

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

94

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-137241- -00001-0000

Fecha: 2010-11-11 16:53:14 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMER

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_ D. \_\_\_\_\_

Re: PI.-ASTRAZENECA AB Y BAYER SCHERING PHARMA AG.-Solicitud de  
Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE  
INDAZOLES SUSTITUIDOS CON FENILO O PIRIDINILO".-Clase C07D  
231/56.-Expediente número 10-137.241.-

1. Me refiero a mi solicitud de patente de 4 de Noviembre de 2010.
2. Atentamente me permito allegar los recibos de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 11 a 15. En consecuencia, este juego de reivindicaciones deberá ser estudiado junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibo número 10-94,870 que acredita el pago de la tasa mencionada; y
- (b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por **15** reivindicaciones.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,

  
ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

95

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 94,870  
FECHA : NOVIEMBRE 8 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-137241.-00001-0000

Fecha: 2010-11-11 16:53:14 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 9

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE        | TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PGO  | Vr. PAGO      |
|--------------------|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|---------------|
| LLOREDA Y CIA S. A | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 383647165 | 08/11/2010 | 21,276,700.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO                           | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|------------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-09 | OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I     |                |
|       |             | 99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS | 130,000.00     |
|       |             | TOTAL :                            | \$ 130,000.00  |

SON: CIENTO TREINTA MIL PESOS

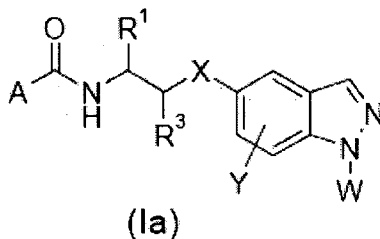
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA  
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VISENTE Y NO PODRA SER  
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

**REIVINDICACIONES**

1.- Un compuesto de fórmula Ia:



donde:

A es alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub> C(O), alquil C<sub>1-6</sub> oxiC(O), NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>C(O) o heteroarilo C<sub>5-10</sub>, todos opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, ciano, hidroxilo, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub> y haloalquilo C<sub>1-4</sub>;

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> se seleccionan independientemente de hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alquil C<sub>1-6</sub> C(O) y cicloalquil C<sub>3-7</sub> C(O), o R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> pueden formar un anillo con el nitrógeno al cual están unidos;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, hidroxialquilo C<sub>1-4</sub>, alquil C<sub>1-4</sub> Oalquilo C<sub>1-4</sub>, alquil C<sub>1-4</sub> tialquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub>;

R<sup>3</sup> es arilo C<sub>5-10</sub>, aril C<sub>5-10</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, aril C<sub>5-10</sub> O, aril C<sub>5-10</sub> alcoxi C<sub>1-4</sub>, ariloxi C<sub>5-10</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, heteroarilo C<sub>5-10</sub>, heteroaril C<sub>5-10</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, heteroaril C<sub>5-10</sub> alcoxi C<sub>1-4</sub> o heteroariloxi C<sub>5-10</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, todos los cuales están sin sustituir o opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de B;

B es hidroxilo, halo, ciano, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, hidroxialquilo C<sub>1-3</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, cicloalquiloxi C<sub>3-6</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, cicloalquil C<sub>3-6</sub> O, cicloalquiltio C<sub>3-6</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, cicloalquiltio C<sub>3-6</sub>, alquil C<sub>1-3</sub> S(O)<sub>k</sub> alquilo C<sub>1-4</sub>, alquilS(O)<sub>k</sub> C<sub>1-3</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub> o haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, o B es uno de los grupos siguientes que están unidos a carbonos adyacentes en un anillo arilo o heteroarilo (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> Oalquenil C<sub>1-4</sub> O(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub> o (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> O(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>;

k es 0, 1;

t y v son, independientemente, 0, 1, 2 ó 3, y t y v no son ambos 0;

X es O o NH;

