

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: **ZENTARIS AG.**

Dirección: **Frankfurt am Main, ALEMANIA**

Teléfono: Fax:

E-mail:

Domicilio: **Frankfurt am Main, ALEMANIA**

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **DRA. MARGARITA CASTELLANOS**

Dirección: **CARRERA 9 No. 93-09**

Teléfono: **610 74 80** Fax **610 07 06**

E-mail: **acastell@impsat.net.co**

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número **39.779.654 Us** TPA **70.819**

④

Número de Expediente:

00.097.375

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Inscribir el Cambio de Nombre Social de: **ASTA MEDICA AG**

Con domicilio en: **Dresden, ALEMANIA**

POR EL DE: ASTA MEDICA GMBH

Con domicilio en: **Dresden, ALEMANIA**

⑥

Comprobante de pago No.

28609

Fecha

Mayo 102 /2002

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☒

Documento que respalde la modificación

☒

Poder si fuere el caso. Con sustitución a mi favor

☒

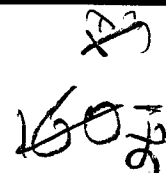
Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

⑧

NOMBRE **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

FIRMA

Margarita Castellanos Abondano
C.C.39.779.654 Usaquén - TPA 70.819 CSJ



SUPERINTENDENCIA

התאחדות העובדים הכללית

F01: 23

DATE: 1920 JANUARY 10
 NAME: JAMES PATTERSON
 ADDRESS: 1020 10TH AVENUE, NEW YORK, N.Y.

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 02 - 28,609
FECHA : MAYO 2 DE 2002

***** CONSIGNATION *****

DEPOSITANTE	TIPO PASO	BANCO	CUENTA	No. PASO	FECHA PASO	Vr. PASO
MONICA VALENCIA ARDANDO	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	4114299	02/05/2002	7.691.000,00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12	MARCAS Y LEMAS COMERCIALES
			78.000.00
		TOTAL :	\$ 78.000.00

SON: SETENTA Y OCHO MIL PESOS


AL EXPEDIENTE

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
 Conmutador 382 0840
 Fax 350 5220
 E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
 Bogotá, D.C., Colombia

161 192

Superintendencia de Industria y Comercio
FORMATO DE DECLARACION DE RELACION DE INTERES
Expediente No

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E. S. D.

Ref.: PODER conferido por la sociedad ZENTARIS AG

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente manifiesto a Uds. que sustituyo en la Dra. **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió **ZENTARIS AG**, con domicilio en Frankfurt am Main, ALEMANIA.- -----

debidamente legalizado por Apostilla bajo el No. **91EaA530** el día **24 de Enero, 2002**, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de **Inscripción de Cambio de Nombre Social** de la sociedad **ASTA MEDICA AG** por el de **ASTA MEDICA GMBH**, en la solicitud de Patente de Invención en Colombia, que se tramita bajo el Expediente No. **00.097.375**, para: **"DERIVADOS SUSTITUIDOS DEL ACIDO N-BENCIL-INDOL-3-IL-GLIOXILICO CON EFECTO ANTITUMORAL".-**

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C.C. No. **39.773.330** de Usaquén
T.P.A. No. **58.236** del C.S.J.
Carrera 9 No. 93-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480


Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. **39.779.654** de Usaquén
T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.
Carrera 9 No. 93-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480

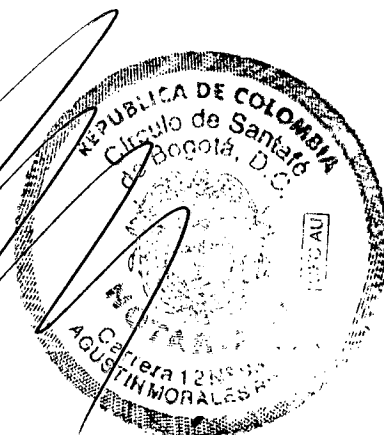
Bogotá, D.C. 2 - JUN 2002
XCA/MCA

**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.P.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Ante mi Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Ximena Castellanos Abondano
 identificada con C.C. **39 773 330**
 expedida en: **USAQUEEN** y tarjeta profesio-
 nal de abogado(a) No. **38236** del Consejo
 Superior de la Judicatura, con documento di-
 rigido a **Superintendencia de Iyc**
 y declaro que la firma que aparece en el documento es
 propia.

