res) adicionales como señales piloto para mejorar la estimación de canal. Estos REs adicionales pueden ser asignados para ser utilizarlos con señales de referencia ampliadas (ERSs).

- (71) INTERDIGITAL PATENT HOLDINGS, INC.
 3411 SILVERSIDE ROAD, CONCORD PLAZA, SUITE 105, HAGLEY BUILDING, WILMINGTON, DELAWARE 19810, US
 (72) PIETRASKI, PHILIP J. - SHIN, SUNG-HYUK - PAN, KYLE JUNG-LIN - ZHANG, GUODONG - BALA, ERDEM
 (74) 108
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

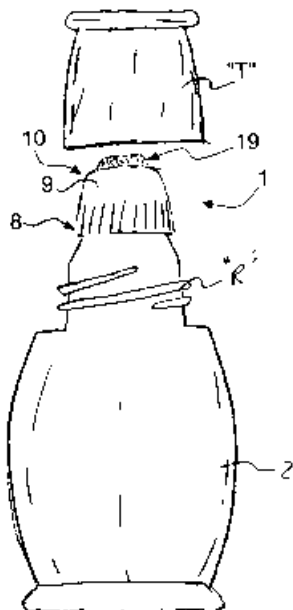


- (10) AR073887 A1
 (21) P090103987
 (22) 16/10/09
 (30) US 61/105984 16/10/08
 (51) H04L 27/26, 5/00
 (54) METODO Y APARATO PARA TRANSMITIR Y RECIBIR TRANSMISIONES EN BASE MULTIPLEX ORTOGONALES CON FRECUENCIA DIVIDIDA
 (57) Se divulgan un método y un aparato para transmitir y recibir transmisiones a base de múltiples por división de frecuencia ortogonal (OFDM). La información de control puede ser transmitida al menos un símbolo antes que los símbolos de datos correspondientes, de modo tal que la unidad inalámbrica de transmisión/recepción (WTRU) tiene tiempo para determinar qué partes de las subportadoras necesitan ser recibidas sin tener que almacenar temporalmente ningún símbolo de datos correspondiente. La información de control relacionada con la ubicación de frecuencia de los datos puede ser recibida en la primera subtrama y la información de control no relacionada con la ubicación de frecuencia de los datos puede ser recibida en la segunda subtrama que incluye los datos correspondientes. La compensación entre la información de control y los datos puede ser un valor fijo, puede ser recibida de la red, o puede ser incluida en la información de control que precede los datos correspondientes.
 (71) INTERDIGITAL PATENT HOLDINGS, INC.
 3411 SILVERSIDE ROAD, CONCORD PLAZA, SUITE 105, HAGLEY BUILDING, WILMINGTON, DELAWARE 19810, US
 (72) BALA, ERDEM - SHIN, SUNG-HYUK - LEVY, JOSEPH S. - ZHANG, GUODONG - PIETRASKI, PHILIP J.

(74) 108
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



(10) AR073888 A1
(21) P090103989
(22) 16/10/09
(51) B05C 1/09
(54) UN CABEZAL APLICADOR DE ADHESIVOS
(57) Un cabezal aplicador de adhesivos, para envases contenedores de dichos adhesivos, y destinado para aplicar adhesivos de forma regulada sobre superficies a pegar, en donde dicho cabezal comprende una tapa o porción anular roscada removiblemente sobre el cuello o pico del envase y un medio entramado liberador y aplicador de adhesivo dispuesto en dicha porción anular, estando montado removiblemente entre dicha porción anular y el pico del envase un tapón obturador.
(71) PELIKAN ARGENTINA SOCIEDAD ANONIMA
SAN JOSE 83, PISO 5º, (1076) CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
(74) 474
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



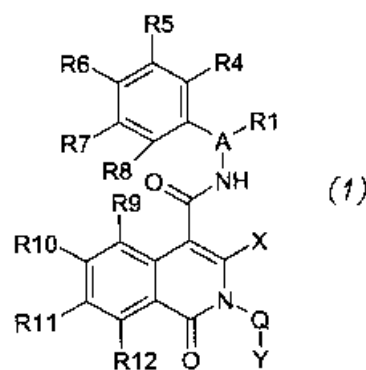
(10) AR073889 A1
(21) P090103990
(22) 16/10/09
(30) EP 08018194.4 17/10/08
(51) A23L 1/035, 1/187, 1/19, 1/03
(54) AGENTE DE BATIDO
(57) La presente se relaciona con un agente de batido que comprende por lo menos una grasa, por lo menos una proteína y por lo menos un emulsionante en donde la cantidad de todos los emulsionantes presentes en el agente de batido es de por lo menos 0,1% en peso del agente de batido y en donde la cantidad de porciones presentes de ácido graso no saturado en la grasa es de por lo menos 10% en peso de todas las porciones presentes de ácido graso en la grasa. Además, la presente se relaciona con un polvo instantáneo para elaborar un postre en polvo instantáneo que comprende el agente de batido, un alimento que comprende una espuma que se obtiene por batido, en donde la espuma comprende el agente de batido, un proceso para elaborar el agente de batido y el uso del agente de batido para elaborar un alimento que comprende una espuma que se obtiene por medio de batido.
(71) COGNIS IP MANAGEMENT GMBH
HENKELSTRASSE 67, D-40589 DÜSSELDORF, DE
(72) KIELMEYER, FRIEDRICH - SALACZ, ROBERT - REITLINGER, CHRISTINA
(74) 734
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

(10) AR073890 A1
(21) P090103992
(22) 16/10/09
(30) FR 08 57102 17/10/08
(51) A23L 1/29, A61K 35/74, 35/66, A61P 31/16, 37/04
(54) COMPOSICION QUE COMPRENDE UNA COMBINACION DE UN EXTRACTO DE SAUCO Y UNA CEPAS DE L. PARACASEI, L. CASEI, L. BULGARICUS O S. THERMOPHILUS
(57) Una composición que comprende una combinación de un extracto de saúco (*Sambucus nigra*) y una cepa de *L. paracasei*, *L. casei*, *L. bulgaricus* o *S. thermophilus*, la cual tiene el propósito de estimular la inmunidad y/o promover una respuesta antiinfecciosa y/o antiinflamatoria.
(83) CNM: I-1518, I-2130, I-2787
(71) PIERRE FABRE MEDICAMENT
45, PLACE ABEL GANCE, F-92100 BOULOGNE-BILLANCOURT, FR
COMPAGNIE GERVAIS DANONE
17, BOULEVARD HAUSSMANN, F-75009 PARIS, FR
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073891 A1
 (21) P090103993
 (22) 16/10/09
 (30) DK PA 2008 01458 20/10/08
 (51) C07D 217/26, 217/24, 405/06, 401/06, 401/12, 409/06, 413/06, 417/06, A61K 31/472, 31/4725, A61P 25/16, 25/18, 25/22, 25/24, 25/28
 (54) DERIVADOS DE ISOQUINOLINONA ANTAGONISTAS DE RECEPTORES NK3, COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIENEN Y USO DE LOS MISMOS EN EL TRATAMIENTO DE PSICOSIS, ALZHEIMER Y OTRAS ENFERMEDADES

(57) Reivindicación 1: Un compuesto según la fórmula (1) en donde A representa N, CH o CR¹; cada R¹ independientemente representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, -C(O)-alquilo C₁₋₆, -C(O)-alquenilo C₂₋₆, -C(O)-alquinilo C₂₋₆, -C(O)-O-alquilo C₁₋₆, -C(O)-O-alquenilo C₂₋₆, -C(O)-O-alquinilo C₂₋₆ o fenilo, en donde dicho fenilo, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆ o alquinilo C₂₋₆, está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, hidroxilo, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alcoxi C₁₋₆, y NR²R³; X representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o -CR^aR^b-X', en donde X' representa una porción monocíclica saturada que tiene 5-6 átomos en el anillo uno de los cuales es N y en donde uno o dos átomos del anillo adicionales pueden ser un heteroátomo seleccionado de N, O y S, dicho anillo monocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes W, en donde W se selecciona de alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o (=O); cada R^a y R^b representa individualmente hidrógeno, -CH₃ o halógeno; Q representa -CH₂- o -NH-; Y representa heteroarilo con 5-6 átomos en el anillo, en donde 1, 2 ó 3 átomos en el anillo se seleccionan de O, N o S, o Y representa fenilo, en donde dicho heteroarilo o fenilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o alcoxi C₁₋₆; en donde cada uno de R² y R³ independientemente representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, hidroxialquilo C₁₋₆, o haloalquilo C₁₋₆; cada uno de R⁴-R⁹ y R⁹-R¹² independientemente representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, halógeno, NR²R³, hidroxilo, ciano, nitro, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o hidroxialquilo C₁₋₆; y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

- (71) H. LUNDBECK A/S
 9, OTTILIAVEJ, DK-2500 VALBY-COPENHAGÜE, DK
 (74) 195
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073892 A1
 (21) P090103994
 (22) 16/10/09
 (30) US 61/106231 17/10/08
 US 61/106260 17/10/08
 US 12/578934 14/10/09
 (51) C07H 13/04, A61K 31/7024, A61P 3/10
 (54) PROCESO DE PREPARACION DE INHIBIDORES DE SGLT
 (57) La presente está dirigida a un proceso para la preparación de compuestos que tienen actividad inhibitoria contra el transportador de glucosa dependiente de sodio (SGLT) presente en el intestino o en el riñón.
Reivindicación 1: Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula (1), en donde el Anillo A y el Anillo B son uno de los siguientes: (i) el Anillo A es un anillo heterocíclico monocíclico insaturado opcionalmente sustituido y el Anillo B es un anillo heterocíclico monocíclico insaturado opcionalmente sustituido, anillo heterobícíclico fusionado insaturado opcionalmente sustituido, o un anillo de benceno opcionalmente sustituido; o (ii) el Anillo A es un anillo de benceno opcionalmente sustituido, y el Anillo B es un anillo heterocíclico monocíclico insaturado opcionalmente sustituido o un anillo heterobícíclico fusionado insaturado opcionalmente sustituido, en donde Y está enlazado al anillo heterocíclico del anillo heterobícíclico fusionado; o (iii) el Anillo A es un anillo heterobícíclico fusionado insaturado opcionalmente sustituido, en donde tanto la porción azúcar X-(azúcar) como la porción -Y-(Anillo B) están en el mismo anillo heterocíclico del anillo heterobícíclico fusionado, y el Anillo B es un anillo heterocíclico monocíclico insaturado opcionalmente sustituido, un anillo heterobícíclico fusionado insaturado opcionalmente sustituido o un anillo de benceno opcionalmente sustituido; X es un átomo de carbono; Y es -(CH₂)_n, en donde n es 1 ó 2; siempre y cuando en el Anillo A, X sea parte de un enlace insaturado; o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable de éste; el proceso comprende: hacer reaccionar un compuesto de fórmula (2), en donde Q⁰ es bromo o yodo, con un complejo de di(alquil C₁₋₄)magnesio con cloruro de litio o un complejo de C₁₋₄ cloruro de alquilmagnesio con cloruro de litio o un complejo de C₁₋₄ bromuro de

alquilmagnesio con cloruro de litio en un solvente orgánico o mezcla de éste a una temperatura que varía desde aproximadamente la temperatura ambiente hasta aproximadamente -78°C para obtener el compuesto de fórmula (3) correspondiente, en donde Q^1 es el MgCl o MgBr correspondiente; o hacer reaccionar el compuesto de fórmula (3) con un compuesto de fórmula (4), en donde Z es un grupo protector de oxígeno, en un solvente orgánico o mezcla de éste a una temperatura que varía desde aproximadamente la temperatura ambiente hasta aproximadamente -78°C para obtener el compuesto de fórmula (5) correspondiente; hacer reaccionar el compuesto de fórmula (5) para obtener el compuesto de fórmula (1) correspondiente.

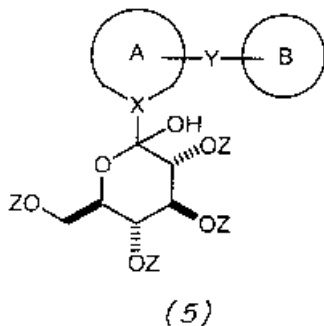
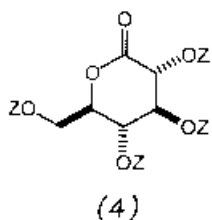
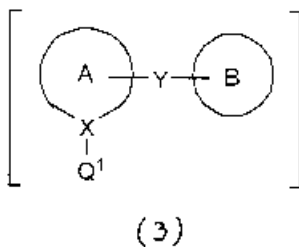
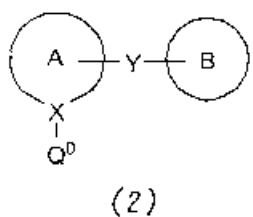
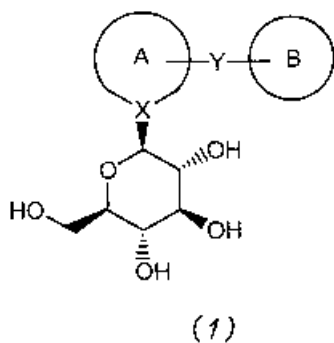
(71) JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.

TURNHOUTSEWEG 30, B-2340 BEERSE, BE
MITSUBISHI TANABE PHARMA CORPORATION
2-6-18, KITAHAMA, CHUO-KU, OSAKA 541-8505, JP

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073893 A1

(21) P090103995

(22) 16/10/09

(30) US 61/106428 17/10/08

(51) G06F 19/00

(54) NAVEGACION INTUITIVA GUIADA POR VOZ.

(57) La información de flujo de llamadas puede transformar la "intención" en flujos de llamadas que tienen una serie de pasos previstos y uno o más pasos alternativos para pasos previstos seleccionados. Los usuarios pueden avanzar en el flujo de llamadas basándose en cualquier respuesta distinta de una o más respuestas válidas alternativas para dicho paso previsto que conducen en el flujo de llamadas hacia uno o más pasos alternativos a dicho paso previsto debido a que cada acción en el flujo de llamadas motiva al usuario a seguir el ordenamiento predeterminado. Un usuario puede avanzar desde un primer paso previsto en la serie de pasos previstos hacia un segundo paso previsto en la serie de pasos previstos en base a una respuesta del usuario o información conocida o descubierta sobre el usuario.

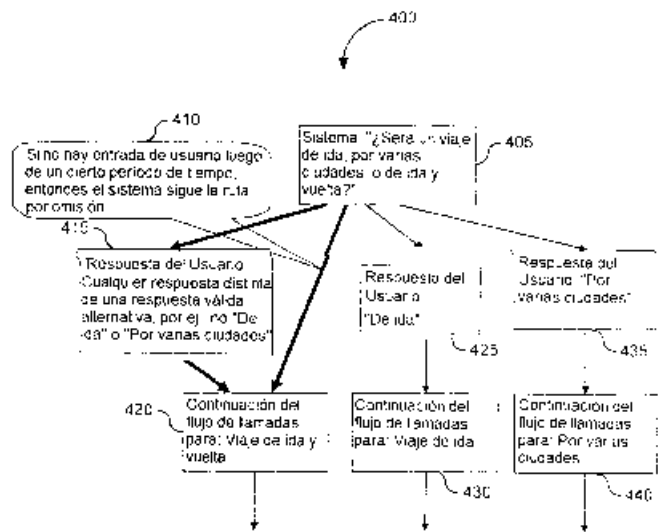
(71) COMMONWEALTH INTELLECTUAL PROPERTY HOLDINGS, INC.

901 WHISPERING PINES DRIVE, SCOTTS VALLEY, CALIFORNIA 95066, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073894 A1

(21) P090103996

(22) 16/10/09

(30) US 12/288207 17/10/08

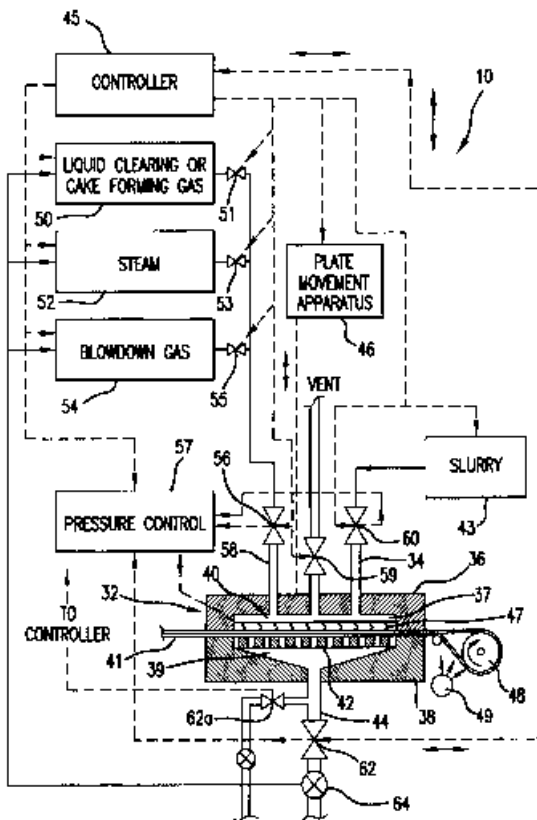
(51) B01D 25/127

(54) APARATO DE FILTRADO DE PRESION Y METODO QUE UTILIZA GAS QUE SE EXPANDE INTERSTICIALMENTE

(57) Un método y aparato para separar una lechada en líquidos y sólidos en un aparato de filtrado de presión y para formar una torta de sólidos de filtrado substancialmente seca y frecuentemente poco compacta en donde un vapor de alta temperatura y presión se introduce dentro de una torta de sólidos de filtrado inicialmente formada en el aparato de fil-

trado presurizado para forzar el vapor dentro de los intersticios de la torta de sólidos de filtrado formada y luego la presión dentro del aparato de filtrado se reduce para permitir que el vapor destelle y se expanda dentro de los intersticios para absorber todo fluido remanente dentro de la torta de sólidos de filtrado formada y causar que la torta de filtrado se torne substancialmente seca y poco compacta. La torta de sólidos filtrada se descarga entonces por el aparato de filtrado.

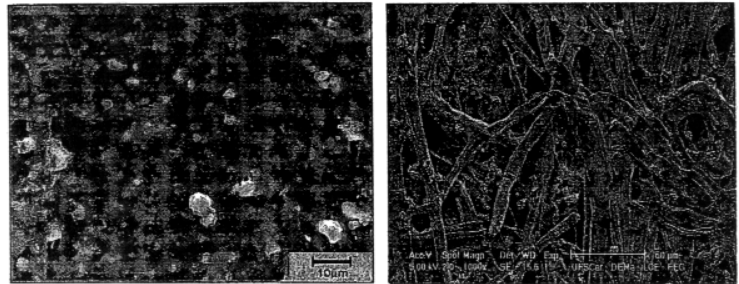
- (71) FLSMIDTH A/S
VIGERSLEV ALLE 77, DK-2500 VALBY, COPENHAGEN, DK
(74) 194
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



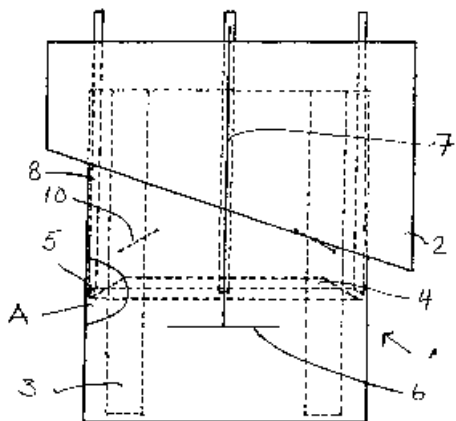
- (10) AR073895 A1
(21) P090103998
(22) 16/10/09
(51) D21H 13/10, 13/14, 15/10, 19/10, 19/24, 25/06, B41M 7/00
(54) COMPOSICIONES PARA PAPELES SINTETICOS Y PELICULAS ECOLOGICAS PARA LA ESCRITURA E IMPRESION, PAPELES SINTETICOS Y PELICULAS OBTENIDAS A PARTIR DE DICHAS COMPOSICIONES Y USO DE LOS MISMOS
(57) Se describen composiciones para papeles sintéticos, películas planas y tubulares y coextrusadas para escritura e impresión, a partir de compuestos a base de polímeros termoplásticos reciclados y vírgenes, cargas minerales y aditivos, utilizando procesos multicapas o monocapa de orientación

biaxial o monoaxial. Los polímeros poliolefinicos tales como polipropileno (PP), polietileno y sus copolímeros, además de polímeros estirénicos, se utilizan en forma de materiales reciclados, preferentemente, y vírgenes. Los polímeros reciclados utilizados incluyen no sólo los provenientes de residuos post-consumo, sino también los residuos industriales. La presente solicitud difiere de las demás por la utilización preferencial de residuos post-consumo reciclados, principalmente, o por las composiciones, o por los materiales o procesos distintos empleados en la producción de las películas u hojas de papeles sintéticos.

