

OLARTE RAISBECK

OLARTE RAISBECK MOURE & CASTRO LTDA.


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-003340-00014-0000

Fecha: 2010-04-16 17:08:19 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379-FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 122

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2002/000062

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: SCHERING CORPORATION Y
DENDREON SAN DIEGO CORPORATION

Dirección: 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth,
NJ 07033-0530 E.U.A., y 3030 Science Park Road,
San Diego, CA 92121

Nacionalidad o Domicilio: Estadounidense

Lugar de Constitución: Estados Unidos de
America

Teléfono: _____ **Fax:** _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: Diagonal 34 No. 5-28
Bogotá

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
03-003.340

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se eliminaron las
Reivindicaciones 2, 3, 30, 31, 33, 35-38, 42, 44-50, 63, 65-85, 88, 90-103.

Se adicionó la Reivindicación 47, compuesta por las estructuras de las antiguas
Reivindicaciones 66 a 85. Se eliminó el término prófarmaco.

6

Comprobante de pago No. 10-28,751

Fecha 14 de abril 2010

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de Modificaciones, y Capitulo Reivindicatorio
Modificado.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

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

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA:

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

2297
2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 28,751
FECHA : ABRIL 14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-003340- -00014-0000

Fecha: 2010-04-16 17:08:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 122

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	174686422	14/04/2010	1,976,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12		MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

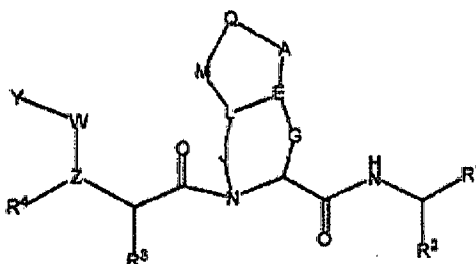
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto, que incluye enantiómeros, esteroisómeros, rotámeros, tautómeros y racematos, de dicho compuesto, y sus sales aceptables para uso farmacéutico o los solvatos de dicho compuesto, dicho compuesto posee la estructura que se muestra en la Fórmula I:



Fórmula I

en la cual:

Y se selecciona del grupo que consiste de los siguiente grupos funcionales: alquilo, alquil-arilo, heteroalquilo, heteroarilo, aril-heteroarilo, alquil-heteroarilo, cicloalquilo, alquiloxi, alquil-ariloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloalquiloxi, cicloalquiloxi, alquilamino, arilamino, alquil-arilamino, arilamino, heteroarilamino, cicloalquilamino y heterocicloalquilamino, con la condición de que Y puede ser sustituido en forma opcional con X^{11} o X^{12} ;

X^{11} es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, alquilarilo, arilalquilo, heteroarilo, alquilheteroarilo, o heteroarilalquilo, con la condición de que X^{11} puede sustituirse en forma opcional con X^{12} ;

X^{12} es hidroxilo, alcoxi, ariloxi, tio, alquiltio, ariltio, amino, alquilamino, arilamino, alquilsulfonilo, alquilsulfonamido, arilsulfonamido, carboxi, carbalcoxi, carboxamido, alcoxicarbonilamino, alcoxicarboniloxi, alquilureido, arilureido, alógeno, ciano, o nitro, con la condición de que dicho alquilo, alcoxi, y arilo pueden sustituirse en forma opcional con grupos funcionales seleccionados en forma independiente de X^{12} ;

R^1 es $\text{COCONR}^9\text{R}^{10}$, donde R^9 es H, R^{10} es H, R^{14} , $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]_p\text{COOR}^{11}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]_p\text{CONR}^{12}\text{R}^{13}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]_p\text{SO}_2\text{R}^{11}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]_p\text{SO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]_p\text{COR}^{11}$,

$\text{CH}(\text{R}^{1'})\text{CONHCH}(\text{R}^{2'})\text{COOR}^{11}$, $\text{CH}(\text{R}^{1'})\text{CONHCH}(\text{R}^{2'})\text{CONR}^{12}\text{R}^{13}$, o $\text{CH}(\text{R}^{1'})\text{CONHCH}(\text{R}^{2'})\text{(R}^{1'})$, donde $\text{R}^{1'}$, $\text{R}^{2'}$, R^{11} , R^{12} , y R^{13} se seleccionan en forma independiente del grupo que comprende H, alquilo, arilo, heteroalquilo, heteroarilo, cicloalquilo, alquil-arilo, alquil-heteroarilo, aril-alquilo y heteroaralquilo, y donde R^{14} es H, alquilo, arilo, heteroalquilo, heteroarilo, cicloalquilo, alquil-arilo, alquil-heteroarilo, aril-alquilo, alquenilo, alquinilo o heteroaralquilo;

Z se selecciona de O, N, H, CH, o CR;

W puede estar presente o ausente, y si W está presente, W se selecciona de C=O, C=S, C(=N-CN) o SO₂;

Q puede estar presente o ausente, y cuando Q está presente, Q es CH, N, P, (CH₂)_p, (CHR)_p, (CRR')_p, O, NR, S o SO₂; y cuando Q está ausente, M puede estar presente o ausente; cuando Q y M están ausentes, A se enlaza directamente a L;