Ximena Castellanos

En Bogotá D.C. a **02 MAYO 2002**
 AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.P.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Ante mi Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Margarita Castellanos Abondano
 identificada con C.C. **39 779 654**
 expedida en: **70819** y tarjeta profesio-
 nal de abogado(a) No. **38236** del Consejo
 Superior de la Judicatura, con documento di-
 rigido a **Superintendencia de Iyc**
 y declaro que la firma que aparece en el documento es
 propia.

Margarita Castellanos

En Bogotá D.C. a **02 MAYO 2002**
 AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



PODER

El (los) suscrito (s) en representación de
ZENTARIS AG



El (los) suscrito (s) en Frankfurt am Main, Alemania

nombramos por el presente a **XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A.** abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen; depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Para la obtención de Registros Sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba determinados sustituir este poderdante, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 23 de Enero del 2002

en Frankfurt
Por ZENTARIS AG

(Notary should execute on other side)
(consular legalization necessary)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned
ZENTARIS AG

of Frankfurt am Main, Germany

hereby grant(s) Power of Attorney to **XIMENA CASTELLANOS A. and/or MARGARITA CASTELLANOS A.** attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09 Bogotá - COLOMBIA to

and to obtain the protection of my (our) industrial property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities or persons, specially those, administrative contentious and judicial, in all matters concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs; registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of commercial names and ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) For the obtention of Sanitary Registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights; actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of Court.

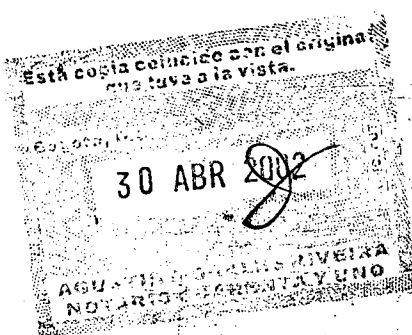
Given and signed this

in Frankfurt

By Zentaris AG

Prof. J. Engel
(Notary should execute on other side)
(Consular legalization necessary)

Richard Bates



76
1635

No. 212 of the Roll of Deeds of 2002

I hereby certify, that the above are the true signatures, respectively acknowledged in my presence of

1. Prof. Dr. Jürgen **Engel**, born August 31st, 1945,
2. Richard **Bates**, born October 17th, 1948
both with business address at Weismüllerstraße 45,
60314 Frankfurt am Main,

- who are personally known to me -,

Both acting on behalf of **Zentaris AG** with registered office at Frankfurt am Main and registered in the Commercial Register of the Frankfurt Local Court under HRB 50736.

At the same time I confirm that according to the Commercial Register of the Frankfurt Local Court, which I inspected on 16.01.2002, Zentaris AG is a corporation duly organized under the laws of Germany, Prof. Dr. Engel and Mr. Bates are members of the Board of Managing Directors and they are entitled to represent jointly this company.

Upon request the aforementioned persons denied prior activities of the Notary in this matter, as regulated by § 3 sec. 1 No. 7 BeurkG.