- (71) FUNDAÇÃO UNIVERSIDADE FEDERAL DE SAO CARLOS
RODOVIA WASHINGTON LUIS, KM. 235, 13565-905 SAO CARLOS, SP, BR
VITOPÉL DO BRASIL LTDA.
RUA IRMA FERRARESI, S/Nº, VOTOCÉL, 18110-350 VOTORANTIM, SP, BR
(74) 107
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073896 A1
(21) P090103999
(22) 16/10/09
(30) FI 20080578 17/10/08
(51) B01F 3/04, 7/16
(54) METODO PARA MEZCLAR GAS EN SUSPENSION ACUOSA DURANTE LA FLOTACION Y APARATO PARA HACERLO
(57) La solicitud se refiere a un método y aparato para mezclar gas en suspensión acuosa durante la flotación y para guiar a la dispersión de suspensión acuosa en dirección ascendente en el reactor en una manera controlada. El método utiliza el efecto combinado de una mezcladora potente y dispositivos colocados dentro del reactor. El método y aparato son especialmente adecuados para la flotación de minerales que contienen metal que son difíciles de procesar.
(71) OUTOTEC OYJ
RIIHITONTUNTIE 7, FIN-02200 ESPOO, FI
(74) 336
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

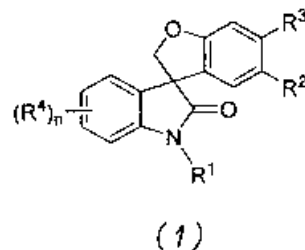


- (10) AR073897 A1
 (21) P090104001
 (22) 16/10/09
 (30) US 12/253504 17/10/08
 (51) E21B 37/06, C10L 3/00
 (54) METODO PARA CONTROLAR LOS HIDRATOS DE GAS EN SISTEMA FLUIDOS
 (57) Un método para inhibir los hidratos en un fluido que comprende agua y gas que comprende agregar al fluido una cantidad efectiva para inhibir los hidratos de una composición que comprende uno o más copolímeros de monómeros de N-alquil(alquil)acrilamida y uno o más monómeros catiónicos que se seleccionan entre ácidos y sales que son cloruros de (met)acrilatos de N,N-dialquilaminoalquilo y N,N-dialquilaminoalquil (met)acrilamidas, cuaternizados con alquilos.
- (71) NALCO COMPANY
 1601 W. DIEHL ROAD, NAPERVILLE, ILLINOIS 60563-1198, US
- (72) CONRAD, PETER G. - ACOSTA, ERICK J. - McNAMEE, KEVIN P. - BENNETT, BRIAN M. - LINDEMAN, OLGA E. S. - CARLISE, JOSEPH R.
- (74) 1102
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073898 A1
 (21) P090104002
 (22) 16/10/09
 (30) US 61/106410 17/10/08
 (51) C07D 491/107, 491/20, A61K 31/407, A61P 25/00, 29/00
 (54) COMPUESTOS DE ESPIRO-OXINDOL Y SU USO COMO AGENTES TERAPEUTICOS
 (57) Compuestos para el tratamiento y/o prevención de enfermedades o afecciones mediadas por canales de sodio, tal como el dolor.
- Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque es de fórmula (1), donde: n es 0, 1, 2, 3 ó 4; R¹ se selecciona entre el grupo que consiste de hidrógeno, -R⁵-C(=NOR⁶)N(R⁷)R⁸, difenilmetilo, aralquilo (opcionalmente sustituido con un susti-

tuyente seleccionado entre el grupo que consiste de -N(R⁷)R⁸, -C(=NOR⁶)N(R⁷)R⁸, -O-R⁵-OR⁷, -O-R⁵-C(O)OR⁷, -O-R⁵-C(O)N(R⁷)R⁸, -O-R⁵-N(R⁷)R⁸ y -S(O)R⁷ y heterociclilalquilo (opcionalmente sustituido con -C(O)R⁷); R² es hidrógeno; R³ se selecciona entre el grupo que consiste de -O-R⁵-N(R⁷)R⁸, -O-R⁵-N(R⁷)C(O)OR⁸, -O-R⁵-C(O)OR⁷, -O-Si(R⁷)₃ y -N[S(O)₂R⁷]₂; o R² y R³, junto con los carbonos a los cuales se encuentran unidos, forman un anillo O-heterociclilo opcionalmente sustituido con =NOR⁷; R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste de alquilo, halo, haloalquilo, arilo opcionalmente sustituido y aralquilo opcionalmente sustituido; cada R⁵ se selecciona independientemente entre el grupo que consiste de una cadena alquilenilo lineal o ramificada opcionalmente sustituida, una cadena alquenileno lineal o ramificada opcionalmente sustituida y una cadena alquinileno lineal o ramificada opcionalmente sustituida; R⁶ se selecciona entre el grupo que consiste de hidrógeno y -C(O)R⁷; y cada R⁷ y R⁸ se selecciona independientemente entre el grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, arilo opcionalmente sustituido, aralquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilalquilo opcionalmente sustituido, y heterociclilo opcionalmente sustituido; como un estereoisómero, enantiómero o tautómero del mismo o mezclas de los mismos; o una sal, solvato o prodroga aceptable farmacéuticamente del mismo.

- (71) XENON PHARMACEUTICALS, INC.
 3650 GILMORE WAY, BURNABY, BRITISH COLUMBIA V5G 4W8, CA
- (72) CHAFEEV, MIKHAIL - CHOWDHURY, SULTAN - FU, JIANMIN - SUN, JIANYU - SVIRIDOV, SERGUEI - FRASER, LAUREN - LIU, SHIFENG - SUN, SHAOYI - LANGILLE, JONATHAN - WOOD, MARK - ZENOVA, ALLA
- (74) 1102
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073899 A1
 (21) P090104003
 (22) 16/10/09
 (30) US 12/253529 17/10/08
 (51) E21B 37/06, C10L 3/00
 (54) METODO PARA CONTROLAR LOS HIDRATOS DE GAS EN SISTEMAS FLUIDOS
 (57) Un método para inhibir los hidratos en un fluido que comprende agua y gas que comprende agregar al

fluido una cantidad efectiva para inhibir los hidratos de una composición que comprende uno o más homo- o co-polímeros de N-alquil (alquil)acrilamida que se sintetiza polimerizando uno o más monómeros de N-alquil (alquil)acrilamida en un solvente que comprende un éter de glicol de fórmula $\text{CH}_2-(\text{CH}_2)_m-(\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2)_n-\text{OH}$ donde m es 0 ó 1, y n es un entero ≥ 1 .

(71) NALCO COMPANY

1601 W. DIEHL ROAD, NAPERVILLE, ILLINOIS 60563-1198, US

(72) CARLISE, JOSEPH R. - LINDEMAN, OLGA E. S. - CONRAD, PETER G. - REED, PETER E. - VERVERS, LEONARD M.

(74) 1102

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073900 A1

(21) P090104004

(22) 16/10/09

(30) US 61/106464 17/10/08

(51) C07D 491/20, 495/20, 498/20, 491/10, 513/20, A61K 31/407, A61P 25/00

(54) COMPUESTOS DE ESPIRO-OXINDOL Y SU USO COMO AGENTES TERAPEUTICOS

(57) Compuestos de espiro-oxindol, como estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros de los mismos o mezclas de los mismos; o sales, solvatos o prodrugas farmacéuticamente aceptables de los mismos, para el tratamiento y/o la prevención de enfermedades o condiciones mediadas por canales de sodio, tal como el dolor.

Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque es de fórmula (1) en donde n es 1 ó 2; uno de J y K es $-\text{CH}_2-$ y el otro es $-\text{O}-$; o ambos J y K son cada uno $-\text{CH}_2-$; R^1 es hidrógeno, metilo, ciclopropilo, carboximetilo, (3-carboxi)bencilo, (3-metil-sulfonilamino)bencilo, [(3-metilsulfonilamino)piridin-2-il]metilo, [(3-carboxi)piridin-2-il]metilo, [(etoxi)carbonil]metilo, 2-ciclopropiletilo, 1,3-tiazol-5-ilmetilo, 3-metoxipropilo, (6-metilpiridin-2-il)metilo, piridin-3-ilmetilo, [3-(ciano)piridini-2-il]metilo, [3-(difluorometil)piridin-2-il]metilo, 3-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)bencilo, 4-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)bencilo, [5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]metilo, [5-(trifluorometil)-1,3,4-oxadiazol-2-il]metilo, [4-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, (4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)metilo, pirazin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, (1-metil-1H-benzotriazol-5-il)metilo, [2-(tert-butoxicarbonilamino)piridin-5-il]metilo, [6-(dimetilamino)piridin-3-il]metilo, [6-(dimetilamino)piridin-2-il]metilo, [6-[(difenilmetiliden)amino]piridin-2-il]metilo, (5-morfolin-4-ilpiridin-2-il)metilo, [5-(dimetilamino)piridin-2-il]metilo, (6-aminopiridin-2-il)metilo, (6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-il)metilo, (2-hidroxipirimidin-5-il)metilo, (1-metil-6-oxo-1,6-dihidropiridin-3-il)metilo, (6-aminopiridin-3-il)metilo, [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-6-ilmetilo, (5-hidroxipiridin-2-il)metilo, (5-

bromopiridin-2-il)metilo, hidrazinocarbonilmetilo, [6-desoxi-D-galactopiranosal]-6-ilo, (6-morfolin-4-ilpiridin-3-il)metilo, [3-(metilsulfonil)piridin-2-il]metilo, (4S)-2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il]metilo, (3-bromopiridin-2-il)metilo, [(2-imidoformamido)piridin-5-il]metilo, (6-cianopiridin-2-il)metilo, (6-aminocarbonilpiridin-2-il)metilo, difenilmetilo, 4-metoxibencilo, 2-(fluorometil)bencilo, 2-etoxietilo, 4-fluorofenilo, (2-fluorofenilaminocarbonil)metilo, 2-(2-metoxietoxi)etilo, 4-isoxazol-5-ilbencilo, 3-(benciloxi)propilo, (2S)-2,3-dihidroxi-propilo, 4-metoxibutilo, pentilo, isopentilo, hexilo, 3-nitrobencilo, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, [5-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, [(tert-butoxicarbonilamino)piridin-2-il]metilo, (3-(trifluorometil)piridin-2-il)metilo, (5-(trifluorometil)furan-2-il)metilo, tetrahidrofuran-2-ilmetilo, 3-metilbutilo, cianometilo, 4-hidroxibencilo, 3-cianobencilo, 4-fluoro-3-metoxibencilo, 4-cianobencilo, [6-(trifluorometil)piridin-3-il]metilo, [4-(trifluorometil)-1,3-tiazol-2-il]metilo, (3-fluoropiridin-2-il)metilo, (4-fluoropiridin-2-il)metilo, (5-fluoropiridin-3-il)metilo, (5-fluoropiridin-2-il)metilo, (3-cloropiridin-2-il)metilo, (3,5-difluoropiridin-2-il)metilo, (3-piridin-3-ilisoxazol-5-il)metilo, (2,2-difluorociclopropilo)metilo, 2-oxobutilo, 2,1,3-benzotiadazol-5-ilmetilo, 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilmetilo, 1,3-benzotiazol-2-ilmetilo, (1-metil-1H-benzimidazol-2-il)metilo, [2-(1-metiletil)-1,3-tiazol-4-il]metilo, tert-butoxicarbonilo, [1-(tert-butoxicarbonil)piperidin-4-il]metilo, (2-metoxipirimidin-5-il)metilo, (6-metoxipiridin-3-il)metilo, (1-oxidopiridin-2-il)metilo, (3-aminopiridin-2-il)metilo, piperidin-4-ilmetilo, [1-(1-metiletil)piperidin-4-il]metilo, (1-metilpiperidin-4-il)metilo, morfolin-2-ilmetilo, [4-(1-metiletil)morfolin-2-il]metilo, (4-metilmorfolin-2-il)metilo, (2S)-morfolin-2-ilmetilo, [(2S)-4-metilmorfolin-2-il]metilo, [5-(difluorometil)furan-2-il]metilo, tetrahidro-2H-piran-4-ilmetilo, tetrahidro-2H-piran-2-ilmetilo, (5-cloro-1-metil-1H-imidazol-2-il)metilo, (6-cloropiridin-2-il)metilo, (4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metilo, [(3-metilaminocarbonil)piridin-2-il]metilo, 1-[2-(aminoetil)aminocarbonil]piridin-3-il]metilo, piridin-2-ilmetilo, (2R)-1,4-dioxan-2-ilmetilo, 1,4-dioxan-2-ilmetilo, 3,4-dimetoxibencilo, 3,5-dimetoxibencilo, 3-hidroxi-propilo, 3-ftalimidopropilo, 3-aminobencilo, (3-aminocarbonil)bencilo, (4-aminocarbonil)bencilo, (3-N,N-dimetilaminocarbonil)bencilo, 4-(benciloxi)bencilo, 4-fluorobencilo, 2,3-difluorobencilo, 3,5-difluorobencilo, 2-cloro-4-fluorobencilo, [3-(2-fluorofenil)aminocarbonil]bencilo, 3-(metoxycarbonil)bencilo, 4-(metoxycarbonil)bencilo, 4-(etoxycarbonil)bencilo, 3-(dimetilamino-sulfonil)bencilo, 3-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)bencilo, 4-(3-amino-1H-pirazol-5-il)bencilo, 4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)bencilo, 3-(morfolin-4-il-sulfonil)bencilo, 2-(difluorometil)bencilo, (3-trifluorometoxi)bencilo, (2-fluoro-5-trifluorometil)bencilo, (2-trifluorometoxi)bencilo, S-(amino(hidroxiimino)metil)bencilo, 2-amino-2-(hidroxiimino)etilo, (6-(N'-hidroxiformimidamido)piridin-3-il)metilo, 2-(2,2,5-

trimetil-1,3-dioxan-2-il)etilo, (4-bencilmorfolin-2-il)metilo, [(2S)-4-bencilmorfolin-2-il]metilo, 2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetilo, [5-(trifluorometil)furan-2-il]metilo, 3-(trifluorometil)bencilo, [3-(trifluorometil)pirazin-2-il]metilo, [4-(trifluorometil)piridin-3-il]metilo, (5-metoxicarbonilfuran-2-il)metilo, 5-carboxifuran-2-ilmetilo, 5-(dimetilaminocarbonil)furan-2-ilmetilo, [2-(trifluorometil)piridin-3-il]metilo, metilcarbonilo, etoxicarbonilo, tert-butoxicarbonilo o [(3aR,5R,5aS,8aS,8bR)-2,2,7,7-tetrametil-tetrahidro-3aH-bis[1,3]dioxolo[4,5-b:4',5'-d]piran-5-il]metilo; cada R² es en forma independiente hidrógeno, hidroxilo, amino, (hexanilaminocarbonil)amino, (ciclopentilaminocarbonil)amino, bencilamino, (ciclohexilaminocarbonil)amino, metilsulfonilamino, (metil)carbonilamino, N-N-dimetilaminocarbonilamino, (etil)carbonilamino, (butil)carbonilamino, (tert-butil)carbonilamino, (pentanil)carbonilamino, (hexanil)carbonilamino, (metoximetil)carbonilamino, ciclobutilcarbonilamino, [2-metoxi(etoximetil)]carbonilamino, (metilsulfonil)amino, (2-trifluorometilfenil)carbonilamino, (ciclohexanil)carbonilamino, (ciclopentanil)carbonilamino, (ciclopropanil)carbonilamino, (fenil)carbonilamino, bromo, ciano, flúor, metilo, metoxi, hidroxycarbonilo, metilcarbonilo, pirrolidinilcarbonilo, aminocarbonilo, metilaminocarbonilo, (2-metoxietil)aminocarbonilo, (ciclopropil)aminocarbonilo, pentilaminocarbonilo, (ciclobutil)aminocarbonilo, (ciclopentil)aminocarbonilo, hexanilaminocarbonilo, (ciclohexil)aminocarbonilo, (4-fluorofenil)aminocarbonilo, (4-fluorobencil)aminocarbonilo, (piridin-2-ilmetil)aminocarbonilo, 2-(2-metoxietoxi)etoxi, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]oxilo, quinolinilo, fenoxicarbonilo, 2-oxocromenilo, 2-oxopirrolidinilo, morfolinilo, 2-oxopiridinilo, benciloxilo, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metoxi, piridin-2-ilmetoxi, piridin-2-iloxi, 4-(trifluorometil)fenoxi, 2-metil-1,3-tiazol-4-ilo, 2-amino-1,3-tiazol-4-ilo, 6-(dimetilamino)piridin-3-ilo, furan-3-ilo, 1H-pirazol-3-ilo, 1H-pirazol-4-ilo, 1-metil-1H-pirazol-4-ilo, 5-hidroxil-1H-pirazol-3-ilo, 5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-ilo, (6-metoxipiridin-3-il)oxi, 1,3-benzodioxol-5-iloxi, 4-fluorobenciloxi, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, fenoxi, 3-metoxifenoxi, 4-metoxifenoxi, 3-morfolin-4-ilfenoxi, 4-fluorofenoxi, 4-metoxifenilo o 4-fenoxifenilo; o dos R² adyacentes, junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos, forman un anillo tiazolilo fusionado, un anillo piridilo fusionado o un anillo dioxinilo fusionado; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 8: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (2) en donde cada R^{3a} es hidrógeno o flúor; R³ es hidrógeno, metilo, 3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, 2,5-dimetil-1-(1-metiletil)-1H-pirrol-3-il]metilo, (3-isopropilisoxazol-5-il)metilo, (4-bromo-2-tienil)metilo, 1-benzofuran-2-ilmetilo, [2-metil-5-(trifluorometil)-1,3-oxazol-4-