A es O, CH₂, (CHR)_p, (CHR-CHR')_p, (CRR')_p, NR, S o SO₂ o un enlace;

E es CH, N, CR, o un doble enlace hacia, A, L o G;

G puede estar presente o ausente, y cuando G está presente, G es (CH₂)_p, o (CRR')_p; y cuando G está ausente, J está presente y E está enlazado directamente al átomo de carbono así como G se encuentra enlazado en la Fórmula I;

J puede estar presente o ausente, y cuando J está presente, J es (CH₂)_p, (CHR)_p, o (CRR')_p, SO₂, NH, NR u O; y cuando J está ausente, G está presente y E está unido directamente al N que se muestra en la Fórmula I unido a J;

L puede estar presente o ausente, y cuando L está presente, L es CH, CR, O, S o NR; y cuando L está ausente, entonces M puede estar presente o ausente, y si M está presente cuando L está ausente, entonces M se enlaza en forma directa e independiente a E, y J se enlaza directa e independientemente a E;

M puede estar presente o ausente, y cuando M está presente, M es O, NR, S, SO₂, (CH₂)_p, (CHR)_p(CHR-CHR)_p, o (CRR')_p;

p es un número de 0 a 6; y

R, R', R², R³ y R⁴ se seleccionan de forma independiente del grupo que comprende H; alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀; cicloalquilo C₃-C₈, heterocicloalquilo, alcoxi, ariloxi, alquiltio, ariltio, amino, amido, éster, ácido carboxílico, carbamato, urea, cetona, aldehído, ciano, nitro halógeno; (cicloalquilo)alquilo y (heterocicloalquilo)alquilo, donde dicho cicloalquilo está formado por tres a ocho átomos de carbono, y de cero a seis átomos de oxígeno, nitrógeno, azufre o fósforo, y

5

dicho alquilo es de 1 a seis átomos de carbono; arilo, heteroarilo, alquil-arilo y alquil-heteroarilo;

donde dichos grupos funcionales alquilo, heteroalquilo, alquenilo heteroalquenilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo pueden ser sustituidos opcionalmente y químicamente apropiado para la química, donde dicho término "sustituidos" se refiere a una sustitución opcional y químicamente apropiada con uno o más grupos funcionales seleccionados del grupo que comprende alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, cicloalquilo, heterocíclico, halógeno, hidroxilo, tio, alcoxi, ariloxi, alquiltio, ariltio, amino, amido, éster, ácido carboxílico, carbamato, urea, cetona, aldehído, ciano, nitro, sulfonamido, sulfóxido, sulfato, sulfonil urea, hidrazina, e hidroxamato;

además donde dicha unidad N-C-G-E-L-J-N representa una estructura de anillo cíclico de cinco a seis miembros con la condición de que cuando dicha unidad N-C-G-E-L-J-N representa una estructura de anillo cíclico de cinco miembros, o cuando la estructura de anillo bicíclico de la Fórmula I comprende N, C, G, E, L, J, N, A, Q y M representa una estructura de anillo cíclico de cinco miembros, dicha estructura de anillo cíclico de cinco miembros carece de un grupo carbonilo como parte del anillo cíclico.

2. El compuesto de la Reivindicación 1, en el cual R^{10} es H, R^{14} , $[CH(R^{1'})]_pCOOR^{11}$, $CH(R^{1'})CONR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})CONR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2R^{11}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2NR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})COR^{11}$, $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR^{11}$, $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR^{12}R^{13}$, o $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})(R')$, en donde $R^{1'}$ es H o alquilo, y $R^{2'}$ es fenilo, fenilo sustituido, fenilo sustituido por un heteroátomo, tiofenilo, cicloalquilo, piperidilo o piridilo.

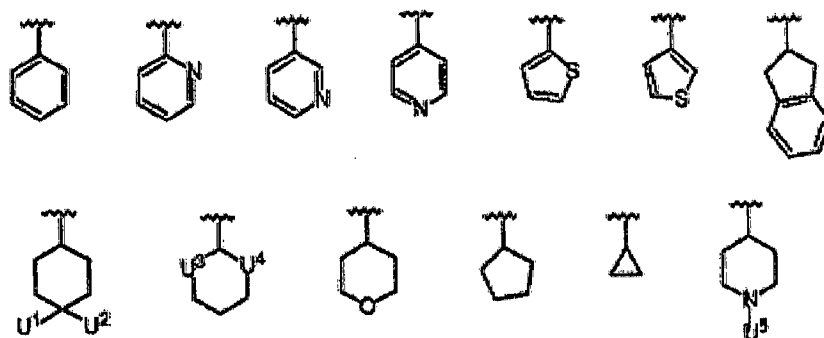
3. El compuesto de la Reivindicación 2, en el cual $R^{1'}$ es H.