Frankfurt am Main, this 23rd day of January 2002

Jr. Klaus D. Hartmann

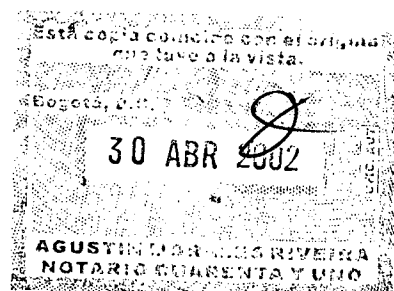
Jr. Klaus D. Hartmann
Notary

Statement of costs

Value of the matter: € 250,000,00

5/20 fee §§ 141, 32, 45/1 KostO	€ 21,00
fee § 150 I KostO	€ 13,00
16 % VAT § 151a KostO	€ 5,44
Total	<u>€ 39,44</u>

he
Notary



APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von Dr. Handmann

3. in seiner Eigenschaft als amtlich bestellter Notar

4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des (der) Notars

Bestätigt **24. 1. 02**

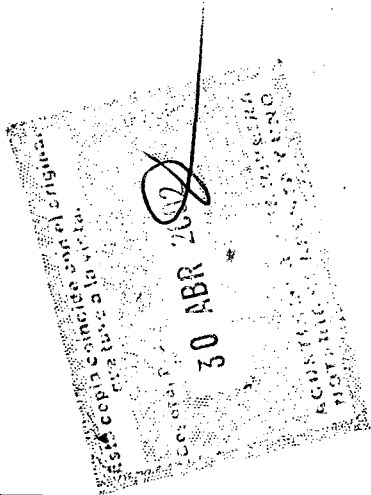
5. in Frankfurt/Main 6. am

7. durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts

8. unter Nr. 91 Ea A 530

9. am 10. Unterschrift

i. v. Schlitz



177
164800

TRADUCCION OFICIAL DEL INGLES de la certificación adjunta al poder que la compañía Zentaris AG domiciliada en Frankfurt am Main, República Federal de Alemania, otorga a Ximena Castellanos A. y/o Margarita Castellanos A.

Registro Notarial No. 212/2002

Confirmo mediante este documento la autenticidad las firmas que aparecen anteriormente, reconocidas en mi presencia como las suyas propias por los Señores

1. Prof. Dr. Jürgen Engel, nacido el 31 de Agosto de 1945,
 2. Richard Bates, nacido el 17 de Octubre de 1948,
- ambos con domicilio comercial en Weismüllerstraße 45, 60314 Frankfurt am Main, y conocidos personalmente por el suscrito Notario, quienes actúan aquí en nombre de la compañía Zentaris AG, con oficina registrada en Frankfurt am Main y registrada bajo el Registro Comercial HRB 50736 del Juzgado Municipal de Frankfurt am Main.

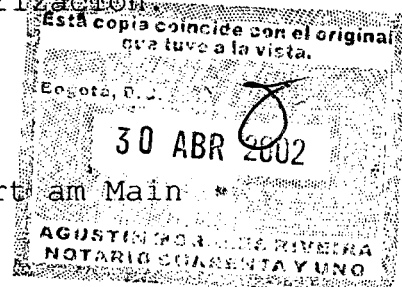
Al mismo tiempo, después de la revisión llevada a cabo el 16.01.2002 en el Registro Comercial del Juzgado Municipal de Frankfurt am Main, confirmo que Zentaris AG es una sociedad debidamente organizada y en existencia de conformidad con las leyes alemanas, y que el Prof. Dr. Engel y el Sr. Bates son miembros de la Junta de Directores y están autorizados para representar conjuntamente a la mencionada compañía.

Al ser interrogadas, las personas mencionadas negaron haber participado anteriormente en las actividades a que se refiere el artículo 3 sección 1 No. 7 de la Ley de Notarización.