il]metilo, [5-(4-clorofenil)-2-(trifluorometil)furan-3-il]metilo, [5-cloro-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metilo, 5-metoxipiridin-3-ilo, 4-bromobencilo, [(2S)-5-oxopirrolidin-2-il]metilo, tert-butoxicarbonilo, cianometilo, [5-(trifluorometil)-2-furil]metilo, (5-cloro-2-tienil)metilo, (3-clorotiofen-2-il)metilo, [3-(2,6-diclorofenil)-5-metilisoxazol-4-il]metilo, {2-[4-(trifluorometil)fenil]-1,3-tiazol-4-il]metilo, (5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-il)metilo, [5-(4-clorofenil)-1,3,4-oxadiazol-2-il]metilo, [1,3]oxazolo[4,5-b]piridin-2-ilmetilo, (2-isopropil-1,3-tiazol-5-il)metilo, (2-isopropil-1,3-oxazol-5-il)metilo, 3-(tert-butoxicarbonilamino)-3-(ciclopropil)propilo, 4-(metilsulfanil)bencilo, 2-cianoetilo, (2-bromo-1,3-tiazol-5-il)metilo, [2-amino-4-(trifluorometil)-1,3-tiazol-5-il]metilo, (2-amino-1,3-tiazol-4-il)metilo, (5-clorotiofen-2-il)metilo, [2-(1-metiletil)-1,3-tiazol-4-il]metilo, (5-cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)metilo, (5-cloro-1,2,4-tiadiazol-3-il)metilo, 4-metoxibencilo, (2S)-1,4-dioxan-2-ilmetilo, (2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metilo, [2-(dimetilamino)-1,3-tiazol-5-il]metilo, (2-morfolin-4-il-1,3-tiazol-5-il)metilo, (2-piperidin-1-il-1,3-tiazol-5-il)metilo, (2-metoxi-1,3-tiazol-5-il)metilo, 2-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]etilo, [5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]metilo, (5-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metilo, [5-(difluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]metilo, (5-tert-butil-1,2,4-oxadiazol-3-il)metilo, [5-(1-metiletil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]metilo, (4-metilpiperazin-1-il)metilo, (3-metil-2-oxo-1,3-oxazolidin-5-il)metilo, 2-(1-(metiletil)aminocarbonilpiperidin-3-il)etilo, (4-cianotien-2-il)metilo, [5-trifluorometil-4-(metil)aminocarbonilfuran-2-il]metilo, (5-trifluorometil-4-aminocarbonilfuran-2-il)metilo, [5-trifluorometil-4-(dimetil)aminocarbonilfuran-2-il]metilo, [4-(ciclopropil)aminocarbonil-1,3-oxazol-2-il]metilo, (2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-5-il)metilo, o [4-(metiletil)aminocarbonil-1,3-oxazol-2-il]metilo; cada R⁴ es en forma independiente hidrógeno, cloro, bromo, trifluorometilo, ciano, 6-(dimetilamino)piridin-3-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo o furan-3-ilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 10: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (3) en donde m es 1 ó 2; uno de L y M es -CH₂- y el otro es -O-; R⁵ es hidrógeno, metilo, piridazin-4-ilmetilo, difenilmetilo, 4-metoxibencilo, 4-hidroxibencilo, (5-(trifluorometil)furan-2-il)metilo, tetrahidro-2H-piran-2-ilmetilo, tetrahidro-2H-piran-4-ilmetilo, tetrahidro-2H-piran-3-ilmetilo, (2-cloro-1-metil-1H-imidazol-5-il)-metilo, (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, (2S)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, tetrahidrofuran-3-ilmetilo, tetrahidrofuran-2-ilmetilo, 3-metilbutilo, pentilo, 5-(metoxicarbonil)furan-2-ilo, 1,4-dioxan-2-ilmetilo, [1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metilo, 4-metoxicarbonil-1,3-oxazol-2-ilo, 2-fluorobencilo, 4-fluorobencilo, bencilo, 4-fenilbencilo, (3-bromoisoxazol-5-il)metilo, (5-bromofuran-2-il)metilo, oxetan-2-ilmetilo, (1-etil-1H-imidazol-5-il)metilo, 3-cianobencilo, 4-cianobencilo, 4-(2-cianofenil)benci-

lo, 2-[(benciloxi)metoxi]propilo, 2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetilo, 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilmetilo, 2,1,3-benzotiadazol-5-ilmetilo, (4-bencilmorfolin-2-il)metilo, [1-(tert-butoxicarbonil)pirrolidin-3-il]metilo, [(2S)-1-(tert-butoxicarbonil)pirrolidin-2-il]metilo, [1-(tert-butoxicarbonil)piperidin-4-il]metilo, [5-(trifluorometil)furano-2-il]metilo, piridin-2-ilmetilo, 4-(metilsulfanil)bencilo, (2-metoxipiridin-5-il)metilo, (2R)-1,4-dioxan-2-ilmetilo, 2-(2-metoxietoxi)etilo, [(2S)-5-oxopirrolidin-2-il]metilo, 2-(2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il)etilo, 4-piridin-2-ilbencilo, pirimidin-2-ilmetilo, pirimidin-4-ilmetilo, pirazin-2-ilmetilo, (7-fluoro-1-benzofuran-2-il)metilo, piridazin-3-ilmetilo, (2-oxo-1,3-oxazolidin-5-il)metilo, 3-(benciloxi)bencilo, (1-metil-1H-benzimidazol-2-il)metilo, 2H-benzotriazol-2-ilmetilo, 2-metoxicarbonilbencilo, 4-metoxicarbonilbencilo, 3-(benciloxi)propilo, piperidin-4-ilmetilo, [1-(1-metiletil)piperidin-4-il]metilo, 1-etilpiperidin-4-il)metilo, (1-metilpiperidin-4-il)metilo, (2S)-pirrolidin-2-ilmetilo, 3-carboxibencilo, 2-carboxibencilo, 4-carboxibencilo, 4-(benciloxi)bencilo, 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencilo, 4-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)bencilo, (5-piridin-4-il)furano-2-il)metilo, 4-piridin-3-ilbencilo, (2'-fluorobifenil-4-il)metilo, 3-(5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)bencilo, 3-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencilo, 4-(5-metil-4H-1,2,4-triazol-3-il)bencilo, 3-hidroxipropilo, morfolin-2-ilmetilo, (4-metilmorfolin-2-il)metilo, [4-(1-metiletil)morfolin-2-il]metilo, 4-(1H-tetrazol-5-il)bencilo, 3-hidroxibencilo, 4-morfolin-4-ilbencilo, pirrolidin-3-ilmetilo, 1-[(1-metiletil)aminocarbonil]pirrolidin-3-il]metilo, [(2S)-1-metil-5-oxopirrolidin-2-il]metilo, 3-(ciclohexilamino)carbonilbencilo, 3-[(2-metoxietil)amino]carbonilbencilo, 3-[(hexil)(metil)amino]carbonilbencilo, 3-[(2-etilbutil)amino]carbonilbencilo, 3-[(2,4-dimetilfenil)amino]carbonilbencilo, 3-[(2-fenilpropil)amino]carbonilbencilo, 3-[(1S)-1-ciclohexiletil)amino]carbonilbencilo, 3-[(1R)-1-ciclohexiletil)amino]carbonilbencilo, 2-[(4-etilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-etilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2,4-dimetilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-metoxifenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-fluorofenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(3-clorofenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(3-fluoro-2-metilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(heptil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-clorobencil)amino]carbonilbencilo, 2-(piperidin-1-il)carbonilbencilo, 2-[(butil)amino]carbonilbencilo, 2-[(3-metilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-fluoro-5-metilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2,3-dimetilfenil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-(4-metoxifenil)etil)amino]carbonilbencilo, 2-[(3-clorobencil)amino]carbonilbencilo, 2-[(2-(4-clorofenil)etil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-metoxifenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-trifluorometilfenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(fenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(metil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-fluorofenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-tiofen-2-iletil)amino]carbonilbencilo, 4-

(amino)carbonilbencilo, 4-[(2,3-dihidro-1H-inden-5-il)amino]carbonilbencilo, 4-(morfolin-1-il)carbonilbencilo, 4-[(2-etilfenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2,6-dimetilfenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(3-fluorofenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2,4-dimetilfenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(tien-2-ilmetil)amino]carbonilbencilo, 4-[(etil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-metoxietil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-etoxietil)amino]carbonilbencilo, 4-[(ciclobutil)amino]carbonilbencilo, 4-[(1,3-tiazol-2-il)amino]carbonilbencilo, 4-[(3-fluoro-2-metilfenil)amino]carbonilbencilo, 4-[(2-etilbutil)amino]carbonilbencilo, (aminocarbonil)metilo, [(4-etilfenil)amino]carbonil]metilo, [(2,5-dimetilfenil)amino]carbonil]metilo, [(dietilamino)carbonil]metilo, [(3,3-dimetilbutilamino)carbonil]metilo, [(3-(1-metiletoxi)propilamino)carbonil]metilo, [(propilamino)carbonil]metilo, [(fenil)(metil)aminocarbonil]metilo, [(2,4-dimetilfenil)amino]carbonil]metilo, [(2,3-dimetilfenil)amino]carbonil]metilo, [(2,6-dimetilfenil)amino]carbonil]metilo, (5-carboxifurano-2-il)metilo, [5-(dimetilaminocarbonil)furano-2-il]metilo, [5-(metilaminocarbonil)furano-2-il]metilo, [4-(aminocarbonil)-1,3-oxazol-2-il]metilo, [4-[(dimetilamino)carbonil]-1,3-oxazol-2-il]metilo, 2-hidroxipropilo, (2S)-2-hidroxipropilo, 2-(benciloxi)propilo, 2-(4-fluorobenciloxi)propilo, 2-(piridin-2-iloxi)propilo, 3-hidroxibutilo, 4,4,4-trifluoro-3-hidroxibutilo, 3-aminopropilo, 3-oxopropilo, 3-[(3-metilbutil)amino]propilo, 3-[butil(metil)amino]propilo, 3-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]propilo, 3-[(2-trifluorometoxifenil)carbonilamino]propilo o 3-[(2-cianoetil)amino]propilo; y cada R⁶ es en forma independiente hidrógeno, cloro, bromo, fluoro, metilo, ciano, amino, -C(O)H, -CH₂-N(CH₃)₂, (pirrolidin-1-il)metilo, 6-(dimetilamino)piridin-3-ilo, 2-(4-fluorofenil)etenilo, dibenzo[b,d]tiofen-4-ilo, benzotiofen-3-ilo, 1-metil-1H-indol-5-ilo, 3,5-di(trifluorometil)fenilo, 4-fenoxifenilo, 4-(2-metilpropoxi)fenilo, 4-butoxifenilo, 4-metoxifenilo, pirimidin-5-ilo o furano-3-ilo; o dos R⁶, junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos, forman un anillo dioxinilo fusionado o un anillo piridinilo fusionado; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 15: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (4) en donde q es 1, 2 ó 3; R⁷ es hidrógeno, (5-cloro-2-tienil)metilo, 2-(2-metoxietoxi)etilo, difenilmetilo, 4-metoxibencilo, 3-metilbutilo, bencilo, 4-bromobencilo, 2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetilo, 2-(trifluorometil)bencilo, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, [5-(benciloxi)piridin-2-il]metilo, piperidin-4-ilmetilo, (1-metilpiperidin-4-il)metilo, (5-hidroxipiridin-2-il)metilo, [5-(trifluorometil)furano-2-il]metilo, (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, piridin-2-ilmetilo, piridin-3-ilmetilo, tetrahidro-2H-piran-4-ilmetilo, tetrahidro-2H-piran-2-ilmetilo, [1-(tert-butoxicarbonil)piperidin-4-il]metilo, 4-[(3R)-pirrolidin-3-ilamino]bencilo o 4-

metilpiperazin-1-il)metilo; y cada R⁸ es en forma independiente hidrógeno, hidroxilo, bromo, cloro, ciano, fluoro, metilo, trifluoroacetilo, metoxi, 1-metiletotoxi, 2-metoxietotoxi, benciloxi, 1-(tert-butoxicarbonil)pirrolidin-3-iloxi, pirrolidin-3-iloxi, amino, sulfonilamino, metilsulfonilamino, [(tert-butoxicarbonil)pirrolidin-3-il]amino, 6-metoxipiridin-3-ilo, 5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-ilo, amino(hidroxiimino)metilo o (pirrolidin-3-il)amino; o dos grupos R⁸, junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos, forman un anillo dioxinilo fusionado, un anillo tienilo fusionado, un anillo 1,1-dioxotienilo fusionado, un anillo 1,2,5-oxadiazolilo fusionado, un anillo tetrahidropirranilo fusionado, un anillo 2,3-dihidropirazinilo fusionado, un anillo 3-metil-4,5-dihidroisoxazolilo fusionado o un anillo pirazinilo fusionado, y el grupo R⁸ restante, si está presente, tiene los valores indicados precedentemente; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 19: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (5) en donde Z es -O- o -(NH)-; R¹⁰ es hidrógeno, 3-metilbutilo, 4-metoxibencilo, 2-(2-metoxietotoxi)etilo, 4-isoxazol-5-ilbencilo, 2-(trifluorometil)bencilo, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, [4-(hidroxicarbonil)oxazol-2-il]metilo, [4-(N,N-dimetilaminocarbonil)oxazol-2-il]metilo, (4-cianometilcarbonil)bencilo, [5-(trifluorometil)furan-2-il]metilo, (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, (3-fluoropiridin-2-il)metilo, [4-(metoxicarbonil)oxazol-2-il]metilo, 4-(3-amino-1H-pirazol-5-il)bencilo, piridin-2-ilmetilo, piridin-3-ilmetilo o pirazin-2-ilmetilo; y R^{10a} es hidrógeno, metilo o -NH₂; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 24: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (6) en donde Y es -O- o -S-; R¹¹ es hidrógeno, difenilmetilo, 3-metilbutilo, tetrahidro-2H-piran-4-ilmetilo, (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, piridin-2-ilmetilo o (5-cloro-1-metil-1H-imidazol-2-il)metilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 26: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (7) en donde W es un enlace directo o -CH₂- y R¹² es hidrógeno, difenilmetilo, o (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 31: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (8) en donde U es un enlace directo o -CH₂-; y R¹³ es hidrógeno, difenilmetilo, [5-(trifluorometil)furan-2-il]metilo, o (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 36: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (9); como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 38: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (10) en donde V es -O-, -N(CH₃)- o -CH₂- e Y es -N(CH₃)- o -CH₂-; o V es -N(CH₃)- o -CH₂- e Y es -O-, -N(CH₃)- o -CH₂-; y R¹⁴ es hidrógeno, [5-(trifluorometil)furan-2-il]metilo, piridin-2-ilmetilo, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo o (2R)-tetrahidrofuran-2-ilmetilo, como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 47: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (11) en donde R^{1a} es hidrógeno o (piridin-2-il)metilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

Reivindicación 49: Un compuesto caracterizado porque tiene la fórmula (12) en donde E es -O- o -CH₂-; J es -O- o -CH₂-; U es un enlace directo o -CH₂-; y R^{1b} es hidrógeno, [3-(trifluorometil)piridin-2-il]metilo, difenilmetilo, o [5-(trifluorometil)furan-2-il]metilo; como estereoisómero, enantiómero, tautómero de los mismos o sus mezclas; o una sal aceptable para uso farmacéutico, solvato o prodroga del mismo.

(71) XENON PHARMACEUTICALS, INC.

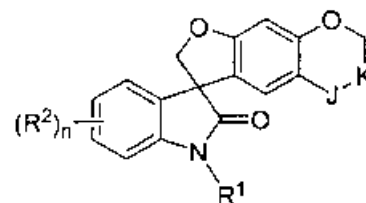
3650 GILMORE WAY, BURNABY, BRITISH COLUMBIA V5G 4W8, CA

(72) SUN, JIANYU - CHAFEEV, MIKHAIL - FU, JIANMIN - CHOWDHURY, SULTAN - LANGILLE, JONATHAN - FRASER, LAUREN - LIU, SHIFENG - SUN, SHAOYI - SVIRIDOV, SERGUEI - WOOD, MARK - ZENOVA, ALLA - JIA, QI - CADIEUX, JEAN-JACQUES - GAUTHIER, SIMON J. - DOUGLAS, AMY FRANCES - HSIEH, TOM - CHAKKA, NAGASREE - CIKOJEVIC, ZORAN

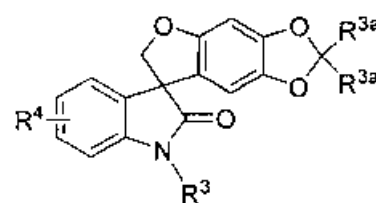
(74) 1102

(41) Fecha: 09/12/2010

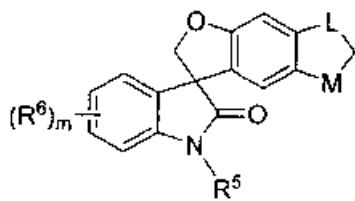
Bol. Nro.: 620



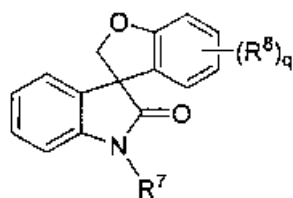
(1)



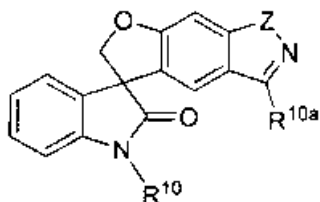
(2)



(3)



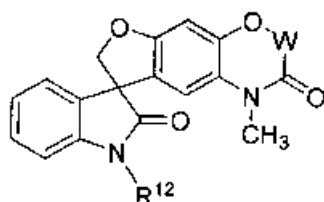
(4)



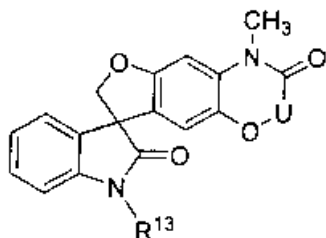
(5)



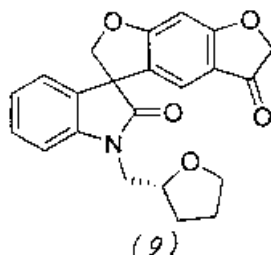
(6)



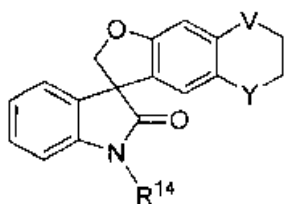
(7)



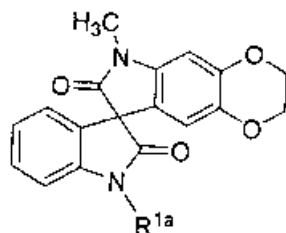
(8)



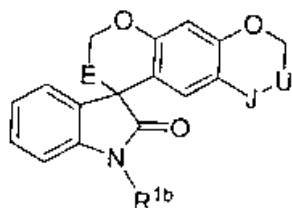
(9)



(10)



(11)



(12)

- (10) AR073901 A1
 (21) P090104005
 (22) 19/10/09
 (30) EP 08166933.5 17/10/08
 (51) A61K 31/4709, 9/06, A61P 31/04, 17/00
 (54) COMPOSICION TOPICA FARMACEUTICA, UNGÜENTO Y CREMAS QUE LA COMPRENDE, Y SUS USOS

(57) Reivindicación 1: Una composición farmacéutica tópica semisólida y estable, caracterizada porque comprende entre 0,2 y 5% de la composición de ozenoxacino, y un vehículo adecuado para elaborar un ungüento o una crema.

Reivindicación 4: Un ungüento conforme a la reivindicación 3, caracterizado porque el vehículo adecuado es la parafina blanda blanca.

Reivindicación 6: Una crema conforme a la reivindicación 5, caracterizada porque el vehículo incluye, en las proporciones consignadas a continuación, como componentes de la crema: emulsificadores: 15 - 25%; preferentemente 18 - 22%; en particular 20%; surfactantes: 10 - 20%; preferentemente 13 - 15%; en particular 14%; componentes de aceite: 5 - 15%; preferentemente 7 - 9%; en particular 8%; ceras de bajo punto de fusión: 1 - 10%; preferentemente 3 - 5%; en particular 4%; agua: 30 - 45%; preferentemente 35 - 40%; en particular 37,9%; componentes dispersables en agua: 10 - 20%; preferentemente 13 - 17%; en particular 15%; y conservantes que no donan formaldehído: 0,01 - 1%; preferentemente 0,05 - 0,15%; en particular 0,1%.

Reivindicación 8: Una crema conforme a cualquiera de las incorporaciones 5 a 7, caracterizada porque los surfactantes son glicéridos poliglicolizados de ácidos oleicos.

Reivindicación 9: Una crema conforme a cualquiera de las incorporaciones 5 a 8, caracterizada porque el componente de aceite es el dodecanol 2-octil alcohol Guerbet.

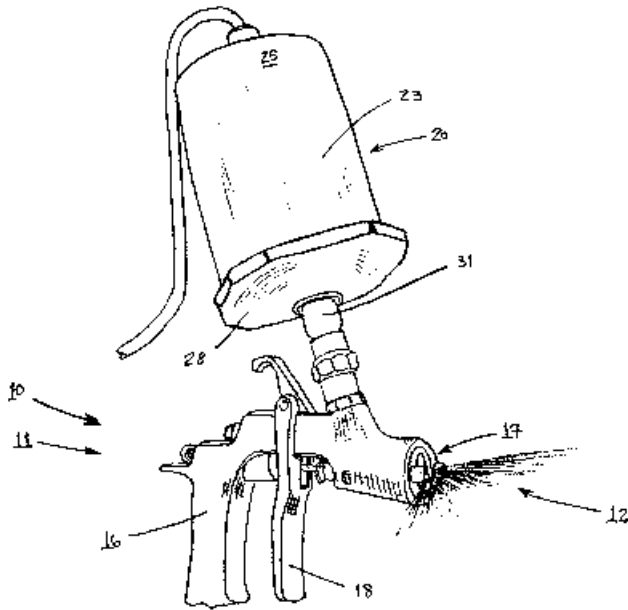
Reivindicación 12: Una crema conforme a cualquiera de las incorporaciones 5 a 11, caracterizada porque el conservante que no dona formaldehído es el ácido benzoico.