4. El compuesto de la Reivindicación 3, en donde R^{11} es H, metilo, etilo, alilo, terbutilo, bencilo, α -metilbencilo, α,α -dimetilbencilo, 1-metilciclopropilo o 1-metilciclopropilo;

R' es hidroximetilo o $CH_2CONR^{12}R^{13}$;

$R^{2'}$ se selecciona de forma independiente del grupo que consta de:

2301
6



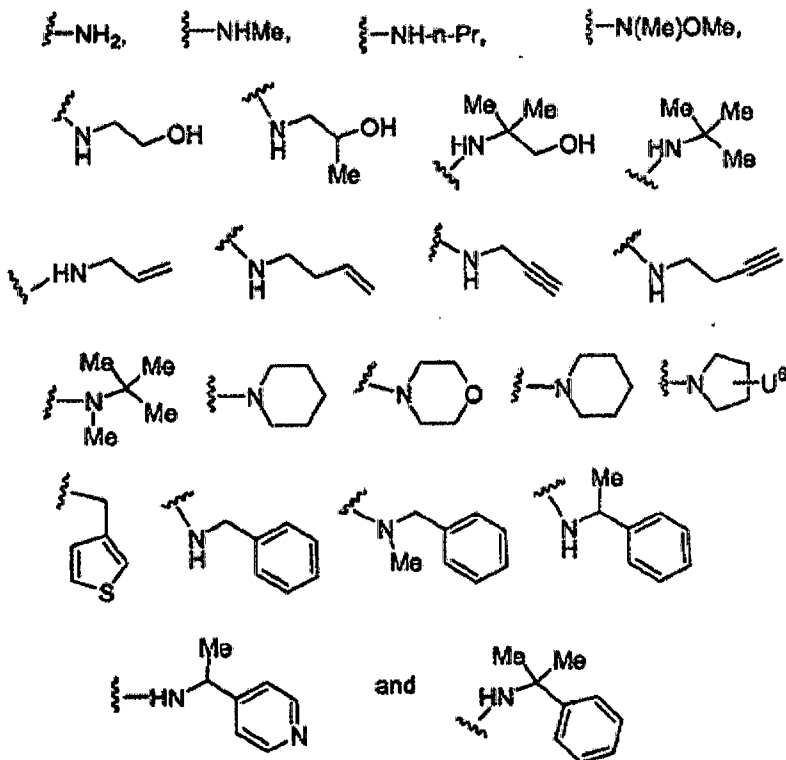
en donde:

U^1 y U^2 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre H, F, CH_2COOH , CH_2COOMe , CH_2CONH_2 , $CH_2CONHMe$, CH_2CONMe_2 azido, amino, hidroxilo, amino sustituido, hidroxilo sustituido;

U^3 y U^4 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de O y S;

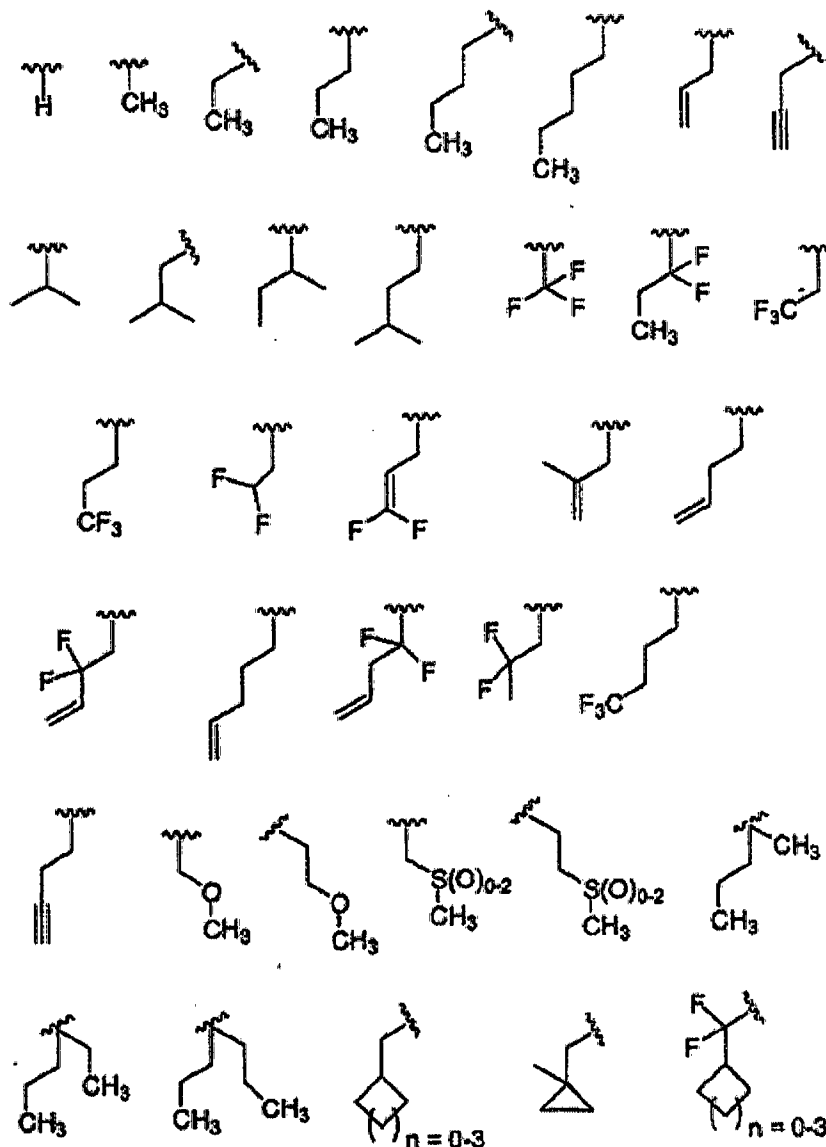
U^5 se selecciona de los grupos funcionales que consisten de alquilo, sulfonilo, aril-sulfonilo, heteroalquil-sulfonilo, heteroaril-sulfonilo, alquil-carbonilo, aril-carbonilo, heteroalquilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, alcoxicarbonilo, ariloxycarbonilo, heteroariloxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, heteroarilaminocarbonilo o una combinación de estos;