Frankfurt am Main, 23 de Enero del 2002

Dr. Klaus D. Hartmann, Notario en Frankfurt am Main *

(Firma y Sello Oficial)



16500

Nota de gastos

Valor del negocio: 25.000,00 EUROS

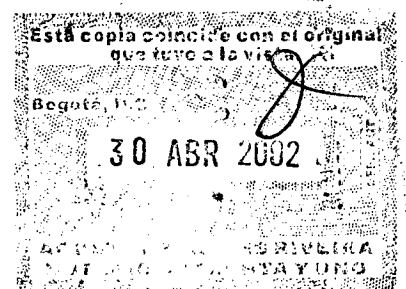
5/20 Impuesto artículos 141,32,45/1 Disp. Impuestos	21,00 E
Impuesto artículo 150 I Disp. Impuestos	13,00 E
16% I.V.A. artículo 151a Disp. Impuestos	5,44 E
Total:	39,44 E

Dr. Klaus D. Hartmann, Notario

(Firma)

[Aparece Apostilla en alemán con fecha 24 de Enero del 2002 que legaliza la firma del Notario Dr. Klaus D. Hartmann bajo el No. 91 Ea A 530.]

M. Méndez S.
JOSE MIGUEL M. GONZALEZ
BOGOTÁ, D.C.
30 ABR 2002



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

30 APR

223670
JH. Nolas

YA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
S FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2002 APR 22 A 9 51

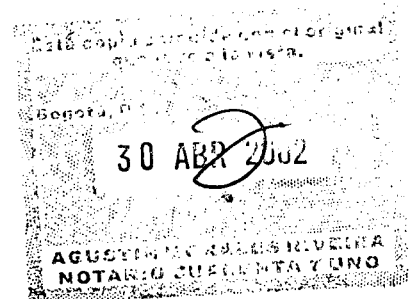
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

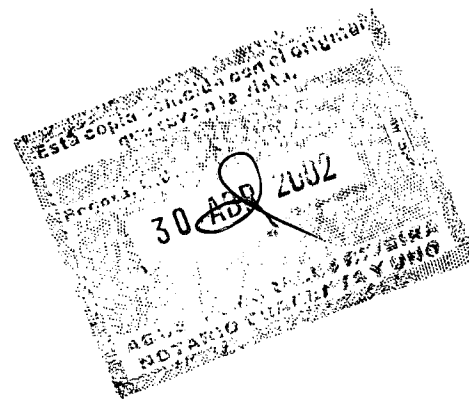
(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

- # Certificado

- Nota de gastos: Impuesto 12,00 EUROS


ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia





MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

223671
H. Watzke
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2002 APR 22 A 9 51

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTA FE DE BOGOTÁ D.C.

P A T E N T S

4680
157
331/183

ASSIGNMENT

ASSIGNMENT

(los) suscrito (s) en representación de
ASTA Medica GmbH

The undersigned
ASTA Medica GmbH

en consideración al pago de la suma de

In consideration of the sum of

(.....US\$10.-.....), que he (mos) recibido, por

(.....US\$10.-.....), the receipt of which is

el presente documento cedo (cedemos) a
ZENTARIS AG

hereby acknowledged, by these presents do sell, assign
and transfer unto ZENTARIS AG

una compañía constituida de conformidad con las leyes de
Alemania

a corporation organized under the laws of GERMANY

con oficinas en Frankfurt am Main

having a place of business at Frankfurt am Main

todos los derechos y títulos sobre la invención denominada
- Según lista adjunta -

all rights and title to the invention related to

Solicitud(es) No.(s)

Application(s) No.(s)

- Según lista adjunta -

see enclosed list

en Colombia

In Colombia

EL CESIONARIO firma también el presente y declara que
acepta dicha cesión.

THE ASSIGNEE signs these presents and declares that
accepts the aforesaid assignment

Dado y firmado hoy Enero 16, 2002

Given and signed this January 16, 2002

in Frankfurt am Main

in Frankfurt am Main

ASTA Medica GmbH

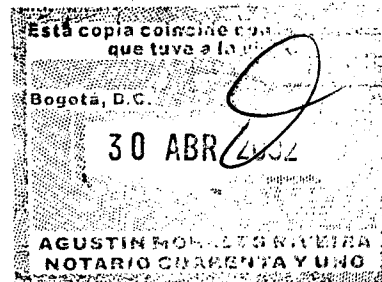
Assigner ppa. H.-J. Kromp
Head of Legal depart.

ppa. N. Leonhard
Head of Tax dep.