- (71) FERRER INTERNACIONAL, S.A.
 GRAN VIA CARLOS III, 94, E-08028 BARCELONA, ES
 (72) GUGLIETTA, ANTONIO - TARRAGO, CRISTINA - RAGA, MANUEL - SANTOS, BENJAMIN
 (74) 204
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073902 A1
 (21) P090104007
 (22) 19/10/09
 (30) US 61/106229 17/10/08
 (51) B05B 7/04
 (54) APLICADOR DE PINTURA
 (57) Se proporciona sistema para aplicar recubrimientos y, más específicamente, recubrimientos de pintura, que combina fluido almacenado en recipientes de

depósito separados antes de expulsar la mezcla para su aplicación. Los depósitos pueden estar compuestos por bolsas plegables y descartables que expulsan su fluido tras la activación de un accionador o cámara expansible. Los componentes del fluido se combinan y mezclan entre sí en una mezcladora que se ubica entre los depósitos y una boquilla.

- (71) THE SHERWIN-WILLIAMS COMPANY
101 W. PROSPECT AVENUE, CLEVELAND, OHIO 44115, US
(72) STAUNTON, THOMAS J. - BRAINARD, MICHAEL J. - BRAINARD, GREGORY A.
(74) 108
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073903 A1
(21) P090104008
(22) 19/10/09
(30) IN 2254/2008 20/10/08
(51) A61K 31/05, 31/045, A61P 31/00
(54) UNA COMPOSICION ANTIMICROBIANA
(57) La presente se refiere a una composición antimicrobiana. Se refiere particularmente a una composición antimicrobiana para la limpieza o el cuidado personal. Un objeto de la presente es proveer composiciones antimicrobianas que tengan una acción antimicrobiana relativamente rápida. Las composiciones que comprenden ingredientes seleccionados, a saber, timol y terpineol, en proporciones selectivas, proveen una acción antimicrobiana relativamente rápida en la higiene de las manos y en la higiene oral.
Reivindicación 1: Una composición antimicrobiana caracterizada porque comprende: a) 0,01 a 5% en peso de timol; b) 0,01 a 5% en peso de terpineol; y c) un vehículo.
Reivindicación 3: Una composición antimicrobiana de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindi-

cación 2, caracterizada porque comprende de 1 a 80% de tensoactivo.

Reivindicación 6: Una composición antimicrobiana de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizada porque dicho terpineol es seleccionado entre α -terpineol, β -terpineol, γ -terpineol o mezclas de los mismos.

- (71) UNILEVER N.V.
WEENA 455, 3013 AL ROTTERDAM, NL
(72) CHAKRABORTTY, AMIT - MEDEPALLI, SRILAXMI VENKATA
(74) 108
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073904 A1
(21) P090104010
(22) 19/10/09
(30) GB 0819182.7 20/10/08
(51) C07D 277/54, A61K 31/426, A61P 37/06
(54) FORMAS CRISTALINAS DE DERIVADOS DE TIAZOLIDINONA UTILES COMO INMUNOMODULADORES
(57) Se refiere a formas cristalinas de (R)-5-[3-cloro-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-benz[Z]ilideno]-2-([Z]-propilimino)-3-o-tolil-tiazolidin-4-ona, a procedimientos para la preparación de las mismas, a composiciones farmacéuticas que contienen dichas formas cristalinas, y a su uso como compuestos que mejoran la función vascular y como agentes inmunomoduladores, ya sea solos o en combinación con otros compuestos activos o terapias.

Reivindicación 1: Una forma cristalina del compuesto (R)-5-[3-cloro-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-benz[Z]ilideno]-2-([Z]-propilimino)-3-o-tolil-tiazolidin-4-ona que contiene de 0 a 2 equivalentes de H₂O por equivalente de (R)-5-[3-cloro-4-(2,3-dihidroxi-propoxi)-benz[Z]ilideno]-2-([Z]-propilimino)-3-o-tolil-tiazolidin-4-ona.

Reivindicación 7: Una forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizada por la presencia de picos en el diagrama de polvo con difracción de rayos X en los siguientes ángulos de refracción 2θ : 7,0°, 11,2°, y 12,6°, donde el diagrama de polvo por difracción de rayos X, se obtiene mediante el uso de radiación CuK_{α1} ($\lambda = 1,5406 \text{ \AA}$).

Reivindicación 8: Una forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y 5, caracterizada por la presencia de picos en el diagrama de polvo con difracción de rayos X en los siguientes ángulos de refracción 2θ : 10,5°, 22,2°, y 23,4°, donde el diagrama de polvo con difracción de rayos X se obtiene usando radiación CuK_{α1} ($\lambda = 1,5406 \text{ \AA}$).

Reivindicación 9: Una forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y 6, caracterizada por la presencia de picos en el diagrama de polvo con difracción de rayos X en los siguientes ángulos de refracción 2θ : 10,7°, 15,2°, y

22,4°, donde el diagrama de polvo con difracción de rayos X se obtiene usando radiación CuK α .

- (71) ACTELION PHARMACEUTICALS LTD.
GEWERBESTRASSE 16, CH-4123 ALLSCHWIL, CH
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

-
- (10) AR073905 A1
(21) P090104011
(22) 19/10/09
(30) US 61/107085 21/10/08
(51) C07K 16/08, 16/12, C12N 15/13, 15/63, C12P 21/02
(54) LIGANDOS QUE TIENEN ESPECIFICIDAD DE UNION POR DC-SIGN
(57) Dominio variable único de inmunoglobulina anti-no integrina de captura de ICAM-3 específica de células dendríticas (DC-SIGN; CD209). También se describen polipéptidos, ligandos y composiciones que comprenden tales dominios variables únicos de inmunoglobulina anti-DC SIGN junto con ácidos nucleicos que codifican tales inmunoglobulinas y vectores y células huésped para la expresión, formulaciones, composiciones y dispositivos que comprenden tales agentes de unión a DC-SIGN.
(71) DOMANTIS LIMITED
980 GREAT WEST ROAD, BRENTFORD, MIDDLESEX TW8 9GS, GB
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

-
- (10) AR073906 A1
(21) P090104014
(22) 19/10/09
(30) US 61/106889 20/10/08
(51) C07K 1/22, 7/04, G01N 33/493
(54) UN PROCEDIMIENTO PARA LA EXTRACCION Y/O PURIFICACION DE ERITROPOYETINA Y LIGANDOS PEPTIDICOS UTILIZABLES EN DICHO PROCEDIMIENTO
(57) Se describe un procedimiento para la extracción y/o purificación de eritropoyetina, que utiliza la técnica de cromatografía de afinidad. El procedimiento resulta ser útil en la extracción y/o purificación de eritropoyetina a partir de un sobrenadante de cultivo celular o a partir de orina, y comprende la utilización de péptidos inmovilizados sobre un soporte adecuado. El procedimiento es eficiente debido a la alta selectividad y afinidad que se establece entre la proteína y el péptido, conjugando los pasos de captura y purificación fina en un solo paso.
(71) CONSEJO NACIONAL DE INVESTIGACIONES CIENTIFICAS Y TECNICAS (CONICET)
AV. RIVADAVIA 1906, PISO 3º OF. "F", (1033) CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
UNIVERSIDAD NACIONAL DEL LITORAL
BOULEVARD PELLEGRINI 2750, (3000) SANTA FE, PROV. DE SANTA FE, AR

- (72) ETCHEVERRIGARAY, M. - ALBERICIO, F. - MARTINEZ CERON, M. C. - MARANI, M. M. - CAMPERI, S. A. - CASCONO, O.
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

-
- (10) AR073907 A1
(21) P090104015
(22) 19/10/09
(30) US 61/106889 20/10/08
(51) C07K 14/23, C12N 15/31, 15/79, 5/10, A61K 38/00
(54) ADYUVANTE PARA VACUNAS QUE COMPRENDE UN POLIPEPTIDO NO LIPIDADO DE LA MEMBRANA EXTERNA (Omp) DE BACTERIAS, VACUNAS QUE LO COMPRENDEN Y USOS
(57) Adyuvante para vacunas que comprende un polipéptido no lipidado de la membrana externa (Omp) de bacterias, en donde las bacterias pueden ser del género Brucella. El adyuvante puede ser un polipéptido modificado, o puede ser por ejemplo el polipéptido Omp19S o Omp16S, partes del mismo, o mezclas de ambos. En una realización preferida el adyuvante es el polipéptido no lipidado comprendido en la SEQ. ID. N° 1 o partes de la misma. En otra realización preferida el adyuvante es el polipéptido no lipidado comprendido en la SEQ. ID. N° 2 o partes de la misma.
(71) CONSEJO NACIONAL DE INVESTIGACIONES CIENTIFICAS Y TECNICAS (CONICET)
AV. RIVADAVIA 1906, PISO 3º OF. "F", (1033) CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
(72) CORIA, MIRTA L. - PASQUEVICH, KARINA A. - IBAÑEZ, ANDRES E. - GIAMBARTOLOMEI, GUILLERMO H. - CASSATARO, JULIANA
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

-
- (10) AR073908 A1
(21) P090104016
(22) 19/10/09
(30) US 61/106889 20/10/08
(51) A61K 31/047, 31/198, 47/38, A61P 27/02
(54) USO DE UNA COMPOSICION QUE COMPRENDE ERITRITOL, GLICEROL, CARNITINA Y UN VEHICULO ACUOSO PARA PREPARAR UNA COMPOSICION FARMACEUTICA UTIL PARA MEJORAR LA AGUDEZA VISUAL DE UNA PERSONA
(57) Uso de una composición que comprende eritritol, glicerol, carnitina y un vehículo acuoso para preparar una composición farmacéutica útil para mejorar la agudeza visual de una persona que necesita dicha mejora. Esta mejora se logra administrando en forma tópica a dicha persona, en una cantidad efectiva, una composición oftálmica que comprende un componente vehicular acuoso; y una cantidad efectiva de un componente de tonicidad que comprende un material seleccionado de una combinación de agentes solutos compatibles, en

donde la combinación de agentes solutos compatibles comprende dos componentes de polioles y un componente de aminoácido y en donde dichos componentes de polioles son eritritol y glicerol y dicho componente de aminoácido es carnitina.

Reivindicación 2: El uso de la reivindicación 1, caracterizado porque la persona padece el síndrome del ojo seco.

- (71) ALLERGAN, INC.
2525 DUPONT DRIVE, IRVINE, CALIFORNIA 92612, US
(74) 336
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

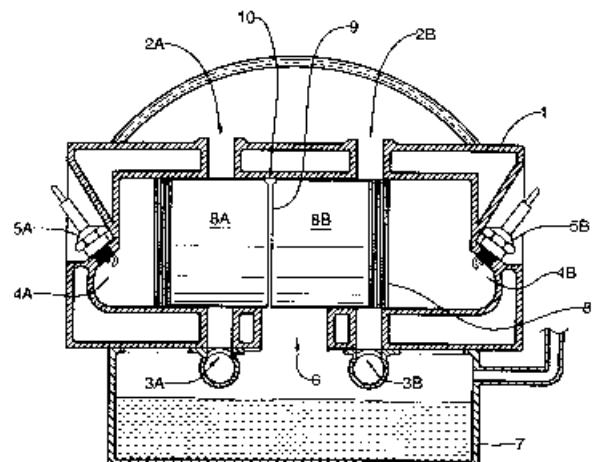
- (10) AR073909 A1
(21) P090104017
(22) 19/10/09
(30) US 61/198697 07/11/08
US 61/170369 17/04/09
(51) C07K 16/28, A61K 39/395, A61P 35/00
(54) ANTICUERPO AISLADO QUE SE ENLAZA AL DOMINIO EXTRACELULAR DEL RECEPTOR II DE TGF β HUMANO (TGF β RII), FRAGMENTO DE ENLACE A TGF β RII HUMANO Y COMPOSICION FARMACEUTICA QUE LO COMPRENDE
(57) Anticuerpos contra el receptor II del factor β del crecimiento de transformación humano (TGF β RII). Los anticuerpos se enlazan al dominio extracelular del receptor II de TGF β humano (TGF β RII) con un K_D de menos de 100 pM a temperatura ambiente (20-25°C). Composiciones farmacéuticas que comprenden estos anticuerpos y métodos para usar los anticuerpos, solos o en combinación, por ejemplo para tratar cáncer y fibrosis.
(71) IMCLONE LLC
180 VARICK STREET, NEW YORK, NEW YORK 10014, US
(74) 336
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073910 A1
(21) P090104018
(22) 19/10/09
(51) C12N 5/02, A61K 35/12
(54) TRATAMIENTO DE DIVERSAS ENFERMEDADES USANDO CELULAS ADULTAS MADURAS REPROGRAMADAS
(57) Un método de tratamiento de diversas enfermedades, trastornos o condiciones en pacientes usando células reprogramadas tales como células retrodiferenciadas, transdiferenciadas o rediferenciadas. El método comprende obtener células comprometidas del paciente, retrodiferenciar las células comprometidas para obtener células blanco retrodiferenciadas y administrar las células retrodiferenciadas al paciente. En determinadas realizaciones, el método comprende obtener células comprometidas del paciente, transdiferenciar las células compro-

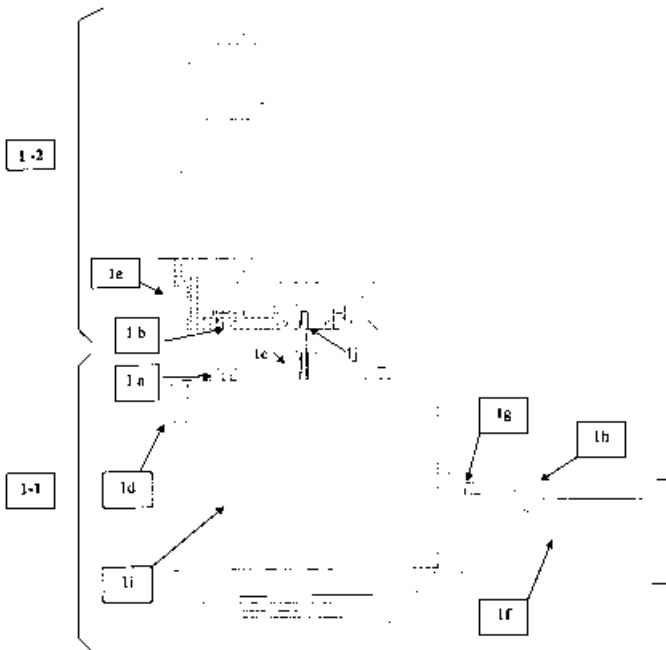
metidas para obtener células blanco transdiferenciadas y administrar las células blanco transdiferenciadas al paciente. Las células blanco retrodiferenciadas o transdiferenciadas reparan o reponen el tejido o las células en el paciente.

- (71) TRISTEM TRADING (CYPRUS) LIMITED
ARCH. MAKARIOU III, 2-4 CAPITAL CENTER, 9TH FLOOR, 1505 NICOSIA, CY
(72) ABULJADAYEL, ILHAM MOHAMED SALEH SAEED
(74) 465
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

- (10) AR073911 A1
(21) P090104019
(22) 19/10/09
(51) F01B 7/02, F16J 1/00
(54) PISTON DE DOBLE EFECTO
(57) Pistón de doble efecto conformado por dos cuerpos simétricos enfrentados, los cuales están ligeramente separados por un espacio que define un paso para la circulación de aire desde el correspondiente conducto conectado al múltiple de admisión hacia el depósito de aceite lubricante con la finalidad de ventilar el aceite lubricante contenido en dicho depósito y, consecuentemente, favorecer la adecuada lubricación y refrigeración del conjunto "cilindro-pistón". La circulación del aire de ventilación comienza a producirse en concordancia con llegada del pistón a cada punto máximo de compresión en ambos extremos del cilindro donde éste presenta los respectivos conductos de admisión y de retorno del aceite al depósito del mismo.
(71) COMPLETA, VINICIO
MITRE 986, BELEN DE ESCOBAR, PDO. DE ESCOBAR, PROV. DE BUENOS AIRES, AR
(72) COMPLETA, VINICIO
(74) 1010
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073912 A1
 (21) P090104020
 (22) 20/10/09
 (51) B25F 3/00, 5/00
 (54) HERRAMIENTA MOTORIZADA DE FUNCIONES MULTIPLES
 (57) Herramienta de múltiples funciones, del tipo manual, compuesta por dos elementos acoplables entre sí que comprende: a) un elemento o parte motora que cuenta con las características de conexión a la red de energía, motor, variador de velocidad, mango anatómico, ergonomía, un eje rotor que transmite movimiento y medios de acople, b) una pluralidad de elementos intercambiables, los cuales poseen en un extremo el medio de acople o unión a la parte motora, particularmente del tipo macho-hembra, para formar una unidad compacta y firme y en el otro extremo presentan medios para realizar distintas operaciones de taladrar, calar, lijar.
- (71) IRIDOY, IGNACIO
 MAYOR IRUSTA 2900, UF. 63, (1661) BELLA VISTA, PROV. DE BUENOS AIRES, AR
 (72) IRIDOY, IGNACIO
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

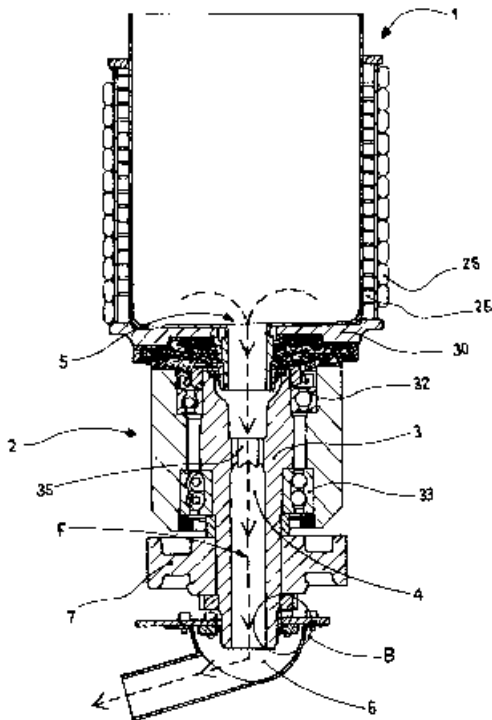


- (10) AR073913 A1
 (21) P090104053
 (22) 22/10/09
 (30) EP 08167084.6 21/10/08
 EP 08167090.3 21/10/08
 EP 08167108.3 21/10/08
 EP 08167156.2 21/10/08
 EP 08167206.5 22/10/08
 EP 08167211.5 22/10/08
 EP 08167268.5 22/10/08
 (51) C12N 15/32, A01H 5/00, 5/10, A01N 63/02

- (54) METODO PARA CONTROLAR PLAGAS Y/O AUMENTAR LA SALUD EN PLANTAS TRANS-GENICAS
 (57) Se provee semillas de plantas cultivadas, una composición que comprende un plaguicida, y uso de dicha composición para la producción de un producto agrícola.
Reivindicación 1: Un método para controlar plagas y/o aumentar la salud de las plantas de una planta cultivada en comparación con el respectivo control, que comprende la aplicación de un plaguicida a una planta con al menos una modificación, partes de dicha planta, material de propagación vegetal o a su locus de crecimiento, en donde el plaguicida se selecciona del grupo que consiste en metiram, mancozeb, tiofanato metilo, tiram, cimoxanilo, ferbam, maneb, ciflufenamid, dietofencarb, fenoxanilo, tecloftalam, flumetover, carpropamid, diclocimet, iodocarb, pencicuron, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, propineb, propamocarb, siltiofam, zineb y ziram.
- (71) BASF SE
 D-67056 LUDWIGSHAFEN, DE
 (74) 194
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620

- (10) AR073914 A1
 (21) P090104054
 (22) 22/10/09
 (30) PCT/IT2008/000666 27/10/08
 (51) A23G 9/12, 9/30
 (54) DISPOSITIVO PARA LA PREPARACION, EXPOSICION Y VENTA DE PRODUCTOS ALIMENTICIOS TERMICAMENTE TRATADOS, Y METODO DE LAVADO Y SANITIZACION DE DICHO DISPOSITIVO
 (57) Dispositivo para la preparación, exposición y venta de productos alimenticios térmicamente tratados, y método de lavado y sanitización de dicho dispositivo. Comprende por lo menos un recipiente cilíndrico (1) no removible, dentro del cual aloja, selectivamente removible, un medio impulsor (10) accionado en rotación por un eje motor (3), y por lo menos una serpentina rodeando externamente la superficie externa del recipiente dentro de la cual circula un fluido para tratamiento térmico. El dispositivo comprende por lo menos un drenaje (4), axialmente dispuesto dentro del eje motor (3), empleado para eliminar el fluido de lavado del mismo. Cuando el medio impulsor (10) es montado dentro del recipiente cilíndrico (1), el drenaje (4) es obstruido por el vástago (11) del medio impulsor, permitiendo las operaciones de preparación, exposición y venta. Cuando el medio impulsor (10) es retirado del dispositivo, el drenaje (4) se halla en comunicación fluidica con el recipiente cilíndrico (1) a través de una abertura (5), permitiendo el drenaje del fluido empleado durante las operaciones de lavado y sanitización del dispositivo.