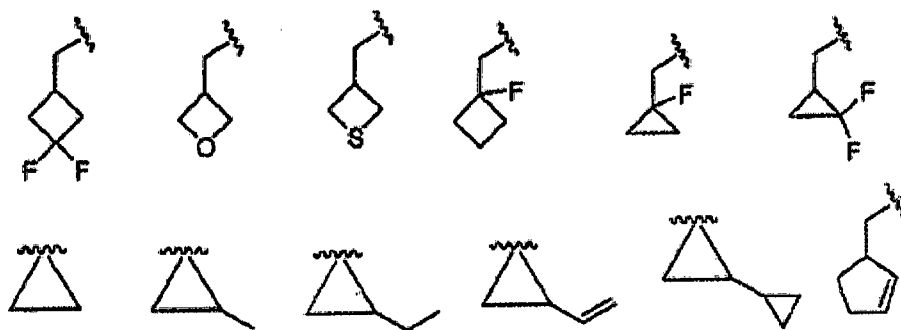
y $NR^{12}R^{13}$ se selecciona del grupo que comprende:



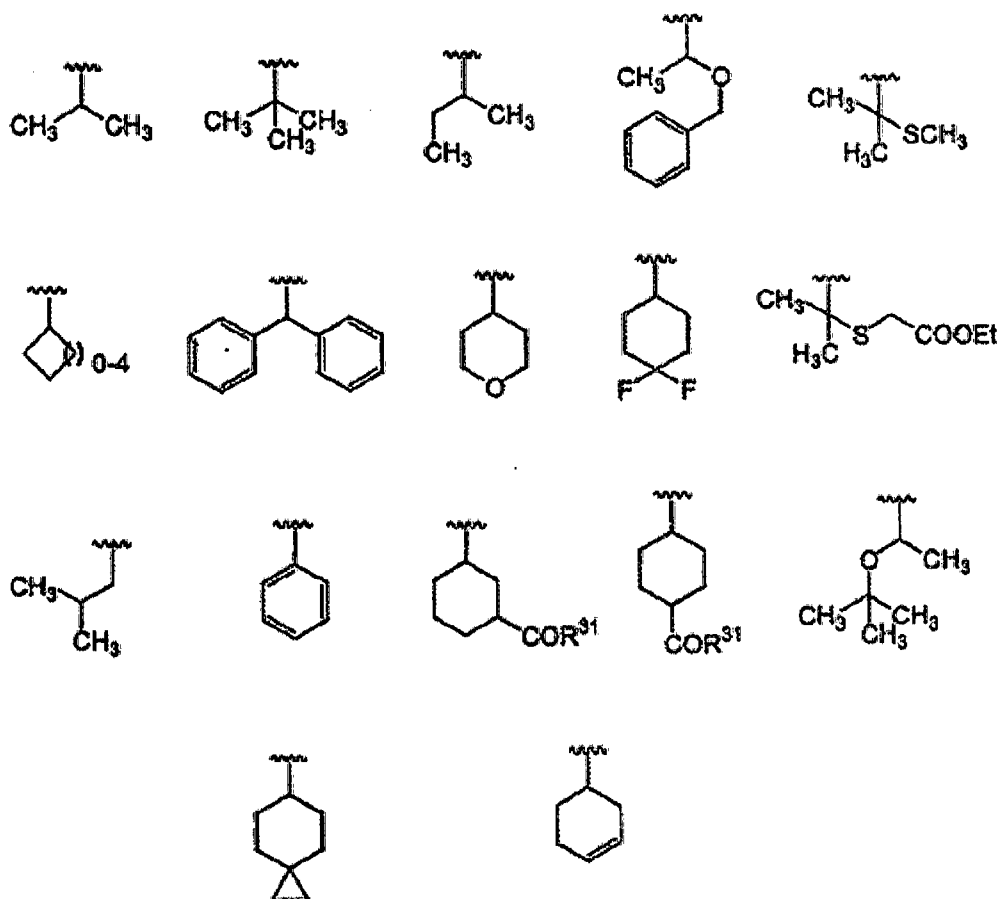
1

5. El compuesto de la Reivindicación 1 en donde R^2 se selecciona del grupo que