W es fenilo sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente entre  $(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$ ,  $(\text{CH}_2)_n\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{R}^8$  o  $(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{NR}^9(\text{CR}^{14}\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$ ; y W está además opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ;

$\text{R}^7$  es hidrógeno o alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ;

- 5  $\text{R}^8$  y  $\text{R}^9$  son, independientemente, hidrógeno, alquilo  $\text{C}_{1-4}$  (opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados entre hidroxilo, alcoxi  $\text{C}_{1-4}$ ,  $\text{NH}_2$ , oxo,  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ ,  $\text{NR}^{10}$ alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ,  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}$ alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ,  $\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})$  alquilo  $\text{C}_{1-4}$ , alquiltio  $\text{C}_{1-4}$ , heterociclilo  $\text{C}_{5-10}$ , arilo  $\text{C}_{5-10}$  o heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$ ), cicloalquilo  $\text{C}_{3-7}$  (opcionalmente sustituido con  $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ), heterociclilo  $\text{C}_{5-10}$ , arilo  $\text{C}_{5-10}$ , heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$  o  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ ;
- 10 donde arilo  $\text{C}_{5-10}$  o heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$  están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo  $\text{C}_{1-4}$ , alcoxi  $\text{C}_{1-4}$ ,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ , hidroxilo o ciano; y donde cualquier heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo  $\text{C}_{1-4}$ , alcoxi  $\text{C}_{1-4}$  (alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ), oxo o hidroxilo;

- 15 o  $\text{R}^7$  y  $\text{R}^8$ , junto con el nitrógeno al cual están unidos, forman un anillo de 5 ó 6 miembros que comprende opcionalmente un segundo átomo de nitrógeno en el anillo, donde el anillo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados entre oxo, hidroxilo, hidroxialquilo  $\text{C}_{1-4}$ , alquilo  $\text{C}_{1-4}$ , alcoxi  $\text{C}_{1-4}$  (alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ) o  $(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{O})\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ ;  $\text{R}^{10}$ ,  $\text{R}^{11}$ ,  $\text{R}^{12}$  y  $\text{R}^{13}$  son, independientemente, hidrógeno o alquilo  $\text{C}_{1-4}$ ;

- 20 n y p son, independientemente, 0, 1, 2, 3 ó 4; e

Y es hidrógeno, halo, alquilo  $\text{C}_{1-4}$  o haloalquilo  $\text{C}_{1-4}$ ;

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

2.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde:

A es cicloalquilo  $\text{C}_{3-7}$ , haloalquilo  $\text{C}_{1-6}$  opcionalmente sustituido con ciano;

- 25  $\text{R}^1$  es alquilo  $\text{C}_{1-4}$  o hidroxialquilo  $\text{C}_{1-4}$ ;

$\text{R}^3$  es arilo  $\text{C}_{5-10}$  o heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$  opcionalmente sustituido con alcoxi  $\text{C}_{1-4}$ ;

X es O;

W es fenilo sustituido con  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$ ;

$\text{R}^7$  es hidrógeno;

- 30  $\text{R}^8$  es alquilo  $\text{C}_{1-4}$  (opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados entre hidroxilo,  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ ,  $\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})$ alquilo  $\text{C}_{1-4}$ , heterociclilo  $\text{C}_{5-10}$ , arilo  $\text{C}_{5-10}$  o heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$ ), cicloalquilo  $\text{C}_{3-7}$ , heterociclilo  $\text{C}_{5-10}$  o heteroarilo  $\text{C}_{5-10}$ ,

donde cualquier heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-4</sub> u oxo;  
o R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup>, junto con el nitrógeno al cual están unidos, forman un anillo de 5 ó 6 miembros  
que comprende opcionalmente un segundo átomo de nitrógeno en el anillo, donde el anillo  
está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados entre oxo, hidroxilo,  
5 hidroxialquilo C<sub>1-4</sub> o C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>;  
R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup> y R<sup>13</sup> son hidrógeno; e  
Y es hidrógeno;  
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

3.- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, donde A es difluoroetilo o  
10 ciclopropilo sustituido con ciano; R<sup>1</sup> es metilo o hidroximetilo; R<sup>3</sup> es fenilo o piridilo  
sustituido con metoxi.