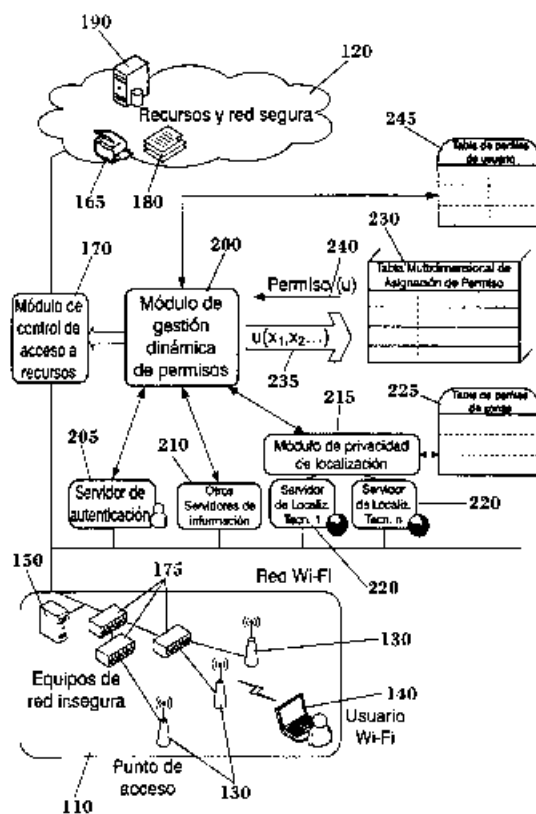
- (71) IDEA3A S.R.L.
VIA BRUNO BUOZZI, 67 / BIS, I-40043 CASTELMAGGIORE
(BOLOGNA), IT
(72) GROTTI, D. RENZO
(74) 472
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073915 A1
(21) P090104055
(22) 22/10/09
(30) ES P 200802990 22/10/08
(51) G06F 19/00
(54) PROCEDIMIENTO Y SISTEMA PARA CONTROLAR EL ACCESO A RECURSOS DE RED SEGUROS A TRAVES DE UNA RED INALAMBRI-CA, Y PROGRAMA DE ORDENADOR
(57) Procedimiento y sistema para controlar el acceso inalámbrico a recursos de red seguros basado en el contexto. Se obtiene (555, 570) información de la identidad de cada usuario que se conecta a través de un dispositivo inalámbrico (140) a partir de un proceso previo de autenticación e información relativa al contexto y/o el estado del usuario. Se genera (565, 580) un vector de características (235) para cada usuario, que está formado por la información relativa al contexto y/o al estado del usuario y un perfil de usuario. Se asignan (585) permisos a cada usuario, determinando el tipo de recursos de red seguros a los que se permite acceso a cada usuario, en función de su perfil de características y se realiza (595) un control de acceso a los recursos de red seguros, permitiendo la transferencia de datos sólo hacia/desde recursos permitidos para

cada usuario, en función de los permisos asignados.

- (71) TELEFONICA S.A.
GRAN VIA, 28, E-28013 MADRID, ES
(72) GARCIA GARCIA, LAURA - HERNANDEZ HER-
NANDEZ, ARIEL - LOPEZ GARCIA, JOSE
ENRIQUE - MUÑOZ ORGANERO, PEDRO LUIS
(74) 204
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620

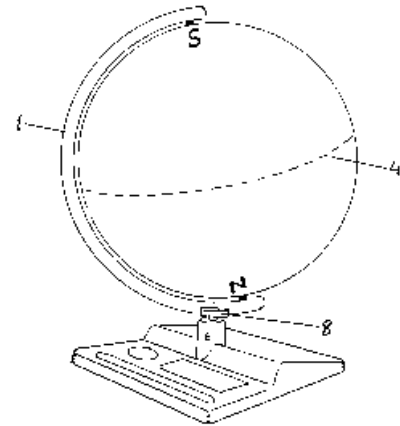
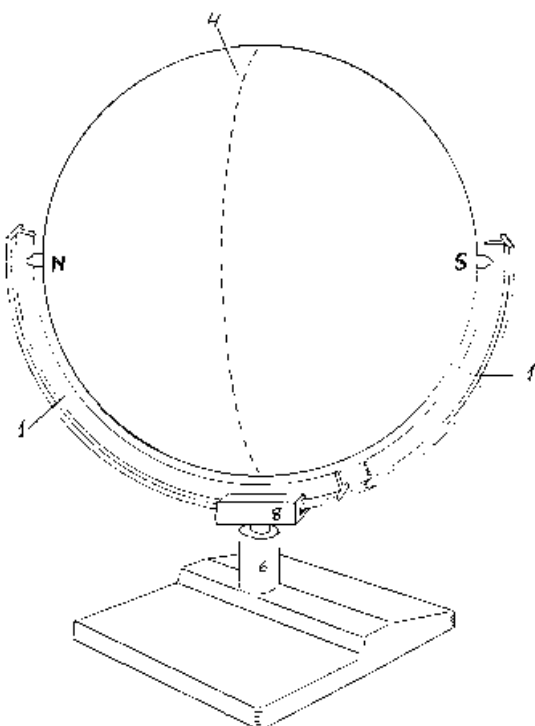
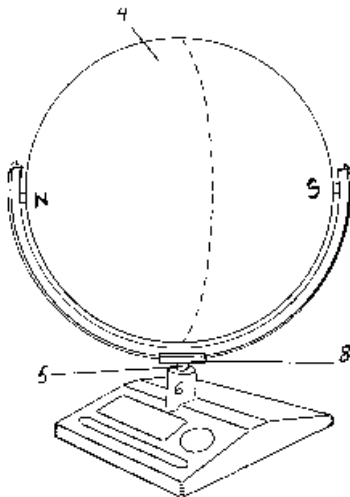


- (10) AR073916 A1
(21) P090104057
(22) 22/10/09
(51) G09B 27/08, A47G 29/00, F16M 11/14, 11/18, 11/04
(54) SOPORTE DESLIZANTE PARA INFINITAS POSI-CIONES, EN ESPECIAL PARA GLOBOS TERRAQUEOS
(57) Reivindicación 1: Soporte deslizante para infinitas posiciones, en especial para globos terráqueos del tipo formado por una estructura o arco soportante provisto de pernos ejes en sus extremos y de un perno eje solidario al mismo, perno eje éste que se inserta a libre giro en un buje ubicado en una base fija caracterizado por que el soporte deslizante consiste en un dispositivo en el que se proveen formas capaces de contener deslizablemente una estructura en forma de arco; ubicado este soporte en una base provista de un medio giratorio soportante del todo; el montaje en libre movimiento de los elementos permite movimientos rotatorios y unidireccionales en cualquier dirección y también mantener la posición fija que se elija.

Reivindicación 2: Soporte deslizante para infinitas posiciones, en especial para globos terráqueos caracterizado porque el arco en su sección transversal tiene preferentemente una forma en "T" calzando en el dispositivo en forma holgada capas de permitir su deslizamiento, estando previstos en el dispositivo puntos de contacto entre ambos capases de posicionarlo por su propia inercia gravitatoria.

Reivindicación 3: Soporte deslizante para infinitas posiciones, en especial para globos terráqueos caracterizado porque en los extremos del arco se ubican pernos ejes capaces de insertar en agujeros de la esfera del globo terráqueo que delimitan los extremos de un eje virtual que atraviesa por su centro el plano del ecuador.

- (71) RUIZ DIAZ, TEODORO ALBERTO
COMBATE DE LOS POZOS 1425, PISO 6º DTO. "B", (1245)
CDAD. AUT. DE BUENOS AIRES, AR
- (72) RUIZ DIAZ, TEODORO ALBERTO
- (41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073917 A1
(21) P090104058
(22) 22/10/09
(30) EP 08167451.7 23/10/08
EP 08170260.7 28/11/08
EP 09153967.6 27/02/09
(51) A61K 31/397, 31/351, A61P 31/00
(54) SINERGISMO ANTIBIOTICO
(57) La presente solicitud se refiere al sinergismo antibiótico de composiciones farmacéuticas que comprenden una defensina y un antibiótico betalactámico.

Reivindicación 3: La composición de acuerdo con la reivindicación 2, en la cual el primer y segundo compuesto antibacteriano exhibe un índice de FIC $\leq 0,5$ utilizando un organismo de prueba seleccionado entre el grupo integrado por *Streptococcus pneumoniae* ATCC49619, *Staphylococcus aureus* ATCC29213, *Staphylococcus aureus* ATCC34400, *Staphylococcus aureus* ATCC25923, y *Staphylococcus epidermidis* ATCC49134.

Reivindicación 4: La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 3, en la cual el primer compuesto antibacteriano se une al precursor de la pared celular bacteriana Lípido I y/o Lípido II.

Reivindicación 8: La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 7, en la cual la defensina comprende una secuencia de aminoácidos que tiene por lo menos 80% de identidad, con preferencia por lo menos 85% de identidad, con mayor preferencia por lo menos 90% de identidad, incluso con mayor preferencia por lo menos 95% de identidad, y muy preferentemente por lo menos 97% de identidad con la secuencia de aminoácidos de la SEC ID N° 1.

Reivindicación 9: La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 - 8, en la cual el segundo compuesto antibacteriano se selecciona entre el grupo integrado por penicilinas, cefalosporinas y aminoglicósidos.

Reivindicación 11: El uso de una composición farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las reivin-

dicaciones 1 - 10 para la elaboración de un medicamento para el tratamiento terapéutico de una infección bacteriana.

Reivindicación 12: El uso de acuerdo con la reivindicación 11, en el cual la infección bacteriana es causada por bacterias Gram-positivas.

Reivindicación 15: El uso de acuerdo con la reivindicación 14, en el cual la infección bacteriana es causada por bacterias Gram-positivas tales como *Streptococos* o *Estafilococos*.

(71) NOVOZYMES A/S

KROGSHOEJVEJ 36, DK-2880 BAGSVAERD, DK

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073918 A1

(21) P090104059

(22) 22/10/09

(30) US 61/108931 28/10/08

(51) A61K 31/122, A61P 19/02, 37/00

(54) COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE CONTIENEN DIACEREINA

(57) Una única formulación diaria de liberación controlada de diacereína para tratar enfermedades inflamatorias o autoinmunes o sus complicaciones, con efectos colaterales adversos reducidos, y métodos para tratar dichas enfermedades.

Reivindicación 2: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 1, donde la formulación es una formulación controlada por membrana, formulación de matriz o formulación de bomba osmótica.

Reivindicación 4: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 3, donde la formulación comprende un surfactante, un agente acidificante o un agente tamponante.

Reivindicación 7: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 3, donde la diacereína se forma como un complejo con ciclodextrinas.

Reivindicación 18: Una única formulación diaria de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende un primer activo de diacereína y un segundo ingrediente activo para tratar enfermedades inflamatorias, enfermedades autoinmunes o sus complicaciones.

Reivindicación 19: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 18, donde dicho segundo ingrediente activo es un inhibidor de la enzima convertidora de angiotensina, un bloqueador del receptor de angiotensina II, un fármaco antihiperglicémico o un fármaco antiinflamatorio no esteroideo.

Reivindicación 20: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende alrededor de 20,0% por peso de diacereína, alrededor de 20,0% por peso de hidroximetilpropilcelulosa, alrededor de 57,0% por peso de manitol, alrededor de 2,0% por peso de povi-

dona y alrededor de 1,0% por peso de estearato de magnesio.

Reivindicación 23: La formulación de liberación controlada de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende una capa activa, una capa pelicular de liberación sostenida y una capa pelicular de liberación retardada.

(71) ANCHEN LABORATORIES, INC.

9601 JERONIMO, IRVINE, CALIFORNIA 92618, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620

(10) AR073919 A1

(21) P090104060

(22) 22/10/09

(30) EP 08018514.3 23/10/08

(51) C07D 401/04, 401/12, 401/14, 471/10, 487/10, A61K 31/506, A61P 25/04

(54) DERIVADOS SUSTITUIDOS DE PIRIMIDINA Y TRIAZINA

(57) Medicamentos que comprenden estos compuestos, y al uso de derivados sustituidos de pirimidina y triazina en la preparación de medicamentos útiles para tratamiento del dolor, enfermedades respiratorias, inflamatorias intestinales, neurológicas, reumáticas.

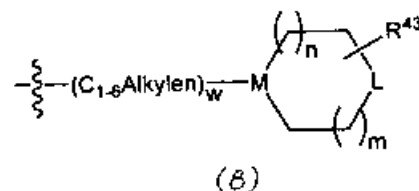
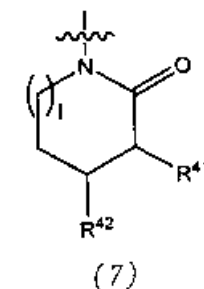
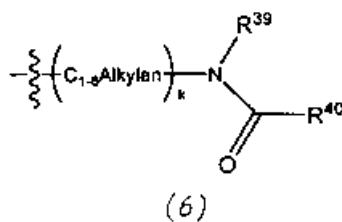
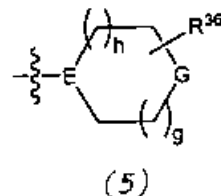
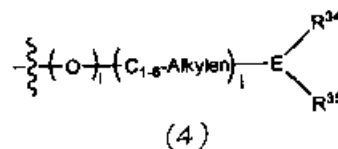
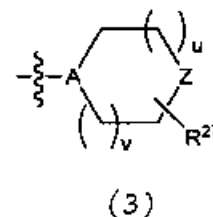
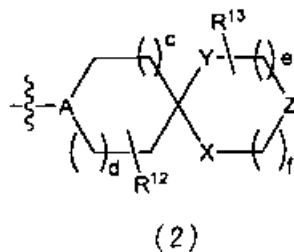
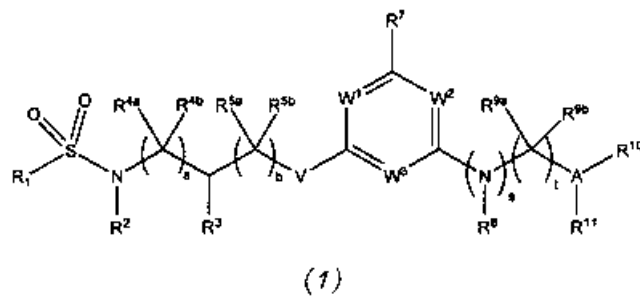
Reivindicación 1: Un compuesto de la fórmula general (1) donde a representa 0, 1 ó 2; b representa 0, 1 ó 2; R¹ representa arilo, heteroarilo CH(aril)₂, o un arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C₁₋₃; R² y R³ están definidos como se describen bajo (i) ó (ii); (i) R² representa H, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo; o R² significa un cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C₁₋₆, grupo alquilenilo C₂₋₆ o grupo alquinileno C₂₋₆; R³ representa Cl, H, F, Br, I, -CF₃, -OCF₃, OH, O-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₈, arilo heteroarilo; o R³ representa un cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C₁₋₆, grupo alquilenilo C₂₋₆ o grupo alquinileno C₂₋₆; (ii) R² y R³, juntos con el grupo -N-(CR^{4a}R^{4b})_a-CH- uniéndolos forman un heterociclo que puede ser sustituido en uno o más de los miembros de sus anillos de carbono por uno o más radicales seleccionados independientemente uno de otro desde el grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CF₃, =O, -SH, -O-alquilo C₁₋₆, alquilo C₁₋₆, (iii) cicloalquilo C₃₋₈, arilo, y heteroarilo y/o se pueden fusionar a un arilo o heteroarilo y/o dos de sus miembros de anillo de carbono se unen por un puente alquileo C₁₋₃, en que el heterociclo está saturado o al menos mono insaturado pero no es aromático, es de 4, 5, 6 ó 7 miembros y puede contener, en suma al heteroátomo N al cual está unido el radical R², uno o más heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente unos de otros desde el grupo que consiste de N, NR⁵⁰, O, S, S=O y S(=O)₂; en que el radical R⁵⁰ significa H, alquilo C₁₋₆, -C(=O)-R⁵¹, cicloalquilo C₃₋₈, arilo, heteroarilo, o heteroarilo unidos por un grupo

alquileo C_{1-3} y R^{51} significa alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-8} , arilo, heteroarilo, o un arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-3} ; V representa $C(R^{6a})(R^{6b})$, NR^{6c} , O ó una unión simple, donde R^{6c} representa un radical desde el grupo H, alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-8} , arilo, heteroarilo, o representa un cicloalquilo C_{3-8} , cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} , alquilenilo C_{2-6} o grupo alquilenilo C_{2-6} ; R^{4a} , R^{4b} , R^{5a} , R^{5b} , R^{6a} , R^{6b} independientemente uno de otro representan H, F, Cl, Br, I, $-CF_3$, $-OCF_3$, OH, SH, O-alquilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo; o representa un cicloalquilo C_{3-8} , arilo, o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} ; o grupo alquilenilo C_{2-6} ; y R^{6a} y R^{6b} pueden juntos adicionalmente representar =O; y/o R^{4a} y R^{4b} juntos con el átomo de carbono uniéndolos, forman un anillo saturado que es sustituido o no sustituido una o más veces, por ejemplo 1, 2, 3 ó 4 de sus miembros de anillo de carbono por uno o más, por ejemplo 1, 2, 3 ó 4 sustituyentes seleccionados independientemente unos de otros desde el grupo que consiste de F, CF_3 , alquilo C_{1-6} , O-alquilo C_{1-6} , OH, OCF_3 , arilo y heteroarilo en que los anillos de 3-, 4-, 5- ó 6- miembros y pueden contener uno o más, por ejemplo 1 ó 2 átomos de oxígeno; R^7 representa un sustituyente del grupo H, alquilo C_{1-6} , $-CN$, $-CF_3$, OH, alcoxi C_{1-6} , $-O-CF_3$; W^1 , W^2 y W^3 independientemente uno de otro representan N o CR^{60} , con la condición de que por lo menos dos W^1 , W^2 y W^3 representen N, y R^{60} representa H, alquilo C_{1-6} , halógeno, $-CN$, $-CF_3$, OH, alcoxi C_{1-6} , o $-O-CF_3$; s es 0 ó 1; t es 0, 1, 2 ó 3; R^8 representa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} ; R^{9a} y R^{9b} independientemente uno del otro representan H; F; Cl; OH; alquilo C_{1-6} ; O-alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C_{1-6} ; A representa N o CH, con la condición de que cuando s representa 0, A represente CH; y con la condición de que cuando s y t cada uno representa 0, A represente N; los radicales R^{10} y R^{11} , con la inclusión de A, representan un grupo espirocíclico o cíclico de una de las fórmulas generales (2) y (3) donde c, d, e, f, u y v cada una independiente de las otras significa 0, 1 ó 2; R^{12} , R^{13} y R^{27} cada uno independiente de las otras, representa desde 0 a 4 sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de cualquiera de los otros de F; Cl; OH; =O; alquilo C_{1-6} ; O-alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} ; y/o en cada caso dos de los 0 a 4 sustituyentes R^{27} juntos representan un puente alquileo C_{1-3} , de manera que el anillo mostrado en la fórmula general (3) asume una forma bicíclica de puente; y/o dos de los 0 a 4 sustituyentes R^{13} que son adyacentes forman un arilo fusionado o heteroarilo; y/o dos de los 0 a 4 sustituyentes R^{27} que son adyacentes forman un arilo fusionado o heteroarilo; X representa $CR^{14a}R^{14b}$, NR^{15} ó O; Y representa $CR^{16a}R^{16b}$, NR^{17} ó O; con la condición de que X no signifique NR^{15}