comprende las siguientes fracciones:

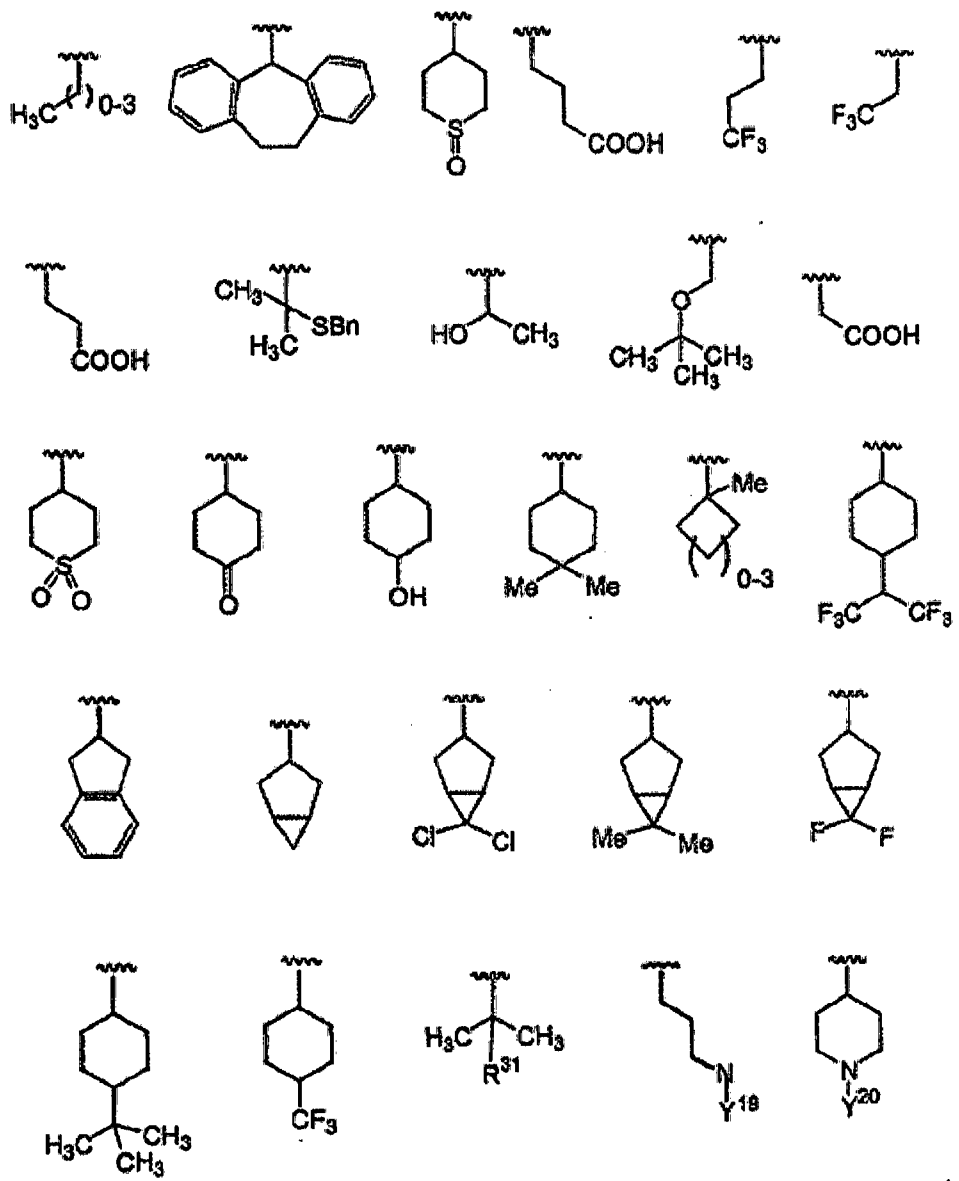




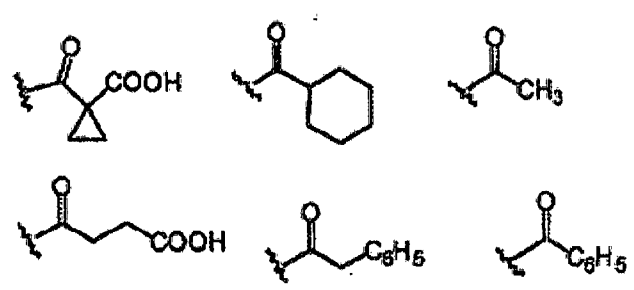
6. El compuesto de la Reivindicación 5, en el cual R^3 se selecciona del grupo que consiste de:



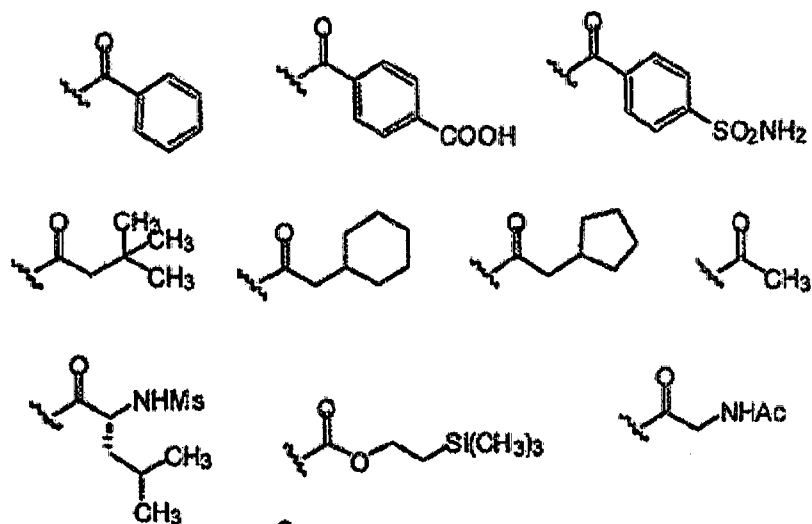
9



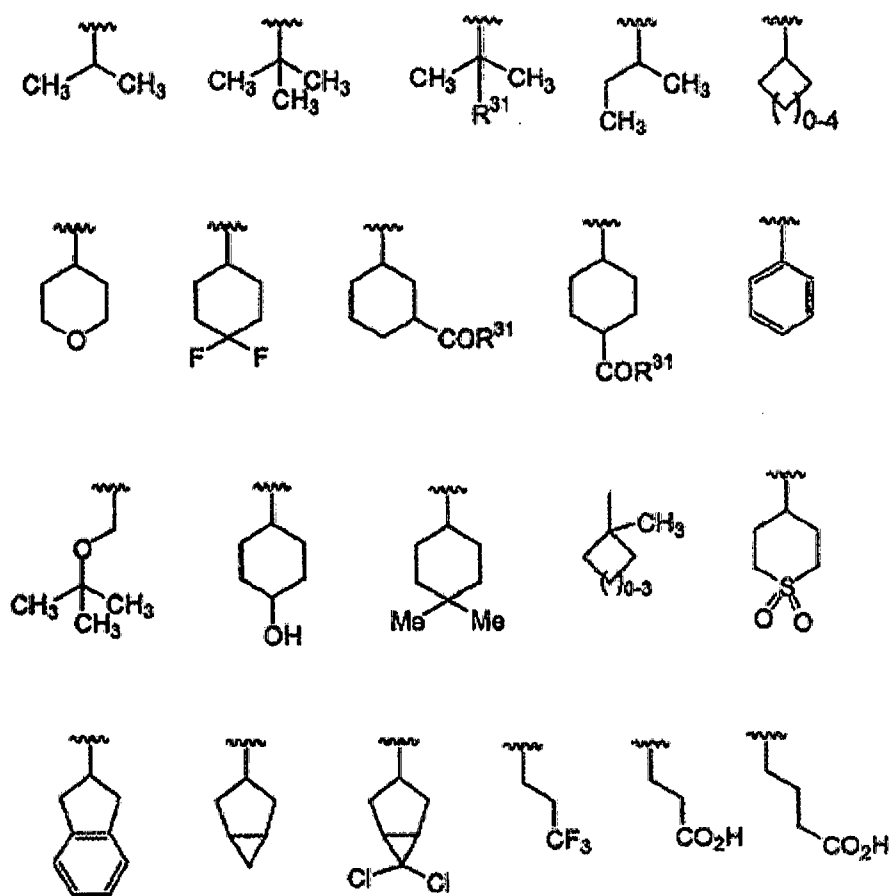
donde $R^{31} = OH$ u OH-alquilo;
 Y^{19} se selecciona de las siguientes fracciones:



e Y^{20} se selecciona de las siguientes fracciones:



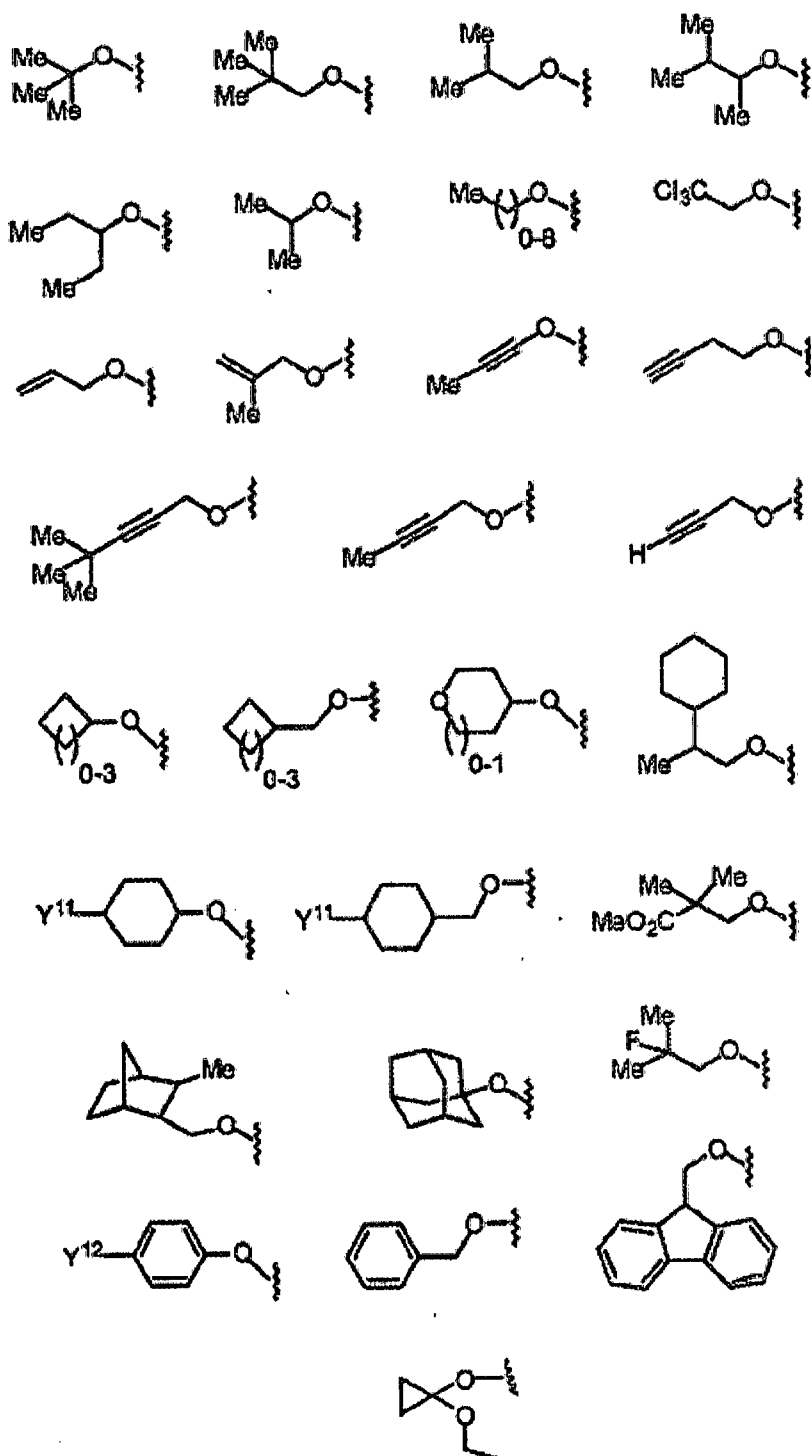
7. El compuesto de la Reivindicación 6, en el cual R³ se selecciona del grupo que consiste de las siguientes fracciones:



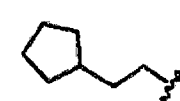
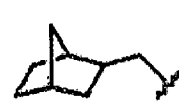
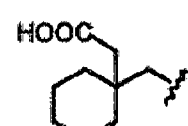
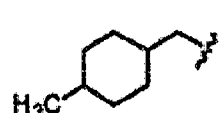
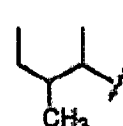
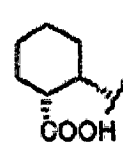
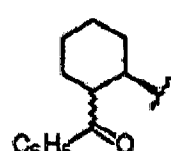
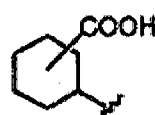
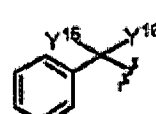
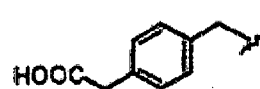
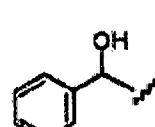
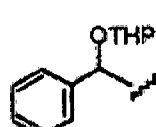
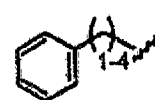
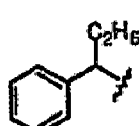
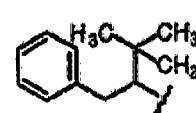
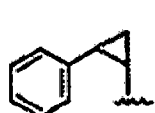
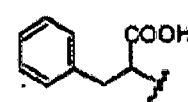
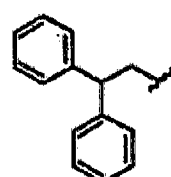
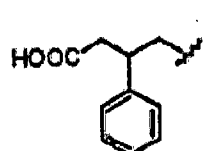
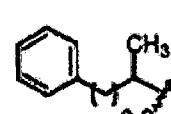
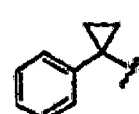
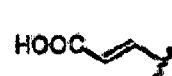
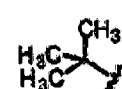
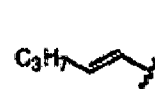
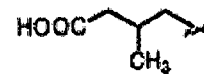
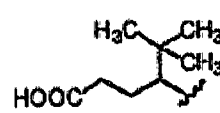
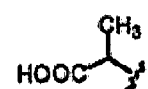
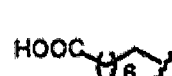
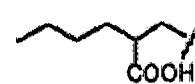
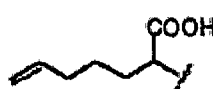
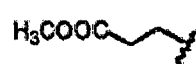
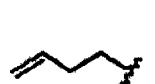
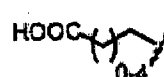
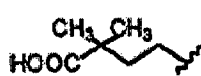
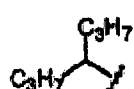
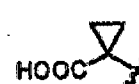
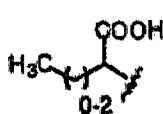
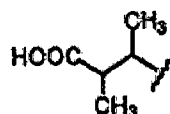
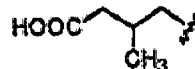
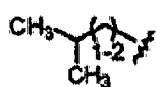
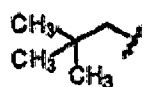
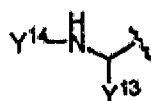
8. El compuesto de la Reivindicación 7, en el cual Z es N y R⁴ es H.