4.- El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde W es  
fenilo sustituido con C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>; R<sup>7</sup> es hidrógeno; y  
R<sup>8</sup> es hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxipropilo, hidroxibutilo, aminooxometilo,  
15 aminooxoetilo, aminooxopropilo, aminometiloxometilo, aminometiloxoetilo, ciclopropilo,  
ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, acetilaminometilo, acetilaminoetilo,  
oxoimidazolidinilmetilo, oxoimidazolidiniletilo, oxopirrolidinilmetilo, oxopirrolidiniletilo,  
oxidotetrahidrotiofenilo, dioxidotetrahidrotiofenilo, oxotetrahidrofurano,   
tetrahydrofurano, metildioxooxazolidinilmetilo, dimetildioxooxazolidinilmetilo,  
20 metildioxooxazolidiniletilo, dimetildioxooxazolidiniletilo, indazolilmetilo, indazoliletilo,  
aminooxofenilmetilo,  
aminooxofeniletilo, piridinilo, pirimidilo, pirazinilo, piridazinilo, piridinilmetilo,  
piridiniletilo, indazolilmetilo o indazoliletilo.

5.- El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde W es  
25 fenilo sustituido con C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>; y  
R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> forman juntos pirrolidinilo, oxopirrolidinilo, carbamoilpirrolidinilo,  
hidroximetilpirrolidinilo, hidroxipirrolidinilo, prolinamida, hidroxiprolinamida,  
piperidinilo, hidroxipiperidinilo, oxopiperidinilo, imidazolidinilo, piperazinilo,  
hidroxipiperazinilo, oxopiperazinilo, tetrahidrotiofenilo, oxidotetrahidrotiofenilo,  
30 dioxidotetrahidrotiofenilo, oxotetrahidrofurano o tetrahydrofurano.

6.- Compuestos seleccionados entre  
1-({3-[5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-

- il]fenil}carbonil)-D-prolinamida,  
 N-[(1S,2R)-2-{[1-(3-{[(2R)-2-carbamoilpirrolidin-1-il]carbonil}fenil)-1H-indazol-5-il]oxi}-1-metil-2-feniletil]etanodiamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-(2-  
 5 hidroxietil)benzamida,  
 N-(2-amino-2-oxoetil)-3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]benzamida,  
 N-[(1S)-2-amino-1-metil-2-oxoetil]-3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]benzamida,  
 10 N-[2-(acetilamino)etil]-3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]benzamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-[2-(2-oxoimidazolidin-1-il)etil]benzamida,  
 2,2-difluoro-N-[(1S,2R)-2-{[1-(3-{[(2R)-2-(hidroximetil)pirrolidin-1-il]carbonil}fenil)-1H-  
 15 indazol-5-il]oxi}-1-metil-2-feniletil]propanamida,  
 2,2-difluoro-N-[(1S,2R)-2-{[1-(3-{[(3R)-3-hidroxi-pirrolidin-1-il]carbonil}fenil)-1H-indazol-5-il]oxi}-1-metil-2-feniletil]propanamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-[(3R)-2-oxotetrahidrofuran-3-il]benzamida,  
 20 1-({3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]fenil}carbonil)-L-prolinamida,  
 2,2-difluoro-N-[(1S,2R)-1-metil-2-[(1-{3-[(3-oxopiperazin-1-il]carbonil}fenil)-1H-indazol-5-il]oxi)-2-feniletil]propanamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-[2-  
 25 (2-oxopirrolidin-1-il)etil]benzamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-[2-(5,5-dimetil-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin-3-il)etil]benzamida,  
 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-(1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-il)benzamida,  
 30 3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-(1H-indazol-3-ilmetil)benzamida,  
 N-[(1R)-2-amino-2-oxo-1-feniletil]-3-[5-((1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-

- fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]benzamida,  
 N-(2-amino-2-oxoetil)-3-[5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]-N-metilbenzamida,  
 N-(3-amino-3-oxopropil)-3-[5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]benzamida,  
 5 (4R)-1-({3-[5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]fenil}carbonil)-4-hidroxi-L-prolinamida,  
 1-{[3-(5-({(1R,2S)-2-[(1-cianociclopropil)carbonil]amino)-1-fenilpropil}oxi)-1H-indazol-1-il]fenil}carbonil}-D-prolinamida,  
 10 N-ciclopentil-3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)benzamida,  
 3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)-N-piridin-3-ilbenzamida,  
 3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)-N-(1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-il)benzamida,  
 15 3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)-N-(tetrahidrofuran-3-il)benzamida,  
 3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)-N-(2-hidroxiutil)benzamida,  
 20 N-ciclopentil-3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-3-hidroxi-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)benzamida, y  
 3-(5-({(1R,2S)-2-[(2,2-difluoropropanoil)amino]-1-(6-metoxipiridin-3-il)propil}oxi)-1H-indazol-1-il)-N-(piridin-3-ilmetil)benzamida,  
 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.
- 25 7.- Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, junto con un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.
- 8.- Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para uso en terapia.
- 30 9.- El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 7, en la fabricación de un

medicamento para uso en el tratamiento de un estado de enfermedad mediado por el receptor de glucocorticoides.

10.- El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 7, en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento de afecciones inflamatorias o trastornos respiratorios.

11.- El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 7, en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento del asma.

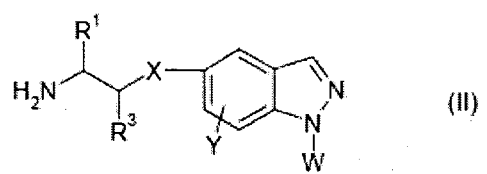
12.- El uso de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 7, en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento de la COPD.

13.- Un método de tratamiento de un estado de enfermedad mediado por el receptor de glucocorticoides, afección inflamatoria, trastorno respiratorio, asma y/o COPD en un mamífero, que comprende administrar a un mamífero que se encuentra en necesidad de dicho tratamiento una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 7.

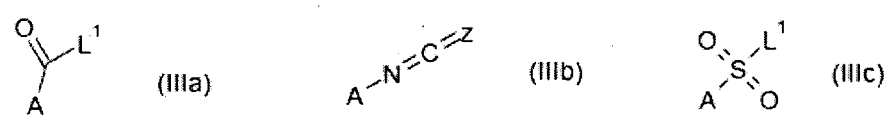
14.- Una combinación de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, y uno o más agentes seleccionados de la lista que comprende:

- un inhibidor de PDE4;
- un agonista selectivo del adrenorreceptor  $\beta$ .sub2.;
- un antagonista del receptor muscarínico;
- un modulador de la función del receptor de quimiocina;
- un inhibidor de la función de la cinasa p38;
- un inhibidor de las metaloproteasas de matriz, dirigido por ejemplo a MMP-2, MMP-9 o MMP-12; o
- un inhibidor de las serina-proteasas neutrófilas, por ejemplo elastasa neutrófila o proteinasa 3.

15.- Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula Ia de acuerdo con la reivindicación 1, mediante acoplamiento de un compuesto de fórmula (II):



con reactivos de acilación de fórmula (IIIa), (IIIb) o (IIIc)



donde R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, A, X e Y son los definidos antes, W es el definido antes y L<sup>1</sup> es un grupo saliente o, cuando L<sup>1</sup> = OH, un grupo saliente generado por reacción de un reactivo de acoplamiento.