cuando Y signifique NR^{17} y con condición de que X e Y no signifiquen simultáneamente O; donde R^{14a} , R^{14b} , R^{16a} y R^{16b} cada uno independientemente de los otros representa H; F; Cl; OH; alquilo C_{1-6} ; O-alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C_{1-3} ; y/o en cada caso R^{14a} y R^{14b} juntos pueden representar =O y/o en cada caso R^{16a} y R^{16b} juntos pueden representar =O; R^{15} y R^{17} cada uno independientemente del otro representa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C_{1-6} ; Z en la fórmula general (2) representa $CR^{18a}R^{18b}$, NR^{19} ó O; o Z en la fórmula general (2), en el caso donde X representa O y f representa 0, significa $-(C(R^{124})-C(R^{125}))$, donde R^{124} y R^{125} , juntos con los átomos de carbono uniéndolos forman un arilo fusionado o heteroarilo; o Z en la fórmula general (2), en el caso donde X representa O y f representa 0, significa $=(N-(CR^{126}))$, donde el átomo N tiene una unión simple con el átomo O, y R^{126} representa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} ; Z en la fórmula general (3) representa $CR^{18a}R^{18b}$, NR^{19} , O, S, $S(=O)$ o $S(=O)_2$; donde R^{18a} representa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unido por un grupo alquileo C_{1-6} ; o R^{18a} representa un grupo de la fórmula general (4) donde i y j cada uno independientemente de la otra representa 0 ó 1; E representa N o CH, con la condición de que cuando i representa 1 y j representa 0, E representa CH; R^{34} y R^{35} cada uno independientemente uno del otro significa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; arilo, heteroarilo o cicloalquilo C_{3-8} unidos por un grupo alquileo C_{1-3} ; o R^{34} y R^{35} , con la inclusión de E, forman un arilo o heteroarilo de 5- ó 6- miembros; o R^{34} y R^{35} , con la inclusión de E, forman un heterociclo saturado de la fórmula general (5), donde h y g independientemente uno del otro significa 0, 1 ó 2; G representa $CR^{37a}R^{37b}$, NR^{38} , O, S, $S=O$ ó $S(=O)_2$, con la condición de que cuando E representa CH, G no represente $CR^{37a}R^{37b}$; R^{36} representa de 0 a 4 sustituyentes cada uno seleccionado independientemente de cualquier otro desde F; Cl; Br; I; OH; SH; =O; O-alquilo C_{1-6} ; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C_{1-6} ; y/o dos sustituyentes R^{36} adyacentes juntos representan un arilo o heteroarilo fusionado; R^{37a} y R^{37b} cada uno independientemente del otro significa H; F; Cl; Br; I; OH; SH; =O; O-alquilo C_{1-6} ; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C_{3-8} , arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C_{1-6} ; R^{38} representa H; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; arilo o heteroarilo; arilo, heteroarilo o cicloalquilo C_{3-8} unidos por un grupo alquileo C_{1-3} ; donde R^{18b} representa H; OH; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-8} ; O-alquilo C_{1-6} ; O-(cicloalquilo C_{3-8}); (alquileo C_{1-6})-O-alquilo C_{1-6} ; (alquileo C_{1-6})-O-(cicloalquilo C_{3-8}); arilo o heteroarilo; O-arilo o O-heteroarilo; arilo, O-arilo, heteroarilo

o O-heteroarilo unidos por alquileo C₁₋₆; o R^{18b} representa un grupo de la fórmula general (6), donde k representa 0 ó 1; R³⁹ representa H; alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C₁₋₃; R⁴⁰ representa alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo o heteroarilo, cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C₁₋₆; o R³⁹ y R⁴⁰, junto con el grupo N-C(=O) uniéndolos forman un anillo de la fórmula general (7) donde l representa 0, 1 ó 2; y R⁴¹ y R⁴², junto con los átomos de carbono uniéndolos forman un arilo fusionado o heteroarilo; donde R¹⁹ representa H; o (P)_z-R²², donde z representa 0 ó 1; P representa (C=O), S(=O)₂ ó C(=O)-N(R²⁴); donde el átomo de nitrógeno en el grupo C(=O)-N(R²⁴) está unido a R²²; donde R²⁴ representa H; alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo, heteroarilo o cicloalquilo C₃₋₈ unidos por un grupo alquileo C₁₋₃; R²² representa alquilo C₁₋₆, arilo o heteroarilo; arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C₁₋₆; o R²² representa un grupo de la fórmula general (8) donde n representa 0, 1 ó 2; m representa 0, 1 ó 2; w representa 0 ó 1; M representa CH o N; con la condición de que cuando P representa C(=O)-NR²⁴ y w representa 0, M representa CH; y con la condición de que cuando z y w simultáneamente representen 0, M representa CH; L representa CR^{44a}R^{44b}, NR⁴⁵, O, S, S=O o S(=O)₂; R⁴³ representa de 0 a 4 sustituyentes cada uno seleccionado independientemente uno de otros de F; Cl; OH; O; alquilo C₁₋₆; O-alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C₁₋₆; y/o dos de los 0 a 4 radicales R⁴³ que son adyacentes juntos representan un arilo fusionado o heteroarilo; R^{44a} y R^{44b} cada uno independientemente del otro representa H; F; Cl; Br; I; OH; alquilo C₁₋₆; O-alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo o heteroarilo; cicloalquilo C₃₋₈, arilo o heteroarilo unidos por un grupo alquileo C₁₋₆; o R^{44a} y R^{44b} juntos pueden representar =O; R⁴⁵ representa H; alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₈; arilo o heteroarilo; arilo, heteroarilo o cicloalquilo C₃₋₈ unidos por un grupo alquileo C₁₋₆; donde los radicales antes mencionados alquilo C₁₋₆, alquileo C₁₋₃, alquileo C₁₋₆, alquilenilo C₂₋₆, alquilenilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₈, arilo y heteroarilo pueden en cada caso ser no sustituidos o mono o poli sustituidos por radicales idénticos o diferentes; los radicales antes mencionados alquilo C₁₋₆, alquileo C₁₋₃, alquileo C₁₋₆, alquilenilo C₂₋₆ y alquilenilo C₂₋₆ pueden ser en cada caso ramificados o no ramificados; en la forma de un enantiómero individual o un diastereoisómero individual, del racemato de los enantiómeros de los diastereoisómeros, mezclas de los enantiómeros y/o diastereoisómeros, tal como en cada caso en la forma de sus bases y/o sales fisiológicamente aceptables.

- (71) GRÜNENTHAL GMBH
ZIEGLERSTRASSE 6, D-52078 AACHEN, DE
(74) 195
(41) Fecha: 09/12/2010
Bol. Nro.: 620



- (10) AR073920 A1
(21) P090104073
(22) 22/10/09
(30) EP 08167440.0 23/10/08
(51) C07D 451/06, 451/04, 495/04, A61K 31/46, A61P 3/04, 3/06, 3/10
(54) DERIVADOS UREA DE NORTROPANOS SUSTI-

TUIDOS, MEDICAMENTOS QUE CONTIENEN DICHS COMPUESTOS, SU USO EN EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES MEDIADAS POR LA INHIBICION DE LA ENZIMA 11 β -HIDROX- IESTEROIDE DESHIDROGENASA Y PROCESO PARA SU PREPARACION

- (57) Particularmente, los compuestos son inhibidores de la 11 β -hidroxiesteroide deshidrogenasa (HSD) 1 y por lo tanto son adecuados para el tratamiento y la prevención de enfermedades que pueden estar influenciadas por la inhibición de esta enzima, tales como enfermedades metabólicas, en particular diabetes tipo 2, obesidad y dislipidemia. Se provee además, un proceso para la obtención del mismo.
- Reivindicación 1: Compuestos caracterizados porque tienen la fórmula (1) en la que R¹ representa arilo o heteroarilo, mientras que por arilo se entiende fenilo o naftilo, y heteroarilo representa pirrolilo, furanilo, tienilo, piridinilo, indolilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, quinolinilo, isoquinolinilo, o pirrolilo, imidazolilo, furanilo, tienilo, piridinilo en cada uno de lo cuales uno o dos grupos CH están reemplazados por N, o indolilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, quinolinilo o isoquinolinilo donde, en cada uno de ellos de 1 a 3 grupos CH son reemplazados por N, mientras que en el N anteriormente mencionado, incluyendo los grupos heteroarilo, uno o dos grupos -N=CH- son opcionalmente reemplazados por -NH-CO- y/o -N(alquilo C₁₋₄)-CO-, y mientras que los grupos heteroarilo y arilo policíclico anteriormente mencionados opcionalmente están parcialmente saturados, aunque retienen una subestructura aromática o heteroaromática unida al grupo carbonilo en la fórmula (1), en la que en los anillos parcialmente saturados uno o dos grupos CH opcionalmente están reemplazados, independientemente entre sí, por O, S, NH, N(alquilo C₁₋₄), carbonilo o sulfonilo, donde los grupos arilo, heteroarilo, arilo y heteroarilo parcialmente saturados antes mencionados están opcionalmente sustituidos con uno o más, preferiblemente uno a cuatro sustituyentes R², donde todos los grupos heteroarilo están unidos a la estructura de nortropano de fórmula (1) mediante un átomo de carbono; R^N, independientemente entre sí, representan hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₃₋₆, alquinilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, (het)arilo, alquilcarbonilo C₁₋₄, alquiloxicarbonilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, (het)arilcarbonilo, (het)arilsulfonilo, donde cada grupo alquilo, alqueno y alquino opcionalmente está además mono o polisustituido con flúor, y está opcionalmente monosustituido con hidroxilo, alcoxi C₁₋₄, alquilsulfanilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, amino, alquilamino C₁₋₄, di-(alquilo C₁₋₄)amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, ciano, carboxilo, alcoxycarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₄, di-(alquilo C₁₋₄)aminocarbonilo o (het)arilo; R², independientemente entre sí, representan halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, tetrahidrofuran-3-ilo, tetrahidropiran-3-ilo, tetrahidropiran-4-ilo, tetrahidrofuranil-alquilo C₁₋₃, tetrahidropiranil-alquilo C₁₋₃, (het)arilo,

(het)ariloxi, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, alquilo C₁₋₆, alquilamino C₁₋₆, donde en cada grupo un grupo CH₂ está opcionalmente reemplazado por carbonilo o sulfonilo, y donde cada grupo está opcionalmente mono o polifluorado, y donde cada grupo está opcionalmente sustituido adicionalmente con hidroxilo, cloro, alquilo C₁₋₃, amino, alquilamino C₁₋₃, di-(alquilo C₁₋₃)amino, pirrolidin-1-ilo, 2-oxo-pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, 2-oxo-piperidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, 3-oxo-morfolin-4-ilo, piperazin-1-ilo, 2-oxo-piperazin-1-ilo, 3-oxo-piperazin-1-ilo, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, 2-oxo-4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, 3-oxo-4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, carboxilo, alquiloxicarbonilo C₁₋₃, ciano, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₃, di-(alquilo C₁₋₃)aminocarbonilo, pirrolidin-1-ilcarbonilo, piperidin-1-ilcarbonilo, morfolin-4-ilcarbonilo, piperazin-1-ilcarbonilo, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilcarbonilo, alquilo C₁₋₄-carbonilamino, N-(alquilo C₁₋₃)alquilcarbonilamino C₁₋₄, arilcarbonilamino, alquilsulfanilo C₁₋₃, alquilsulfonilo C₁₋₃, alquilsulfonilo C₁₋₃, cicloalquilo C₃₋₆, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, (het)arilo o (het)ariloxi, amino, di-(alquilo C₁₋₃)amino, pirrolidin-1-ilo, 2-oxo-pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, 2-oxo-piperidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, 3-oxo-morfolin-4-ilo, piperazin-1-ilo, 2-oxo-piperazin-1-ilo, 3-oxo-piperazin-1-ilo, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, 4-(alquilcarbonil C₁₋₄)piperazin-1-ilo, 4-(cicloalquilcarbonil C₃₋₆)piperazin-1-ilo, 4-(alquiloxicarbonil C₁₋₄)piperazin-1-ilo, 4-(alquilsulfonil C₁₋₄)piperazin-1-ilo, 2-oxo-4(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, 3-oxo-4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilo, (het)arilcarbonilamino, alquiloxicarbonilamino C₁₋₄, aminocarbonilamino, alquilo C₁₋₄-aminocarbonilamino (het)arilaminocarbonilamino, di-(alquilo C₁₋₃)aminocarbonilamino, pirrolidin-1-ilcarbonilamino, piperidin-1-ilcarbonilamino, morfolin-4-ilcarbonilamino, piperazin-1-ilcarbonilamino, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilcarbonilamino, aminosulfonilamino, alquilaminosulfonilamino C₁₋₃, di-(alquilo C₁₋₃)amino-sulfonilamino, pirrolidin-1-ilsulfonilamino, piperidin-1-ilsulfonilamino, morfolin-4-ilsulfonilamino, piperazin-1-ilsulfonilamino, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilsulfonilamino, (alquiloxicarbonilamino C₁₋₃)carbonilamino, (het)arilsulfonilamino, N-(alquilo C₁₋₃)alquilcarbonilamino C₁₋₄, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilcarbonilamino, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilalquilcarbonilamino C₁₋₃, N-(alquilo C₁₋₃)alquiloxicarbonil C₁₋₃amino, N-(aminocarbonilo)-alquilamino C₁₋₃, N-(alquilamino C₁₋₃carbonil)-alquilamino C₁₋₃, N-[di-(alquilo C₁₋₃)aminocarbonil]-alquilamino C₁₋₃, N-(alquilo C₁₋₃)alquilsulfonilamino C₁₋₃, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilsulfonilamino, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilalquilsulfonilamino C₁₋₃, carboxilo, alquiloxicarbonilo C₁₋₃, aminocarbonilo, alquilamino C₁₋₃carbonilo, di(alquilo C₁₋₃)aminocarbonilo, azetidín-1-ilcarbonilo, pirrolidin-1-ilcarbonilo, piperidin-1-ilcarbonilo, morfolin-4-ilcarbonilo, piperazin-1-ilcarbonilo, 4-(alquilo C₁₋₃)piperazin-1-ilcarbonilo, (het)arilaminocarbonilo, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilaminocarbonilo, (het)arilalquilaminocarbonilo C₁₋₃, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)arilalquilaminocarbonilo C₁₋₃, (het)arilcarbonilo, alquilsulfanilo C₁₋₃, alquilsulfonilo C₁₋₃, (het)arilsulfonilo, tritluo-

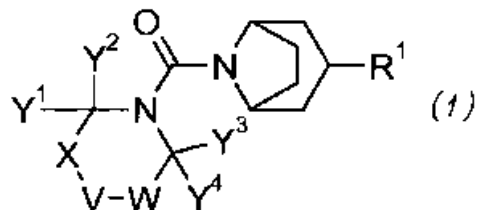
rometilsulfanilo, trifluorometilsulfinito, aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-aminosulfonilo, pirrolidin-1-il-sulfonilo, piperidin-1-ilsulfonilo, morfolin-4-ilsulfonilo, piperazin-1-ilsulfonilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilsulfonilo, en donde todos los anillos heterocicloalquilo y cicloalquilo saturados anteriormente mencionados están opcionalmente sustituidos con uno o dos grupos independientemente seleccionados entre flúor, alquilo C₁₋₃, alcoxi C₁₋₃, alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₃ e hidroxilo; V es CY⁵Y⁶, O ó NR^N; W está ausente o es CY⁷Y⁸ o (CY⁷Y⁸)-(CY⁹Y¹⁰); X está ausente o es CY¹¹Y¹² o (CY¹¹Y¹²)-(CY¹³Y¹⁴); V y W pueden también combinarse para formar un grupo cicloalquilo C₃₋₆ que está hibridado vía dos átomos de carbono adyacentes al aza-ciclo y en donde uno o dos grupos CH₂ están opcionalmente reemplazados, independientemente entre sí por O, S, NR^N, carbonilo o sulfonilo y que opcionalmente está parcialmente insaturado y opcionalmente mono- o polisustituido, preferiblemente mono a tetrasustituido, con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de R³; V y W pueden también combinarse para formar un grupo (het)arilo hibridado mediante dos átomos de carbono adyacentes al aza-ciclo; R³ representa halógeno, alquilo C₁₋₄, ciano, carboxi, alquiloxicarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-aminocarbonilo, hidroxilo, alcoxi C₁₋₄, amino, alquilamino C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, N-alquil C₁₋₃-alquil C₁₋₄-carbonilamino y (het)arilo, donde cada grupo alquilo anteriormente mencionado está opcionalmente mono o poli sustituido con flúor, y opcionalmente monosustituido con hidroxilo, alcoxi C₁₋₄, alquilsulfanilo C₁₋₄, alquilsulfinito C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, amino, alquilamino C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, ciano, carboxi, alcoxi C₁₋₄-carbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₄, di-(alquil C₁₋₄)-aminocarbonilo o (het)arilo; Y¹ a Y¹⁴, que pueden ser idénticos y/o diferentes, independientemente entre sí, representan hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, tetrahidrofuran-3-iloxi, tetrahidropiran-3-iloxi, tetrahidropiran-4-iloxi, tetrahidrofuranil-alquilo C₁₋₃, tetrahidropiranil-alquilo C₁₋₃, (het)arilo, (het)ariloxi, alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, alquilo C₁₋₆, alquilamino C₁₋₆, donde en cada grupo, un grupo CH₂ está opcionalmente reemplazado por carbonilo o sulfonilo, y donde cada grupo está opcionalmente sustituido adicionalmente con hidroxilo, cloro, alquilo C₁₋₃, amino, alquil C₁₋₃-amino, di-(alquil C₁₋₃)-amino, pirrolidin-1-ilo, 2-oxo-pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, 2-oxo-piperidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, 3-oxo-morfolin-4-ilo, piperazin-1-ilo, 2-oxo-piperazin-1-ilo, 3-oxo-piperazin-1-ilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, 2-oxo-4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, 3-oxo-4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, carboxi, alquilo C₁₋₃-carbonilo, ciano, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-aminocarbonilo, pirrolidin-1-ilcarbonilo, piperidin-1-ilcarboni-

