



No. 11-028271- -00001-0000

Fecha: 2011-03-16 14:22:45 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 17

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:



Corrección de Error Material



Modificación a una solicitud

②

Nombre: 1. ENANTA PHARMACEUTICALS, INC.
2. ABBOTT LABORATORIES

Dirección: 1. 500 Arsenal Street
Watertown, MA 02472
ESTADOS UNIDOS DE AMERICA
2. 100 Abbott Park Rd.
Abbott Park, IL 60089
ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Nacionalidad o Domicilio:
1. Watertown, MA, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA
2. Abbott Park, IL, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Lugar de Constitución: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Teléfono:
E-mail:

Fax:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección: Calle 94 A No. 7 A-09

Teléfono: 756 0770 Fax: 755 0158

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número 39'779.654 Cual TPA 70,819

④

Número de Expediente:

11.028.271

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio sobre el cual solicito se realice el examen de patentabilidad

⑥

Comprobante de pago No.

11-0023019

Fecha

14 de marzo de 2011

⑦

Anexos:



Comprobante de pago de la tasa.



Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.



Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas



Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS A.

FIRMA


CC 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 CSJ

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página - P2161

10 MAR. 2011

1823-233

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0023019

Bogotá D.C., Marzo 14 de 2011 - 15:02:03

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO

NI 800.174.641

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	20234535	14/03/2011	18.315.950.00

*** Conceptos Pagados ***

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

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

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-028271- -00001-0000

Fecha: 2011-03-16 14:22:45 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 17

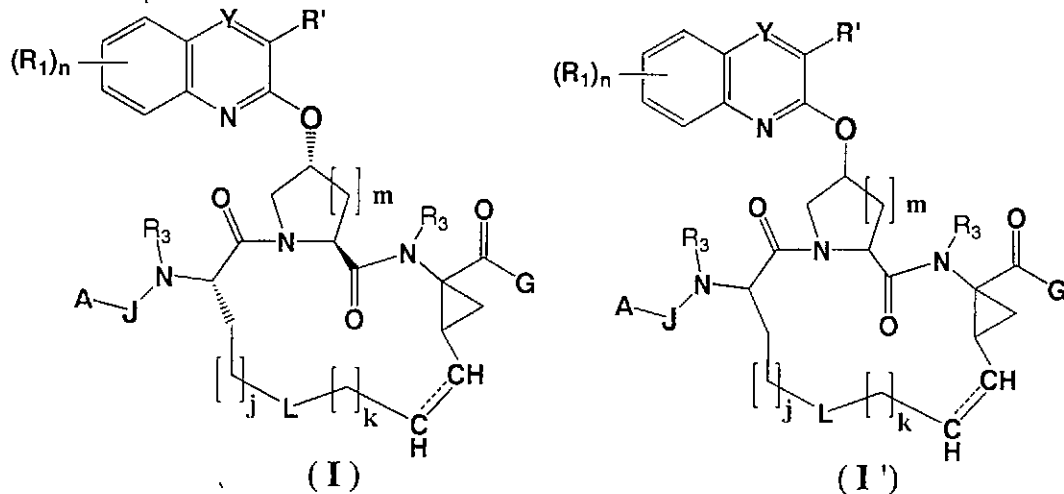
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Marzo 14 de 2011 - 15:02:08

REIVINDICACIONES:

1. Un compuesto de fórmula I o I':



o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo,

donde:

J se encuentra ausente, o es alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido, alquinileno opcionalmente sustituido, $-C(O)-$, $-O-C(O)-$, $-N(R_3)-C(O)-$, $-C(S)-$, $-C(=NR_4)-$, $-S(O)-$, $-S(O)_2-$, o $-N(R_3)-$;

A es alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclo opcionalmente sustituido, o carbociclo opcionalmente sustituido;

Cada R_1 se selecciona independientemente entre

- (i) halógeno, hidroxilo, amino, $-CN$, $-CF_3$, $-N_3$, $-NO_2$, $-OR_4$, $-SR_4$, $-SOR_4$, $-SO_2R_4$, $-N(R_3)S(O)_2-R_4$, $-N(R_3)(SO_2)NR_3R_4$, $-NR_3R_4$, $-C(O)-O-R_4$, $-C(O)R_4$, $-C(O)NR_3R_4$, o $-N(R_3)C(O)R_4$;
- (ii) arilo opcionalmente sustituido;
- (iii) heteroarilo opcionalmente sustituido;
- (iv) heterociclo opcionalmente sustituido;
- (v) carbociclo opcionalmente sustituido; o

(vi) alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N;