Zentaris AG

Prof. J. Engel
Chief executive Officer

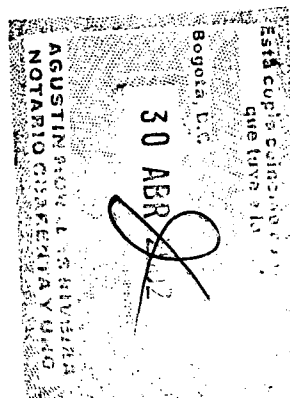
R. Bates
Chief financial Officer



168

Traspaso de las Solicitudes de Patente de ASTA Medica AG a ZENTARIS AG en Colombia
Assignment of Patent Application from ASTA Medica AG to Zentaris AG in Columbia

Nuestra Ref. Our Ref.	Solicitud No. Application-No.	De fecha Filed on	Patente No. Patent-No.	Concedida en Granted on	Abogado Attorney	Su Ref. Your ref.
CO98/06 PH	99 027 093	04.05.99			V-035 (OBLIGADO)	3.313
CO98/20 PH	00 019 239	16.03.00			V-035 (OBLIGADO)	3.373
CO99/03 PH	00 049 358	30.06.00			V-035 (OBLIGADO)	3.385
CO99/04 PH	00 005 024	28.01.00			V-035 (OBLIGADO)	3.360
CO99/06 PH	00 022 260	29.03.00			V-035 (OBLIGADO)	3.371
CO99/20 PH	00 097 375	22.12.00			V-035 (OBLIGADO)	3.416



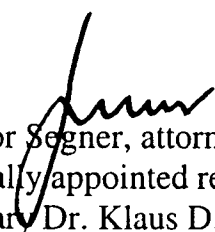
3-11-02
169 581

No. 3469 of the Roll of Deeds 2001

I hereby confirm that according to the certified excerpt of the Commercial Register of the Dresden Local Court dated November 23rd, 2001, (HRB 20172) **ASTA Medica GmbH was formerly named ASTA Medica Aktiengesellschaft** with registered office in Dresden, entered in the Commercial Register of the Local Court Dresden under HRB 7131, **and that the company was transformed from a joint stock company ("Aktiengesellschaft" / "AG") into a limited liability company ("Gesellschaft mit beschränkter Haftung" / "GmbH"), the legal entity remaining the same, effective November 6th, 2001.**

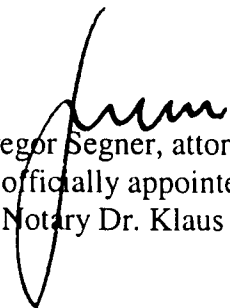
Frankfurt am Main, this 13th day of December 2001

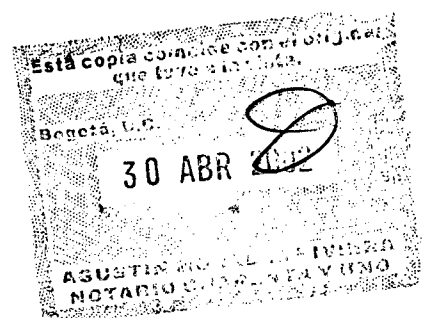



Gregor Segner, attorney-at-law
as officially appointed representative
of Notary Dr. Klaus D. Hartmann

Statement of costs

fee § 150 II KostO	DM 50,00
16 % VAT § 151a KostO	DM 8,00
Total	<u>DM 58,00</u>

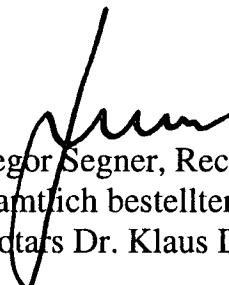

Gregor Segner, attorney-at-law
as officially appointed representative
of Notary Dr. Klaus D. Hartmann