lo, morfolin-4-ilcarbonilo, piperazin-1-ilcarbonilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilcarbonilo, alquilcarbonil C₁₋₃-amino, (het)arilcarbonilamino, alquilsulfanilo C₁₋₃, alquilsulfinito C₁₋₃, alquil C₁₋₃-sulfonilo, cicloalquilo C₃₋₆, (het)arilo o (het)ariloxi; amino, di-(alquil C₁₋₃)-amino, pirrolidin-1-ilo, 2-oxo-pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, 2-oxo-piperidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, 3-oxo-morfolin-4-ilo, piperazin-1-ilo, 2-oxo-piperazin-1-ilo, 3-oxo-piperazin-1-ilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, 4-(alquilcarbonil C₁₋₄)-piperazin-1-ilo, 4-(cicloalquilcarbonil C₃₋₆)-piperazin-1-ilo, 4-(alquilo C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, 2-oxo-4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, 3-oxo-4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilo, (het)arilcarbonilamino, alquiloxicarbonilamino C₁₋₄, aminocarbonilamino, alquil C₁₋₄-aminocarbonilamino, (het)arilaminocarbonilamino, di-(alquil C₁₋₃)-aminocarbonilamino, pirrolidin-1-il-carbonilamino, piperidin-1-ilcarbonilamino, morfolin-4-il-carbonilamino, piperazin-1-ilcarbonilamino, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilcarbonilamino, aminosulfonilamino, alquilaminosulfonilamino C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-aminosulfonilamino, pirrolidin-1-ilsulfonilamino, piperidin-1-ilsulfonilamino, morfolin-4-ilsulfonilamino, piperazin-1-ilsulfonilamino, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilsulfonilamino, (alquiloxicarbonilamino C₁₋₃)-carbonilamino, (het)arilsulfonilamino, N-(alquil C₁₋₃)-alquilcarbonilamino C₁₋₃, N-(alquil C₁₋₃)-(het)arilcarbonilamino, N-(alquil C₁₋₃)-(het)aril-alquilcarbonilamino C₁₋₃, N-(alquil C₁₋₃)-alquiloxicarbonil C₁₋₃-amino, N-(aminocarbonilo)-alquilamino C₁₋₃, N(alquilamino C₁₋₃-carbonil)-alquilamino C₁₋₃, N-[di-(alquil C₁₋₃)-aminocarbonil]-alquilamino C₁₋₃, N-(alquil C₁₋₃)-alquilsulfonilamino C₁₋₃, N-(alquil C₁₋₃)-(het)arilsulfonilamino, N-(alquil C₁₋₃)-(het)aril-alquilsulfonilamino C₁₋₃, carboxi, alquiloxicarbonilo C₁₋₃, aminocarbonilo, alquilamino C₁₋₃-carbonilo, di(alquil C₁₋₃)-aminocarbonilo, azetidín-1-ilcarbonilo, pirrolidin-1-ilcarbonilo, piperidin-1-il-carbonilo, morfolin-4-ilcarbonilo, piperazin-1-ilcarbonilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-il-carbonilo, (het)arilaminocarbonilo, N-(alquilo C₁₋₃)-(het)aril-aminocarbonilo, (het)aril-alquilaminocarbonilo C₁₋₃, N-(alquil C₁₋₃)-(het)aril-alquilaminocarbonilo C₁₋₃, (het)arilcarbonilo, alquilsulfanilo C₁₋₃, alquilsulfinito C₁₋₃, (het)arilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinito, aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)-aminosulfonilo, pirrolidin-1-il-sulfonilo, piperidin-1-ilsulfonilo, morfolin-4-ilsulfonilo, piperazin-1-ilsulfonilo, 4-(alquil C₁₋₃)-piperazin-1-ilsulfonilo, en donde todos los anillos heterocicloalquilo y cicloalquilo saturados anteriormente mencionados están opcionalmente sustituidos con uno o dos grupos independientemente seleccionados entre flúor, alquilo C₁₋₃, alcoxi C₁₋₃, alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₃ o hidroxilo, y dos grupos Y, que están unidos al mismo átomo de carbono, tales como Y¹/Y², Y³/Y⁴, Y⁵/Y⁶, Y⁷/Y⁸, Y⁹/Y¹⁰, Y¹¹/Y¹², Y¹³/Y¹⁴ pueden formar, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un grupo carbonilo o un grupo cicloalquilo C₃₋₆ en el que uno o dos grupos CH₂ están opcionalmente reemplazados, independientemente entre sí, por O, S, NR^N,

carbonilo o sulfonilo y que opcionalmente está parcialmente insaturado y opcionalmente mono o polisustituido, preferiblemente mono o tetrasustituido, con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de R³, y/o uno de los pares Y¹ y Y³, Y¹ y Y⁵, Y³ y Y⁵, Y¹ y Y⁷, o Y⁷ y Y¹¹ puede combinarse para formar un puente alquileo C₁₋₃ en el que uno o dos grupos CH₂ están opcionalmente reemplazados, independientemente entre sí, por O, S, NR^N, carbonilo o sulfonilo y que está opcionalmente parcialmente insaturado y opcionalmente mono o polisustituido, preferiblemente mono a tetrasustituido, con sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, de R³, y/o los residuos Y¹, Y³ y Y⁵ están opcionalmente unidos para formar un puente alquileo C₃₋₆ en el que un grupo CH₂ está opcionalmente reemplazado por O, S, NR^N, carbonilo o sulfonilo y un grupo CH opcionalmente por N y que está opcionalmente mono o polisustituido preferiblemente mono a tetrasustituido, con sustituyentes seleccionados independientemente entre sí, de R³; R¹⁰, independientemente entre sí, representan halógeno, alquilo C₁₋₃, difluorometilo, trifluorometilo, ciano, nitro, amino, alquilamino C₁₋₃, di-(alquil C₁₋₃)amino, acetilamino, metilsulfonilamino, carboxi, alquiloicarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, alquilamino C₁₋₃-carbonilo, di-(alquil C₁₋₃)-aminocarbonilo, aminosulfonilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfonilo, hidroxilo, alquiloxi C₁₋₃, difluorometoxi, trifluorometoxi o fenilo opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados, independientemente entre sí, entre flúor, metilo, metoxi, ciano o hidroxilo, mientras que el grupo (het)arilo mencionado anteriormente es fenilo, naftilo, pirrolilo, furanilo, tienilo, piridilo, indolilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, quinolinilo, isoquinolinilo, o pirrolilo, furanilo, tienilo, piridilo donde 1 ó 2 CH se reemplazan por N, o indolilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, quinolinilo, isoquinolinilo donde 1 a 3 CH se reemplazan por N, o 1,2-dihidro-2-oxo-piridinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-piridinilo, 2,3-dihidro-3-oxo-piridazinilo, 1,2,3,6-tetrahidro-3,6-dioxo-piridazinilo, 1,2-dihidro-2-oxo-pirimidinilo, 3,4-dihidro-4-oxo-pirimidinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-2,4-dioxo-pirimidinilo, 1,2-dihidro-2-oxo-pirazinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-2,3-dioxo-pirazinilo, 2,3-dihidro-2-oxo-indolilo, 2,3-dihidrobenzofuranilo, 2,3-dihidro-2-oxo-1H-benzimidazolilo, 2,3-dihidro-2-oxo-benzoxazolilo, 1,2-dihidro-2-oxo-quinolinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-quinolinilo, 1,2-dihidro-1-oxo-isoquinolinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-cinnolinilo, 1,2-dihidro-2-oxo-quinazolinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-quinazolinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-2,4-dioxo-quinazolinilo, 1,2-dihidro-2-oxoquinoxalinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-3-oxo-quinoxalinilo, 1,2-dihidro-1-oxo-ftalazinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-1,4-dioxo-ftalazinilo, cromanilo, coumarinilo, 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxinilo, 3,4-dihidro-3-oxo-2H-benzo[1,4]oxazinilo, y donde los grupos (het)arilo mencionados anteriormente están opcionalmente sustituidos con uno a tres R¹⁰ que pueden ser iguales o diferentes, mientras que los restos alquilo o alquileo mencionados anterior-

mente pueden estar ramificados o sin ramificar; los tautómeros de los mismos, los estereoisómeros de los mismos, las mezclas de los mismos y las sales de los mismos.

- (71) BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH
 BINGER STRASSE 173, D-55216 INGELHEIM, DE
 (72) HAMILTON, BRADFORD S. - HIMMELSBACH, FRANK - ECKHARDT, MATTHIAS
 (74) 194
 (41) Fecha: 09/12/2010
 Bol. Nro.: 620



- (10) AR073921 A1
 (21) P090104099
 (22) 23/10/09
 (30) US 61/108446 24/10/08
 US 61/110447 31/10/08
 (51) A01N 37/18, 43/16, 43/02, A01P 1/00, A61K 38/00, 38/14
 (54) GLICOPEPTIDOS SEMISINTETICOS COMO AGENTES ANTIBACTERIANOS
 (57) Glicopéptidos semisintéticos que tienen actividad antibacteriana. También se proveen métodos para la síntesis de los compuestos, composiciones farmacéuticas que contienen a los compuestos y métodos de uso de los compuestos en el tratamiento y/o la profilaxis de enfermedades, en especial de infecciones bacterianas.
Reivindicación 1: Un compuesto caracterizado porque tiene una estructura seleccionada entre el grupo que consiste en las fórmulas (1) a (5) donde R^A se selecciona entre el grupo que consiste en: a) hidrógeno, b) metilo, c) alquilo C₁₋₁₂, R¹ y R² cada uno se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en: a) hidrógeno, b) alquilo C₁₋₁₂, c) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) amino, (f) alquilamino C₁₋₁₂, (g) dialquilamino C₁₋₁₂, (h) alqueno, (i) alquinilo, (j) tioalcoxi C₁₋₁₂, d) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo, e) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo sustituido, f) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo, g) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo sustituido, h) cicloalquilo, i) cicloalqueno, j) heterocicloalquilo, o R¹ y R² tomados junto con el átomo al cual se encuentran unidos forman un heteroarilo sustituido o anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros el cual opcionalmente contiene una o dos funcionalidades hetero seleccionadas entre el grupo que consiste en -O-, -NH-, -N(alquil C₁₋₆)-, -N(aril)-, -N(aril-alquil C₁₋₆)-, -N(arilo sustituido-alquil C₁₋₆)-, -N(heteroaril)-, -N(heteroaril-alquil C₁₋₆)-, -N(heteroarilo sustituido-

alquil C₁₋₆), -S-, y -S(O)_n- donde n es 1 ó 2 y el anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₃, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) oxo, (f) alquilo C₁₋₃, (g) haloalquilo C₁₋₃, (h) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₃, y k) C(=O)R⁷; l) C(=O)CHR⁸NR⁹R¹⁰ donde R⁸, R⁹ y R¹⁰ cada uno se selecciona independientemente entre un grupo que consiste en hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, arilo, arilo sustituido, heteroarilo o heteroarilo sustituido, o R⁹ y R¹⁰ tomados junto con el átomo al cual se encuentran unidos forman un anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros el cual se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₃, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) oxo, (f) alquilo C₁₋₃, (g) haloalquilo C₁₋₃, (h) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₃; R⁷ se selecciona entre el grupo que consiste en: a) hidrógeno, b) alquilo C₁₋₁₂, c) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) amino, (f) alquilamino C₁₋₁₂, (g) dialquilamino C₁₋₁₂, (h) alqueno, (i) alquino, (j) tioalcoxi C₁₋₁₂, d) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo, e) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo sustituido, f) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo, g) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo sustituido, h) cicloalquilo, i) cicloalqueno, j) heterocicloalquilo, k) alquilamino C₁₋₁₂, l) amino, m) amino-cicloalquilo; X se selecciona entre el grupo que consiste en: (i) hidrógeno, (ii) cloro; Y se selecciona entre el grupo que consiste en: (i) oxígeno, (ii) NR¹; T se selecciona entre el grupo que consiste en (I) -SO₂R^B, (II) -COR^B, (III) -CONHSO₂R^B; R se selecciona entre el grupo que consiste en (I) hidrógeno, (II) cicloalquilo, (III) cicloalqueno, (IV) alquilo C₁₋₁₂, (V) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) -COOR⁵ donde R⁵ es hidrógeno o alquilo inferior, (f) -C(O)NR⁵R⁶ donde R⁵ es hidrógeno o alquilo inferior, (g) amino, (h) -NR⁵R⁶, o R⁵ y R⁶ tomados junto con el átomo al cual se encuentran unidos forman un anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros el cual se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en: (i) halógeno, (ii) hidroxilo, (iii) alcoxi C₁₋₃, (iv) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (v) oxo, (vi) alquilo C₁₋₁₂, (vii) haloalquilo C₁₋₁₂, y (viii) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₁₂, (i) arilo, (j) arilo sustituido, (k) heteroarilo, (l) heteroarilo sustituido, (m) mercapto, (n) tioalcoxi C₁₋₁₂, (VI) C(=O)OR¹¹, donde R¹¹ es hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, arilo, arilo sustituido, heteroarilo o heteroarilo sustituido, (VII) C(=O)NR¹¹R¹², donde R¹¹ es como se define precedentemente y R¹² es hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, arilo, arilo sustituido, heteroarilo o heteroarilo sustituido, o R¹¹ Y R¹² junto

con el átomo al cual se encuentran unidos forman un anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros, el cual se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₃, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) oxo, (f) alquilo C₁₋₁₂, (g) alquilo inferior sustituido, (h) haloalquilo C₁₋₁₂, (i) amino, (j) alquilamino. (k) dialquilamino y (l) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₁₂, o R tomado junto con su átomo de oxígeno conectado es halógeno; R³ se selecciona entre el grupo que consiste en (i) OH, (ii) 1-adamantanamino, (iii) 2-adamantanamino, (iv) 3-amino-1-adamantanamino, (v) 1-amino-3-adamantanamino, (vi) 3-alquilamino inferior-1-adamantanamino, (vii) 1-alquilamino inferior-3-adamantanamino, (viii) amino, (ix) NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ cada uno se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, cicloalquilo, cicloalquilo sustituido, aminoalquilo inferior donde la porción amino del grupo alquilamino inferior se sustituye adicionalmente con alquilo no sustituido o sustituido, alqueno, cicloalquilo, cicloalqueno, arilarilo, alcoxi, ariloxi, alcoxi sustituido, y ariloxi sustituido o R¹³ y R¹⁴ junto con el átomo al cual se encuentran unidos forman un anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros, el cual se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₃, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) oxo, (f) alquilo C₁₋₁₂, (g) alquilo inferior sustituido, (h) haloalquilo C₁₋₁₂, (i) amino, (j) alquilamino, (k) dialquilamino y (l) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₁₂; R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en: (I) CH₂NH-CHR¹⁵-(CH₂)_m-NHSO₂R^B, donde m es 1 a 6 y R¹⁵ es H o alquilo inferior, (II) CH₂NH-CHR¹⁵-(CH₂)_p-CONHSO₂R^B, donde p es 0 a 6 y R¹⁵ es H o alquilo inferior, (III) CH₂NH-CHR¹⁵-(CH₂)_p-COOH, donde p es 0 a 6 y R¹⁵ es H o alquilo inferior, (IV) CH₂NR^D-CHR¹⁵-(CH₂)_q-NR^ESO₂R^B donde q es 2 a 4 y R¹⁵ es H o alquilo inferior, R^D y R^E juntos representan -CH₂-, (V) H, (VI) CH₂NHCH₂PO₃H₂, (VII) aminoalquilo inferior donde la porción amino del grupo alquilamino inferior se sustituye adicionalmente con alquilo no sustituido o sustituido, alqueno, cicloalquilo, cicloalqueno, arilarilo, alcoxi, ariloxi, alcoxi sustituido y ariloxi sustituido; R^B se selecciona entre el grupo que consiste en: a) arilo, b) alquilo C₁₋₁₂, c) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) amino, (f) alquilamino C₁₋₁₂, (g) dialquilamino C₁₋₁₂, (h) alqueno, (i) alquino, (j) tioalcoxi C₁₋₁₂, d) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo, e) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo sustituido, f) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo, g) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo sustituido, h) cicloalquilo, i) heteroarilo, j) heterocicloalquilo, k) arilo sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₆

alcoxi C₁₋₆, (e) amino, (f) aminoalcoxi C₁₋₆, (g) alquil-amino C₁₋₁₂, (h) alquilamino C₁₋₁₂-alcoxi C₁₋₆, (i) dialquilamino C₁₋₁₂, (j) dialquilamino C₁₋₁₂-alcoxi C₁₋₆, (k) alquenilo, (l) alquinilo, (m) tioalcoxi C₁₋₁₂, (n) alquilo C₁₋₁₂, (o) alquilo C₁₋₁₂ sustituido, (p) alcoxi C₁₋₁₂-morfolino, (q) alcoxi C₁₋₁₂-dialcoxi-amino C₁₋₁₂, (r) alcoxi C₁₋₁₂-NHSO₂-alquilo C₁₋₆, (s) alcoxi C₁₋₁₂-NHCO-alquilo C₁₋₆; l) heteroarilo sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₆-alcoxi C₁₋₆, (e) amino, (f) aminoalcoxi C₁₋₆, (g) alquilamino C₁₋₁₂, (h) alquilamino C₁₋₁₂-alcoxi C₁₋₆, (i) dialquilamino C₁₋₁₂, (j) dialquilamino C₁₋₁₂-alcoxi C₁₋₆, (k) alquenilo, (l) alquinilo, (m) tioalcoxi C₁₋₁₂, (n) alquilo C₁₋₁₂, (o) alquilo C₁₋₁₂ sustituido; R^c cada uno se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en: a) hidrógeno, b) alquilo C₁₋₁₂, c) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₁₂, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) amino, (f) alquilamino C₁₋₁₂, (g) dialquilamino C₁₋₁₂, (h) alquenilo, (i) alquinilo, (j) tioalcoxi C₁₋₁₂, d) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo, e) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con arilo sustituido, f) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo, g) alquilo C₁₋₁₂ sustituido con heteroarilo sustituido, h) cicloalquilo, i) cicloalquenilo, j) heterocicloalquilo, k) C(=O)R⁷, l) C(=O)CHR⁸NR⁹R¹⁰ donde R⁸, R⁹ y R¹⁰ cada uno se selecciona independientemente entre un grupo que consiste en hidrógeno, alquilo inferior, alquilo inferior sustituido, arilo, arilo sustituido, heteroarilo o heteroarilo sustituido, o R⁹ y R¹⁰ tomados junto con el átomo al cual se encuentran unidos forman un anillo heterocicloalquilo de 3 a 10 miembros el cual se sustituye opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre el grupo que consiste n: (a) halógeno, (b) hidroxilo, (c) alcoxi C₁₋₃, (d) alcoxi C₁₋₃-alcoxi C₁₋₃, (e) oxo, (f) alquilo C₁₋₃, (g) haloalquilo C₁₋₃, (h) alcoxi C₁₋₃-alquilo C₁₋₃; o una sal, éster, solvato, sal de amonio cuaternaria alquilada, estereoisómero, tautómero o prodroga aceptable farmacéuticamente del mismo.

(71) LEAD THERAPEUTICS, INC.

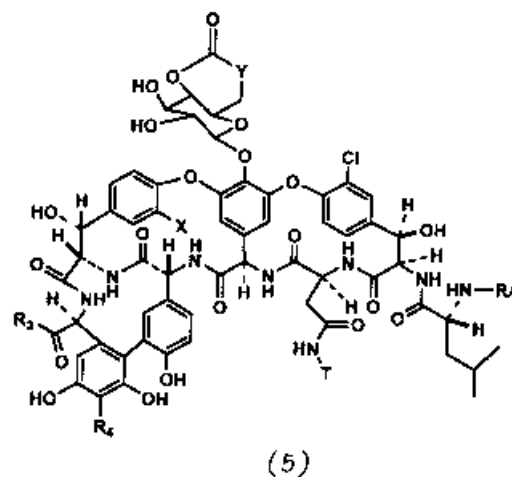
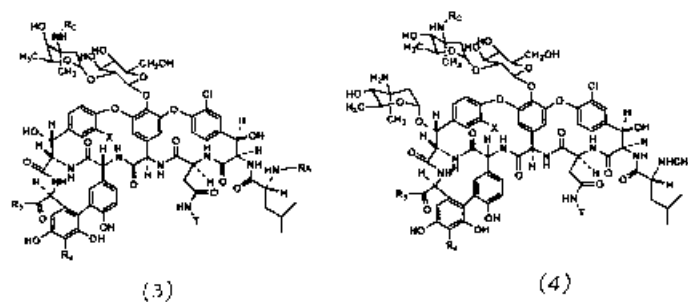
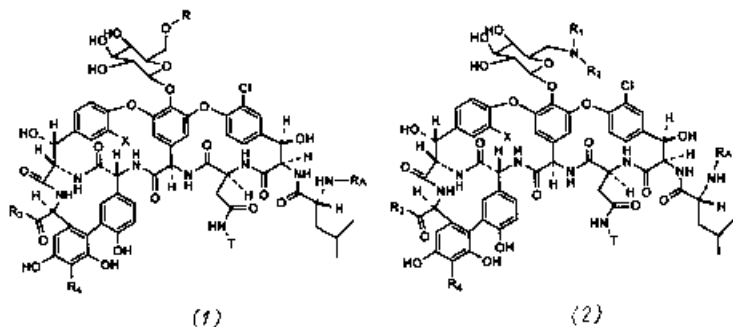
999 BAYHILL DRIVE, SUITE 130, SAN BRUNO, CALIFORNIA 94066, US

(72) WANG, BING - YE, TAO - CHU, DANIEL

(74) 1770

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073922 A1

(21) P090104171

(22) 29/10/09

(30) US 61/109461 29/10/08

US 61/229882 30/07/09

(51) C07D 241/44, A61K 31/498, A61P 9/00

(54) 2-OXOQUINOXALINAS COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES DE SODIO TARDIOS

(57) La presente se refiere a compuestos que son inhibidores del canal de sodio tardío y a su uso en el tratamiento de diversos estados de enfermedad, incluyendo enfermedades cardiovasculares y diabetes. A métodos para la preparación y uso de los compuestos y a composiciones farmacéuticas que los contienen.

Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (1) donde R¹ es a) hidrógeno o alquilo C₁₋₆; b) -X-NR⁵R⁶; c) -X-C(O)NR⁵R⁶; d) -X-C(O)OR⁷; e) -X-OR⁷; f) -X-NR⁸-C(O)NR⁵R⁶; g) -X-C(O)R⁷; o h) -X-fenilo, donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 ó 3 grupos seleccionados entre alquilo inferior C₁₋₆, alcoxi inferior C₁₋₆, halo, y trifluorometilo; donde R⁵ es hidrógeno o alquilo inferior C₁₋₆ opcionalmente sustituido, y R⁶ es hidrógeno, alquilo inferior C₁₋₆, arilo, heteroarilo, -C(NH)NH₂, -C(O)R⁷, -C(O)(CH₂)_nOR⁷, o -S(O)₂R⁷, donde n es 0 ó 1, R⁷ es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁₋₆, arilo monocíclico opcionalmente sustituido, o heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido de 5 ó 6 miembros, o R⁵ y R⁶ junto con el nitrógeno al cual están unidos se

unen para formar un anillo heteroarilo o heterociclilo monocíclico de 5 ó 6 miembros; R⁷ es hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alqueno C₁₋₆ opcionalmente sustituido, arilo monocíclico opcionalmente sustituido, o heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido de 5 ó 6 miembros; R⁸ es hidrógeno o alquilo inferior C₁₋₆; X es alquileno lineal o ramificado C₁₋₆ opcionalmente sustituido; R² es a) hidrógeno, alcoxi C₁₋₆, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con halo, fenilo, heteroarilo, o cicloalquilo, en donde dichos grupos fenilo, heteroarilo o cicloalquilo están opcionalmente sustituidos con halo, hidroxilo, o alcoxi de 1-6 átomos de carbono; b) -Y-NR²⁴R²⁵, c) -Y-C(O)NR²⁴R²⁵, d) -Y-C(O)OR²⁷, e) -Y-OR²⁷, f) -Y-NR²⁸-C(O)NR²⁴R²⁵, o g) -Y-C(O)R²⁷, donde R²⁴ es hidrógeno o alquilo inferior C₁₋₆ opcionalmente sustituido, y R²⁵ es hidrógeno, alquilo inferior C₁₋₆, arilo, heteroarilo, alcoxi C₁₋₆, -C(NH)NH₂, -C(O)R²⁶ o -S(O)₂R²⁶, donde R²⁶ es hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alqueno C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁₋₆, arilo monocíclico opcionalmente sustituido, o heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido de 5 ó 6 miembros, o R²⁴ y R²⁵ junto con el nitrógeno al cual están unidos se unen para formar un anillo heteroarilo o heterociclilo monocíclico de 5 ó 6 miembros; R²⁷ es hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alqueno C₁₋₆ opcionalmente sustituido, arilo monocíclico opcionalmente sustituido o heteroarilo monocíclico opcionalmente sustituido de 5 ó 6 miembros; R²⁸ es hidrógeno o alquilo inferior C₁₋₆; Y es un enlace covalente, alquileno lineal o ramificado C₁₋₆ opcionalmente sustituido; donde la porción alquilo, cicloalquilo, arilo, o heteroarilo está opcionalmente sustituida con entre 1 y 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo formado por heterociclilo, arilo, heteroarilo, halo, NO₂, CF₃, CN, OR²⁰, SR²⁰, N(R²⁰)₂, S(O)R²², SO₂R²², SO₂N(R²⁰)₂, S(O)₃R²⁰, P(O)(OR²⁰)₂, SO₂NR²⁰COR²², SO₂NR²⁰CO₂R²², SO₂NR²⁰CON(R²⁰)₂, NR²⁰COR²², NR²⁰CO₂R²², NR²⁰CON(R²⁰)₂, NR²⁰C(NR²⁰)NHR²³, COR²⁰, CO₂R²⁰, CON(R²⁰)₂, CONR²⁰SO₂R²², NR²⁰SO₂R²², SO₂NR²⁰CO₂R²², OCONR²⁰SO₂R²², OC(O)R²⁰, C(O)OCH₂OC(O)R²⁰, y OCON(R²⁰)₂, y adicionalmente donde cada sustituyente heteroarilo, arilo, y heterociclilo opcional es además opcionalmente sustituido con halo, NO₂, alquilo, CF₃, amino, mono- o di-alquilamino, alquilo o arilo o heteroarilamida, NR²⁰COR²², NR²⁰SO₂R²², COR²⁰, CO₂R²⁰, CON(R²⁰)₂, NR²⁰CON(R²⁰)₂, OC(O)R²⁰, OC(O)N(R²⁰)₂, S(O)₃R²⁰, P(O)(OR²⁰)₂, SR²⁰, S(O)R²², SO₂R²², SO₂N(R²⁰)₂, CN, ó OR²⁰; R³ es heterociclilo mono o bicíclico opcionalmente sustituido, arilo mono o bicíclico, o heteroarilo mono o bicíclico; donde la porción arilo, heterociclilo o heteroarilo está opcionalmente sustituida con entre 1 y 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo formado por alquilo, heterociclilo, arilo, ariloxi, heteroarilo, halo, NO₂, CF₃, CN, OR²⁰, SR²⁰, N(R²⁰)₂, S(O)R²², SO₂R²², SO₂N(R²⁰)₂, S(O)₃R²⁰, P(O)(OR²⁰)₂, SO₂NR²⁰COR²²,

SO₂NR²⁰CO₂R²², SO₂NR²⁰CON(R²⁰)₂, NR²⁰COR²², NR²⁰CO₂R²², NR²⁰CON(R²⁰)₂, NR²⁰C(NR²⁰)NHR²³, COR²⁰, CO₂R²⁰, CON(R²⁰)₂, CONR²⁰SO₂R²², NR²⁰SO₂R²², SO₂NR²⁰CO₂R²², OCONR²⁰SO₂R²², OC(O)R²⁰, C(O)OCH₂OC(O)R²⁰, y OCON(R²⁰)₂, y adicionalmente donde cada sustituyente alquilo, heteroarilo, arilo y heterociclilo opcional está además opcionalmente sustituido con halo, NO₂, alquilo, CF₃, amino, mono- o di-alquilamino, alquil o aril o heteroarilamida, NR²⁰COR²², NR²⁰SO₂R²², COR²⁰, CO₂R²⁰, CON(R²⁰)₂, NR²⁰CON(R²⁰)₂, OC(O)R²⁰, OC(O)N(R²⁰)₂, S(O)₃R²⁰, P(O)(OR²⁰)₂, SR²⁰, S(O)R²², SO₂R²², SO₂N(R²⁰)₂, CN, ó OR²⁰; R⁴ es hidrógeno, halo, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alqueno C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁₋₆ o cicloalquilo; R²⁰ y R²² se seleccionan independientemente del grupo formado por hidrógeno, alquilo C₁₋₁₅, alqueno C₂₋₁₅, alquino C₂₋₁₅, heterociclilo, arilo, y heteroarilo, donde las porciones alquilo, alqueno, alquino, heterociclilo, arilo y heteroarilo son opcionalmente sustituidas con entre 1 y 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo, mono- o di-alquilamino, alquil o aril o heteroarilamida, CN, O-alquilo C₁₋₆, CF₃, arilo, y heteroarilo; o su sal, éster, prodroga o solvato aceptable para uso farmacéutico.

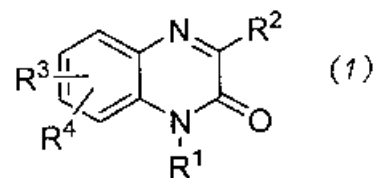
(71) GILEAD PALO ALTO, INC.

333 LAKESIDE DRIVE, FOSTER CITY, CALIFORNIA 94404, US

(74) 195

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073923 A1

(21) P090104220

(22) 30/10/09

(30) US 61/110519 31/10/08

US 61/173960 29/04/09

US 61/245150 23/09/09

(51) C07D 471/04, A61K 31/407, 31/437, A61P 25/00

(54) PIRIDO[4,3-B]INDOLES QUE CONTIENEN RESTOS RIGIDOS

(57) También se proveen composiciones farmacéuticas que comprenden los compuestos, dado que son métodos de uso de compuestos en una variedad de aplicaciones terapéuticas, incluyendo el tratamiento de un trastorno cognitivo, trastorno psicótico, trastorno mediado por neurotransmisores y/o un trastorno neuronal.

Reivindicación 1: Un compuesto de la fórmula (1) o una de sus sales o solvatos, en donde R¹ es H, hidroxilo, nitro, ciano, halo, alquilo C₁₋₈ sustituido o

no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, alquino C_{2-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo, acilo, aciloxi, carbonilalcoxi, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi, ariloxi, carboxilo, tiol, tioalquilo, amino sustituido o no sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi, aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo o carbonilalquilalcoxi; cada R^{2a} y R^{2b} es, de modo independiente, H, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, halo, ciano, hidroxilo, alcoxi, nitro o R^{2a} y R^{2b} se toman junto con el carbono al que están unidos para formar un resto de carbonilo o un resto de cicloalquilo; cada R^{3a} y R^{3b} es, de modo independiente, H, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, halo, ciano, nitro, amino sustituido o no sustituido, hidroxilo, alcoxi, aciloxi, acilamino, arilo, heteroarilo, cicloalquilo, heterociclilo o R^{3a} y R^{3b} se toman junto con el carbono al que están unidos para formar un resto de carbonilo o un resto de cicloalquilo; cada X^7 , X^8 , X^9 y X^{10} es, de modo independiente, N, CH o CR^4 ; cada m y q es, de modo independiente, 0 ó 1; cada R^4 es, de modo independiente, hidroxilo, nitro, ciano, halo, perhaloalquilo C_{1-8} , alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, alquino C_{2-8} sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi C_{1-8} , ariloxi, carboxilo, carbonilalcoxi, tiol, heterociclilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, tioalquilo, amino sustituido o no sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi, aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo, carbonilalquilalcoxi, alquilsulfonilamino o acilo; cada R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} y R^{8d} es, de modo independiente, H, hidroxilo, alcoxi, halo, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, cicloalquilo C_{3-8} , sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo C_{1-8} , carboxi, carbonilalcoxi o se toma junto con un R^9 geminal para formar un resto de la fórmula $-OCH_2CH_2O-$ o se toma junto con el carbono al que está unido y un R^9 geminal para formar un resto de cicloalquilo o un resto de carbonilo; cada R^{10a} y R^{10b} es, de modo independiente, H, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, halo, ciano, hidroxilo, alcoxi, nitro o R^{10a} y R^{10b} se toman junto con el carbono al que están unidos para formar un resto de carbonilo o un resto de cicloalquilo; cada R^{11} y R^{12} es de modo independiente, H, halo, alcoxi, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, cicloalquilo C_{3-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo C_{1-8} , carboxi o carbonilalcoxi y el enlace ondulado indica la presencia de una configuración de enlace doble E ó Z o R^{11} y R^{12} se toman juntos para formar un enlace; y Q es un arilo sustituido o sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, cicloalqueno

sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, alcoxi, aciloxi, amino sustituido o no sustituido, aminoacilo, aminocarbonilalcoxi., ciano, alquino, carboxi, carbonilalcoxi o acilamino; con la condición de que, cuando X^7 , X^8 y X^{10} son cada uno CH y cada R^{2a} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{10a} y R^{10b} es hidrógeno, al menos uno de R^{11} y R^{12} es distinto de hidrógeno y R^{11} y R^{12} no se toman juntos para formar un enlace.

(71) MEDIVATION TECHNOLOGIES, INC.

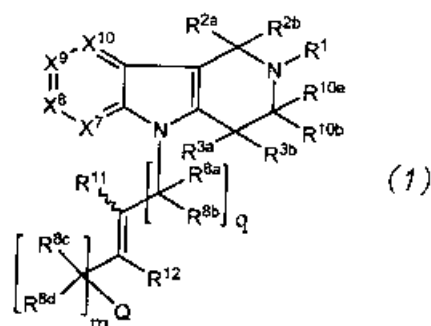
201 SPEAR STREET, 3RD FLOOR, SAN FRANCISCO, CALIFORNIA 94105, US

(72) HUNG, DAVID T. - PROTTER, ANDREW ASHER - CHAKRAVARTY, SARVAJIT - JAIN, RAJENDRA PARASMAL - GIORGETTI, MARCO

(74) 438

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



(10) AR073924 A1

(21) P090104221

(22) 30/10/09

(30) US 61/110527 31/10/08

US 61/173965 29/04/09

US 61/245257 23/09/09

(51) C07D 487/04, A61K 31/55, A61P 25/18

(54) AZEPINO[4,5-B]INDOLES, UNA COMPOSICION FARMACEUTICA Y KITS QUE LOS COMPREN DEN Y SU USO EN LA MODULACION DE UN RECEPTOR DE HISTAMINA

(57) Compuesto de azepino[4,5-b]indoles que se pueden usar para modular un receptor de histamina en un individuo. Se describen compuestos, incluyendo 1,2,3,4,5,6-tetrahidroazepino[4,5-b]indoles. También se provee composiciones farmacéuticas y kit que comprenden estos compuestos.

Reivindicación 1: Un compuesto de la fórmula (1) en donde R^1 es H, hidroxilo, nitro, ciano, halo, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, alquino C_{2-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo, acilo, aciloxi, carbonilalcoxi, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi, ariloxi, carboxilo, tiol, tioalquilo, amino sustituido o no sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi,

aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo, alquilsulfonilamino o carbonilalquilenalcoxi; cada R^{2a} , R^{2b} , R^{3a} y R^{3b} es, de modo independiente, H, hidroxilo, nitro, ciano, halo, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo, acilo, aciloxi, carbonilalcoxi, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi, ariloxi, carboxilo, tiol, tioalquilo, amino sustituido o no sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi, aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo, alquilsulfonilamino o carbonilalquilenalcoxi o se toma junto con el carbono al que está unido y un R^2 o R^3 geminal para formar un resto de carbonilo; cada R^{10a} , R^{10b} , R^{11a} y R^{11b} es, de modo independiente, H, hidroxilo, nitro, ciano, halo, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, perhaloalquilo, acilo, aciloxi, carbonilalcoxi, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi, ariloxi, carboxilo, tiol, tioalquilo, amino sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi, aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo, alquilsulfonilamino o carbonilalquilenalcoxi o se toma junto con el carbono al que está unido y un geminal R^{10} o R^{11} para formar un resto de cicloalquilo o un resto de carbonilo; cada X^7 , X^8 , X^9 y X^{10} es, de modo independiente N o CR^4 ; cada R^4 es, de modo independiente, H, hidroxilo, nitro, ciano, halo, perhaloalquilo C_{1-8} , alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, perhaloalcoxi C_{1-8} , alcoxi C_{1-8} , ariloxi, carboxilo, carbonilalcoxi, tiol, heterociclilo sustituido o no sustituido, aralquilo sustituido o no sustituido, tioalquilo, amino sustituido o no sustituido, acilamino, aminoacilo, aminocarbonilamino, aminocarboniloxi, aminosulfonilo, sulfonilamino, sulfonilo, carbonilalquilenalcoxi, alquilsulfonilamino o acilo; cada m y q es, de modo independiente, 0 ó 1; cada R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} , R^{8e} y R^{8f} es, de modo independiente, H, hidroxilo, alcoxi, halo, perhaloalquilo C_{1-8} , carboxi, carbonilalcoxi, arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, alquilo C_{1-8} sustituido o no sustituido, cicloalquilo C_{3-6} sustituido o no sustituido, alqueno C_{2-8} sustituido o no sustituido o se toma junto con un R^8 geminal para formar un resto de la fórmula - OCH_2CH_2O -, se toma junto con el carbono al que está unido y un R^8 geminal para formar un resto de cicloalquilo o un resto de carbonilo, se toma junto con un R^8 geminal para formar un metileno o un metileno sustituido, se toma junto con un R^8 vecinal y los átomos de carbono a los que están unidos para formar un cicloalquilo C_{3-8} sustituido o no sustituido, cicloalqueno C_{3-8} sustituido o no sustituido o resto de heterociclilo sustituido o no sustituido o se

toma junto con un R^8 vecinal para formar un enlace, siempre que: (i) a lo sumo un par de grupos vecinales R^8 se toman juntos para formar un enlace; y (ii) cuando un R^8 se toma junto con un R^8 vecinal para formar un enlace, el R^8 geminal sea distinto de hidroxilo; Q es un arilo sustituido o no sustituido, heteroarilo sustituido o no sustituido, cicloalquilo sustituido o no sustituido, cicloalqueno sustituido o no sustituido o heterociclilo sustituido o no sustituido, amino sustituido o no sustituido, alcoxi, aminoacilo, aciloxi, carbonilalcoxi, aminocarbonilalcoxi o acilamino; o una de sus sales o solvatos.

(71) MEDIVATION TECHNOLOGIES, INC.

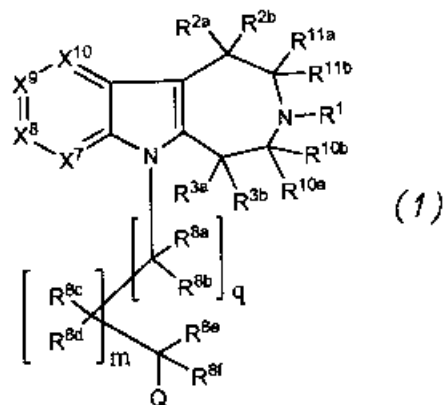
201 SPEAR STREET, 3RD FLOOR, SAN FRANCISCO, CALIFORNIA 94105, US

(72) HUNG, DAVID T. - PROTTER, ANDREW ASHER - CHAKRAVARTY, SARVAJIT - JAIN, RAJENDRA PARASMAL - GIORGETTI, MARCO

(74) 438

(41) Fecha: 09/12/2010

Bol. Nro.: 620



INSTITUTO NACIONAL DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

BOLETIN DE MARCAS Y PATENTES

DECRETO N° 1148/2002

Los servicios del I.N.P.I. son para Usted.

Si desea efectuar alguna consulta en forma telefónica puede hacerlo a través de nuestra línea gratuita: **0-800-222-INPI,**
o bien a los Tel.: (4674)

| AREA | DIRECTO |
|-----------------------------------|-----------------|
| PRESIDENCIA..... | 4344-4900/1/2 |
| PATENTES..... | 4344-4920/22 |
| MARCAS..... | 4344-4938 (FAX) |
| LEGALES..... | 4344-4947/8/50 |
| TRANSFERENCIA DE TECNOLOGIA | 4344-4928/29 |
| RRHH..... | 4344-4910 |
| RELACIONES INTERNACIONALES..... | 4344-4984 |
| INFORMACION TECNOLOGICA | 4344-4933/34 |
| MODELOS Y DISEÑOS..... | 4344-4951/2/3 |
| BIBLIOTECA..... | 4344-4978/79 |
| PUBLICACIONES..... | 4344-4821 |

Nuestro servicio en Internet:

www.inpi.gov.ar

Para consultas y suscripciones dirigirse al I.N.P.I., Av. Paseo Colón 717 (1063) - Planta Baja Buenos Aires, en el horario de 9:00 a 12:45 y de 13:30 a 15:30 hs.

Registro Nacional de la Propiedad Intelectual N° 149.058

PRECIOS SUSCRIPCIONES (Dto. 878/2006)

| | |
|--|-----------|
| <i>Ejemplar</i> | \$ 5.00 |
| <i>Suscripción (24 ejemplares)</i> | \$ 105.00 |
| <i>Gastos de Correo</i> | \$ 40.00 |
| <i>Ejemplar Atrasado</i> | \$ 7.00 |

PUBLICACIÓN DÍA MIÉRCOLES

| | |
|------------------------------------|--|
| CORREO ARGENTINO CENTRAL (B) | TARIFA REDUCIDA CONVENIO N° 1012 |
| | FRANQUEO A PAGAR CONCESION N° 12604 |