G es $-E-R_5$;

donde E se encuentra ausente; o es alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido, alquinileno opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; o $-O-$, $-S-$, $-N(R_3)-$, $-N(R_3)S(O_p)-$, $-N(R_3)C(O)-$, $-N(R_3)C(O)S(O_p)-$, $-OS(O_p)-$, $-C(O)S(O_p)-$, o $-C(O)N(R_3)S(O_p)-$;

p es 0, 1, o 2;

R_5 es H; alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; carbociclo opcionalmente sustituido, heterociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido;

R_3 y R_4 cada uno se selecciona independientemente en cada oportunidad entre los siguientes: alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido; heteroarilo opcionalmente sustituido; heterociclo opcionalmente sustituido; carbociclo opcionalmente sustituido; o hidrógeno;

L se encuentra ausente o se selecciona entre alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido o alquinileno opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N;

Y es N o $-C(R'')-$;

donde A, R_1 , R' y/o R'' se pueden tomar juntos para formar un anillo;

j = 0, 1, 2, 3, o 4;

k = 0, 1, 2, o 3;

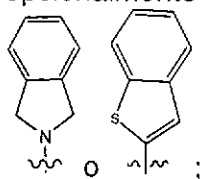
m = 0, 1, o 2;

n es 0, 1, 2, 3, o 4; y

$\equiv$ denota una unión carbono-carbono simple o doble,

donde si Y es N, luego R' es heterociclo opcionalmente sustituido o carbociclo

opcionalmente sustituido, y comprende dos o más anillos fusionados, y donde R' no es



donde si Y es $-C(R'')-$, luego R' y R'' tomados junto con los átomos de carbono a los cuales se encuentran unidos forman un anillo arilo o heteroarilo, cada uno de dichos anillos se sustituye opcionalmente;

siempre que dicho compuesto no sea (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrocicloproa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo.

2. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R' es H, Y es N, y donde k=3, j=1 y L se encuentra ausente.

3. El compuesto de la reivindicación 2, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R₁ es hidrógeno o halógeno, E es $-NHS(O)-$ o $-NHS(O_2)-$, y R₅ es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, piridinilo, pirimidinilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, pirrolidinilo, morfolinilo, piperidinilo, piperazinilo, o imidazolilo, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente.

4. El compuesto de la reivindicación 2, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde J es $-C(O)-$ y A es $-C_1-C_8$ alquilo opcionalmente sustituido, con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido, $-C_1-C_8$ alcoxi opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, $-C_3-C_{12}$ cicloalquilo opcionalmente sustituido, o $-C_3-C_{12}$ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido.

5. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde Y es -C(R'')-, y R' y R'' tomados junto con los átomos de carbono a los cuales se encuentran unidos forman un anillo arilo o heteroarilo, cada uno de dichos anillos se sustituye opcionalmente, y donde k=3, j=1 y L se encuentra ausente.

6. El compuesto de la reivindicación 5, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R₁ es hidrógeno o halógeno; E es -NHS(O)- o -NHS(O₂)-, y R₅ es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, piridinilo, pirimidinilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, pirrolidinilo, morfolinilo, piperidinilo, piperazinilo, o imidazolilo, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente.

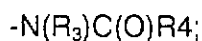
7. El compuesto de la reivindicación 5, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde J es -C(O)- y A es -C₁-C₈ alquilo opcionalmente sustituido, con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido, -C₁-C₈ alcoxi opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, -C₃-C₁₂ cicloalquilo opcionalmente sustituido, o -C₃-C₁₂ heterocicloalquilo opcionalmente sustituido.

8. El compuesto de la reivindicación 5, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R' y R'' juntos forman un arilo opcionalmente sustituido.

9. El compuesto de la reivindicación 5, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R' y R'', y los átomos a los cuales se encuentran unidos, forman un arilo el cual se sustituye con (R₂)_x, donde

cada R₂ se selecciona independientemente entre

- (i) halógeno, hidroxilo, amino, -CN, -CF₃, -N₃, -NO₂, -OR₄, -SR₄, -SOR₄, -SO₂R₄, -NHS(O₂)-R₄, -NHS(O₂)NR₃R₄, -NR₃R₄, -C(O)OR₄, -C(O)R₄, -C(O)NR₃R₄, o



- (ii) arilo opcionalmente sustituido;
- (iii) heteroarilo opcionalmente sustituido;
- (iv) heterociclo opcionalmente sustituido;
- (v) carbociclo opcionalmente sustituido; o
- (iv) alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o

alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N;

y x es 0, 1, 2, 3, o 4.