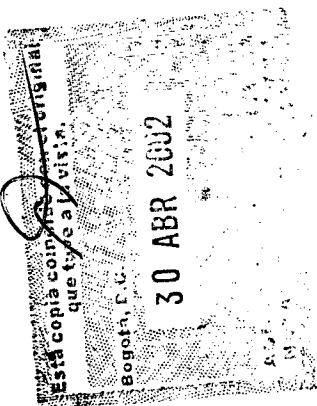


Diese Fotokopie ist eine vollständige und einwandfreie
Wiedergabe der mir vorliegenden Urschrift, was ich hier-
mit beglaubige.

Frankfurt am Main, den 13. Dezember 2001




Gregor Segner, Rechtsanwalt
als amtlich bestellter Vertreter
des Notars Dr. Klaus D. Hartmann



24
8
72.8

3416

República Federal de Alemania

Certificación de prioridad de la presentación de una solicitud de patente

Nº de actas: 199 62 300.7

Día de la solicitud: 23 de diciembre de 1999

Solicitante / propietario: ASTA Medica Aktiengesellschaft, Dresde /
DE

Denominación: Derivados sustituidos del ácido N - bencil -
indol - 3 - il - glioxílico con efecto
antitumoral

CIP: C 07 D, A 61 K

Las certificaciones encuadernadas son una correcta y exacta reproducción
de los documentos originales de esta solicitud de patente.

Munich, 11 de diciembre de 2000

El Presidente de la Oficina Alemana de Patentes y Marcas

Por poder

Reivindicaciones

1. Nuevos derivados sustituidos del ácido N - bencil - indol - 3 - il - glioxílico con efecto antitumoral de fórmula general 1

****Fórmula 1 – de página 17 del original****

donde los radicales R, R₁, R₂, R₃, R₄ y Z tienen el siguiente significado:

R = nitro, amino, mono o di (C₁ - C₆) - alquilamino, mono o di (C₁ - C₆) - cicloalquilamino, (C₁ - C₆) - acilamino, fenil (C₁ - C₆) - alquilamino, aroilamino, heteroaroilamino, (C₁ - C₆) - alquilsulfonamido, arilsulfonamido, maleinimido, succinimido, ftalimido, benciloxycarbonilamino (Z - amino), tert. - butoxycarbonilamino (BOC - amino), 9 - fluorenilmetoxycarbonilamino (Fmoc - amino), trifenilmetilamino (Tr - amino), 2 - (4' - piridil) - etoxycarbonilamino (Pyoc - amino), difenilmetilsilil - amino (DPMS - amino), donde los radicales para R pueden estar sustituidos opcionalmente en los átomos de C 2, 3 y 4 del anillo del fenilo,

R para el caso de que R₁ = hidrógeno y represente el grupo metilo o fenilmetilo, así como el radical benciloxycarbonilo (radical Z), el radical de tert. - butoxycarbonilo (radical BOC) y el grupo acetilo, puede significar además los siguientes radicales:

26
7400

- NH - CH₂ - COOH; - NH - CH (CH₃) - COOH; (CH₃)₂ CH - CH₂ - CH₂ - CH (NH) - COOH; H₃C - CH₂ - CH (CH₃) - CH (NH) - COOH; HOH₂C - CH (NH) - COOH; fenil - CH₂ - CH (NH) - COOH; (4 - imidazoil) - CH₂ - CH (NH) - COOH; HN = C (NH₂) - NH - (CH₂)₃ - CH (NH) - COOH; H₂N - (CH₂)₄ - CH (NH) - COOH; H₂N - CO - CH₂ - CH (NH) - COOH; HOOC - (CH₂)₂ - CH (NH) - COOH