10. El compuesto de la reivindicación 5, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R₁ es hidrógeno o halógeno; E es -NHS(O)- o -NHS(O₂)-, y R₅ es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, piridinilo, pirimidinilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, pirrolidinilo, morfolinilo, piperidinilo, piperazinilo, o imidazolilo, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente.

11. Un compuesto de la reivindicación 1, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, que se selecciona entre los siguientes:

(2) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(isonicotinamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(3) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(2-fluorobenzamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(4) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)-5-metilisoxazol-3-

carboxamida;

(5) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metilpirazin-2-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(6) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)isoxazol-5-carboxamida;

(7) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)tiazol-4-carboxamida;

(8) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1-metil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(9) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-6-(pirimidin-4-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(10) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(11) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(3-fluorobenzamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(12) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo;

(13) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)-5-metilisoxazol-3-carboxamida;

(14) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metilpirazin-2-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(15) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1-metil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(16) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida; y

(17) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzofuran-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-6-(pirimidin-4-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

12. Un compuesto de la reivindicación 1, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, que se selecciona entre los siguientes:

(24) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo;

(25) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-6-

(pirazin-2-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(26) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-

(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de
ciclopentilo;

(27) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metil-1H-pirazol-3-

carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-

1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-

a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(28) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-

(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)-5-metilisoxazol-3-
carboxamida;

(29) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metilpirazin-2-carboxamido)-

5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(30) N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-

(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)tiazol-5-carboxamida;

(31) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(2-fluorobenzamido)-5,16-dioxo-

2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(32) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-6-

(piridazin-4-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(33) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-6-

(pirimidin-4-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-

hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(34) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1-metil-1H-pirazol-3-

carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-

1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(35) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(2-hidroxi-2-metilpropanamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(36) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida;

(37) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-2-(2-fluorofenantridin-6-iloxi)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de ciclopentilo;

(38) (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-2-(2,9-difluorofenantridin-6-iloxi)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo;

(39) (2R,6S,13aR,14aR,16aS)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)octadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo;

(40) (2R,6S,13aR,14aR,16aS)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)octadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de ciclopentilo; y

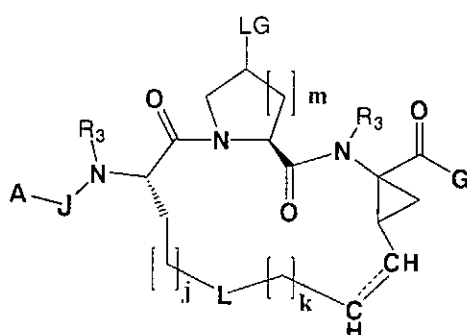
(41) (2R,6S,13aR,14aR,16aS)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-14a-(tiofen-2-ilsulfonilcarbamoil)octadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo.

13. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de la reivindicación 1 o una sal, éster o prodroga aceptable

farmacéuticamente del mismo, en combinación con un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

14. Un método para el tratamiento de una infección viral en un sujeto, que comprende administrar al sujeto una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de la reivindicación 1 o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Un método para producir un compuesto de fórmula I, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende el paso de hacer reaccionar un compuesto de fórmula II:



(II);

donde,

J se encuentra ausente, o es alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido, alquinileno opcionalmente sustituido, -C(O)-, -O-C(O)-, -N(R₃)-C(O)-, -C(S)-, -C(=NR₄)-, -S(O)-, -S(O₂)-, o -N(R₃)-;

A es alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclo opcionalmente sustituido, o carbociclo opcionalmente sustituido;

G es -E-R₅;

donde E se encuentra ausente; o es alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido, alquinileno opcionalmente sustituido, cada uno con

0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; o -O-, -S-, -N(R₃)-, -N(R₃)S(O_p)-, -N(R₃)C(O)-, -N(R₃)C(O)S(O_p)-, -OS(O_p)-, -C(O)S(O_p)-, o -C(O)N(R₃)S(O_p)-;

p es 0, 1, o 2;

R₅ es H; alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; carbociclo opcionalmente sustituido, heterociclo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, o heteroarilo opcionalmente sustituido;

Cada R₃ se selecciona independientemente en cada oportunidad entre los siguientes: alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido; heteroarilo opcionalmente sustituido; heterociclo opcionalmente sustituido; carbociclo opcionalmente sustituido; o hidrógeno;

L se encuentra ausente o se selecciona entre alquileo opcionalmente sustituido, alquenileno opcionalmente sustituido o alquinileno opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N;

j = 0, 1, 2, 3, o 4;

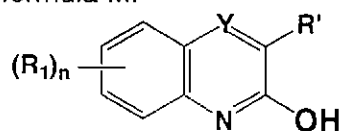
k = 0, 1, 2, o 3;

m = 0, 1, o 2; y

==== denota una unión carbono-carbono simple o doble; y

LG es un grupo saliente;

con un compuesto de fórmula III:



(III);

donde:

Cada R₁ se selecciona independientemente entre

(i) halógeno, hidroxilo, amino, -CN, -CF₃, -N₃, -NO₂, -OR₄, -SR₄, -SOR₄, -SO₂R₄,

$-N(R_3)S(O)_2-R_4$, $-N(R_3)S(O)_2NR_3R_4$, $-NR_3R_4$, $-C(O)OR_4$, $-C(O)R_4$, $-C(O)NR_3R_4$, o $-N(R_3)C(O)R_4$;

- (ii) arilo opcionalmente sustituido;
- (iii) heteroarilo opcionalmente sustituido;
- (iv) heterociclo opcionalmente sustituido;
- (v) carbociclo opcionalmente sustituido; o
- (vi) alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N;

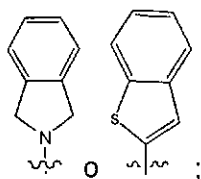
R_3 y R_4 cada uno se selecciona independientemente en cada oportunidad entre los siguientes: alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido o alquinilo opcionalmente sustituido, cada uno con 0, 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados entre O, S, o N; arilo opcionalmente sustituido; heteroarilo opcionalmente sustituido; heterociclo opcionalmente sustituido; carbociclo opcionalmente sustituido; o hidrógeno;

n es 0, 1, 2, 3, o 4;

Y es N o CR'' ;

donde A , R_1 , R' y/o R'' se pueden tomar juntos para formar un anillo;

donde si Y es N, luego R' es heterociclo opcionalmente sustituido o carbociclo opcionalmente sustituido, y comprende dos o más anillos fusionados, y donde R' no es



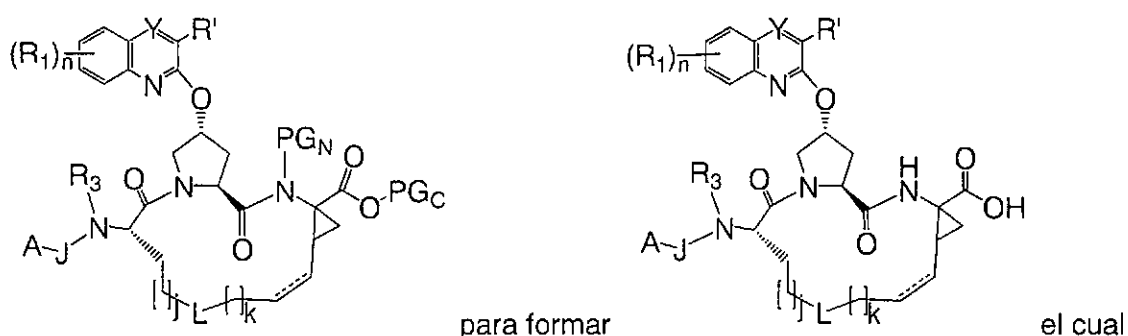
donde si Y es $-C(R'')$, luego R' y R'' tomados junto con los átomos de carbono a los cuales se encuentran unidos forman un anillo arilo o heteroarilo, cada uno de dichos anillos se sustituye opcionalmente;

siempre que dicho compuesto no sea (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-2-(3-(benzo[d]tiazol-2-il)quinoxalin-2-iloxi)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrol[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato de tert-butilo;

250

para de esa manera producir un compuesto de fórmula I.

16. Un método para preparar un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, o una sal, éster o prodroga farmacéuticamente aceptable del mismo, que comprende desproteger



luego se hace reaccionar con H-G para formar dicho compuesto, donde PG_N es grupo protector de amino y PG_C es un grupo protector de ácido carboxílico.

17. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es tert-butil (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-ilcarbamato.

18. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-6-(pirazin-2-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

19. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)-5-metilisoxazol-3-carboxamida.

20. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metilpirazin-2-carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

21. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es N-((2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-14a-(ciclopropilsulfonilcarbamoil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-6-il)tiazol-5-carboxamida.

22. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-6-(piridazin-4-carboxamido)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

23. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(2-hidroxi-2-metilpropanamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

24. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.

252

25. El compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE es (2R,6S,13aS,14aR,16aS,Z)-N-(ciclopropilsulfonil)-6-(5-metil-1H-pirazol-3-carboxamido)-5,16-dioxo-2-(fenantridin-6-iloxi)-1,2,3,5,6,7,8,9,10,11,13a,14,14a,15,16,16a-hexadecahidrociclopropa[e]pirrolo[1,2-a][1,4]diazaciclopentadecin-14a-carboxamida.