R₁ = hidrógeno, (C₁ - C₆) - alquilo, donde el grupo alquilo puede estar sustituido una o varias veces por el anillo del fenilo y este anillo del fenilo puede estar sustituido a su vez una o varias veces por halógeno, (C₁ - C₆) - alquilo, (C₃ - C₇) - cicloalquilo, por grupos carboxilo, grupos carboxilo esterificados con C₁ - C₆ - alcoholes, grupos trifluorometilo, grupos hidroxilo, grupos metoxi, grupos etoxi, grupos benciloxi, así como por un grupo bencilo sustituido una o varias veces en la parte del fenilo con grupos (C₁ - C₆) - alquilo, átomos de halógeno o grupos trifluorometilo,

R₁ es, además, el grupo benciloxicarbonilo (grupo Z) y el radical de butoxicarbonilo terciario (radical Boc), además es el grupo acetilo.

R₂ puede significar el anillo del fenilo que está sustituido una o varias veces con (C₁ - C₆) - alquilo, (C₁ - C₆) - alcoxi, ciano, halógeno, trifluorometilo, hidroxilo, benciloxi, nitro, amino, (C₁ - C₆) - alquilamino, (C₁ - C₆) - alcoxicarbonil - amino y el grupo carboxilo

27
40
750
6

o carboxilo esterificado con $C_1 - C_6$ - alcoholes, o una estructura de piridina de la fórmula 2 y su N - óxido

****Fórmula 2 – de página 22 ****

y su N - óxido, donde la estructura de piridina está unida opcionalmente a los átomos del carbono anular 2, 3 y 4 y puede estar sustituido con los sustituyentes R_5 y R_6 . Los radicales R_5 y R_6 en la fórmula 2 pueden ser iguales o diferentes y poseer el significado ($C_1 - C_6$) - alquilo y el significado ($C_3 - C_7$) - cicloalquilo, ($C_1 - C_6$) - alcoxi, nitro, amino, hidroxilo, halógeno y trifluorometilo y además, representar el radical de etoxycarbonilamino así como el grupo carboxialquiloxi, en el que el grupo alquilo puede disponer de 1 - 4 átomos de C.

R_2 puede ser, además, un heterociclo de 2 ó 4 - pirimidinilo, donde el anillo de 2 - pirimidinilo puede estar sustituido una o varias veces con el grupo metilo, además puede significar la estructura de 2 -, 3 -, 4 -, 5 -, 6 -, 7 - y 8 - quinolilo sustituida con ($C_1 - C_6$) - alquilo, halógeno, el grupo nitro, el grupo amino y el radical ($C_1 - C_6$) - alquilamino, puede representar un grupo 2 -, 3 - y 4 - quinolilmetilo, donde los carbonos anulares del radical piridilmetilo del grupo quinolilo y del radical quinolilmetilo puede estar sustituido con ($C_1 - C_6$) - alquilo, ($C_1 - C_6$) - alcoxi, nitro, amino y ($C_1 - C_6$) - alcoxycarbonilamino.

78 5

R₂ para el caso de que R₁ = hidrógeno, represente el grupo metilo o bencilo así como el radical benciloxicarbonilo (radical Z), el radical tert. - butoxicarbonilo (radical BOC) y el grupo acetilo, puede significar además los siguientes radicales: - CH₂COOH; - CH (CH₃) - COOH; (CH₃)₂ CH - (CH₂)₂ - CH (COOH) -; H₃C - H₂C - CH (CH₃) - CH (COOH) -; HO - H₂C - CH (COOH) -; fenil - CH₂ - CH (COOH) -; (4 - imidazolil) - CH₂ - CH (COOH) -, HN = C (NH₂) - NH - (CH₂)₃ - CH (COOH) -; H₂N - (CH₂)₄ - CH (COOH) -; H₂N - CO - CH₂ - CH (COOH) -; HOOC - (CH₂)₂ - CH (COOH) -;

R₂ además, para el caso de que R₁ signifique hidrógeno, el grupo Z, el radical BOC, el grupo acetilo o el grupo bencilo, puede ser el radical del ácido de un aminoácido natural o no natural, por ejemplo puede representar el radical α - glicilo, α - sarcosilo, α - alanilo, α - leucilo, α - isoleucilo, α - serilo, α - fenilalanilo, α - histidilo, α - prolilo, α - arginilo, α - lisilo, α - asparagilo y α - glutamilo, donde los grupos amino de los correspondientes aminoácidos pueden estar desprotegidos o protegidos. Como grupo de protección de la función amino se tienen en cuenta el radical carbobenzoxi (radical Z) y el radical tert. - butoxicarbonilo (radical BOC), así como el grupo acetilo. En el caso del radical asparagilo y glutamilo reivindicado para R₂, el segundo grupo carboxilo no unido existe como grupo carboxilo libre o en forma de un grupo carboxilo esterificado con C₁ - C₆ - alcoholes, por ejemplo como éster metílico, éster etílico o éster metilbutílico terciario. Además, R₂ puede significar el grupo

29
42
77-0

alilaminocarbonil - 2 - metil - prop - 1 - ilo. R_1 y R_2 pueden formar, además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo de piperazina de la fórmula 3 ó un anillo de homopiperazina, siempre que R_2 represente un grupo aminoalquileo, donde

****Fórmula 3 – de página 23 del original****

R_7 representa un radical alquilo, significa un anillo de fenilo que puede estar sustituido una o varias veces con ($C_1 - C_6$) alquilo, ($C_1 - C_6$) - alcoxi, halógeno, el grupo nitro, la función amino y con el grupo ($C_1 - C_6$) - alquilamino. R_7 significa, además, el grupo benzhidrilo y el grupo bis - p - fluorobenzhidrilo.

R_3 y R_4 pueden ser iguales o diferentes, y significar hidrógeno, ($C_1 - C_6$) - alquilo, ($C_3 - C_7$) - cicloalquilo, ($C_1 - C_6$) - alcanilo, ($C_1 - C_6$) - alcoxi, halógeno y benciloxi; además, R_3 y R_4 pueden significar el grupo nitro, el grupo amino, el grupo amino sustituido con mono - o di - ($C_1 - C_4$) - alquilo y significar la función ($C_1 - C_6$) - alcoxi - carbonilamino o la función ($C_1 - C_6$) - alcoxycarbonilamino - ($C_1 - C_6$) - alquilo.

Z es O y S.

2. Amida del ácido N - (piridin - 4 - il) - [1 - (4 - aminobencil) - indol - 3 - il] glioxílico (D - 68838)

30
78-6
2

3. Amida del ácido N - (piridin - 4 - il) - [1 - (4 - nitroencil) - indol - 3 - il] - glioxílico (D - 68836)
4. Sales de adición de ácidos de los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 - 4 de fórmula general 1 como sales de ácidos minerales, sales de ácidos orgánicos, en especial ácido acético, ácido láctico, ácido malónico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido glucónico, ácido glucurónico, ácido cítrico, ácido ascórbico, ácido embónico, ácido metansulfónico, ácido trifluoroacético, ácido succínico, ácido 2 - hidroxí - etansulfónico, ácido nicotínico y ácido p - toluensulfónico.
5. Preparados farmacéuticos de los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 - 4 de fórmula general 1 con un contenido de por lo menos uno de los compuestos de fórmula 1 o sus sales de acuerdo con la reivindicación 3 con ácidos inorgánicos u orgánicos de tolerancia fisiológica y eventualmente vehículos y / o diluyentes o excipientes de utilidad farmacéutica.
6. Formas de aplicación de los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 - 4 de la fórmula general 1 con un contenido de por lo menos uno de los compuestos de la fórmula 1 o sus sales de acuerdo con la reivindicación 3 en forma de comprimidos, grageas, cápsulas, soluciones para infusión o ampollas, supositorios, emplastros, preparaciones en polvo de aplicación inhalatoria, suspensiones, cremas y ungüentos.