9. El compuesto de la Reivindicación 8, en el cual W es C=O.

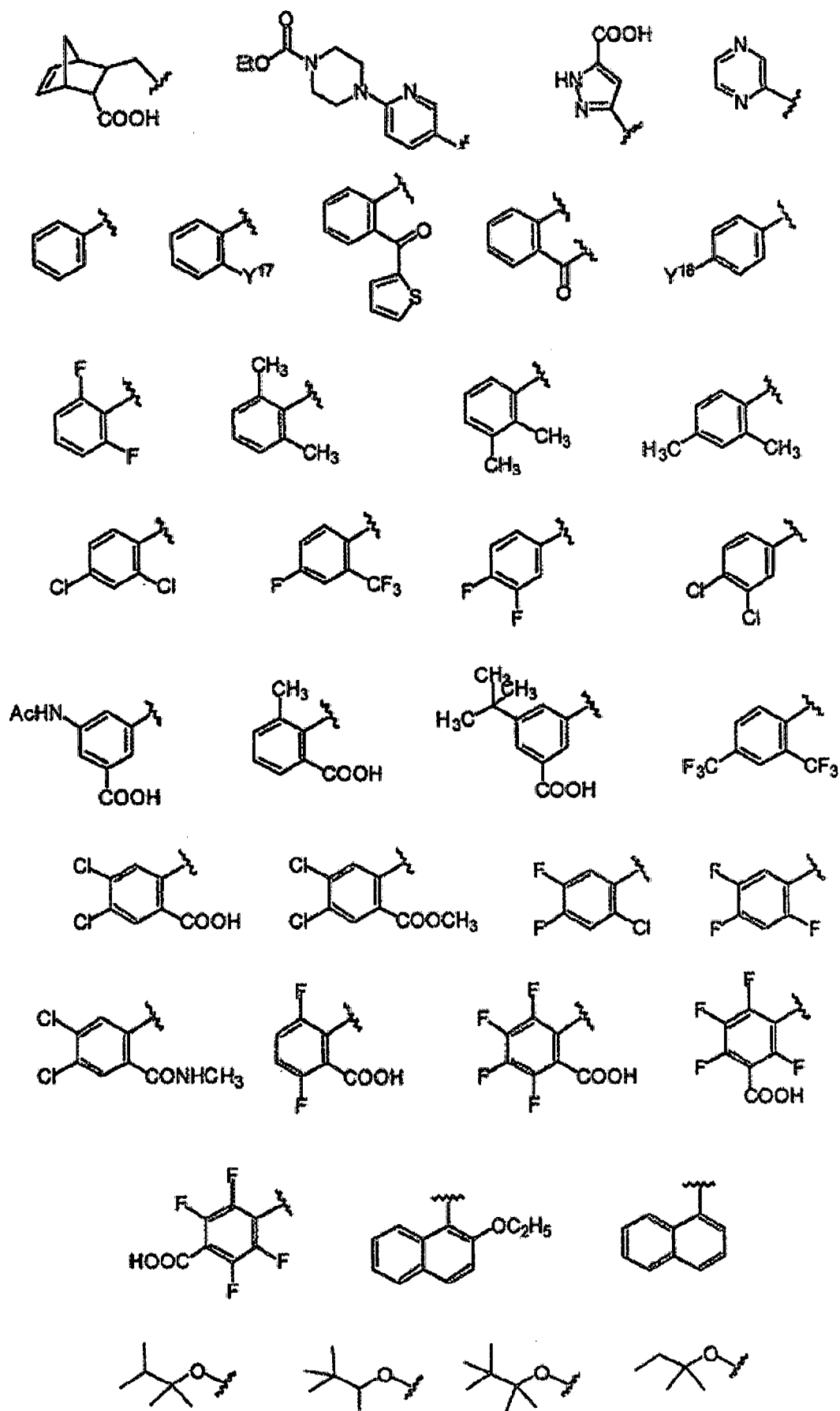
10. El compuesto de la Reivindicación 9, en el cual Y se selecciona de las siguientes fracciones:



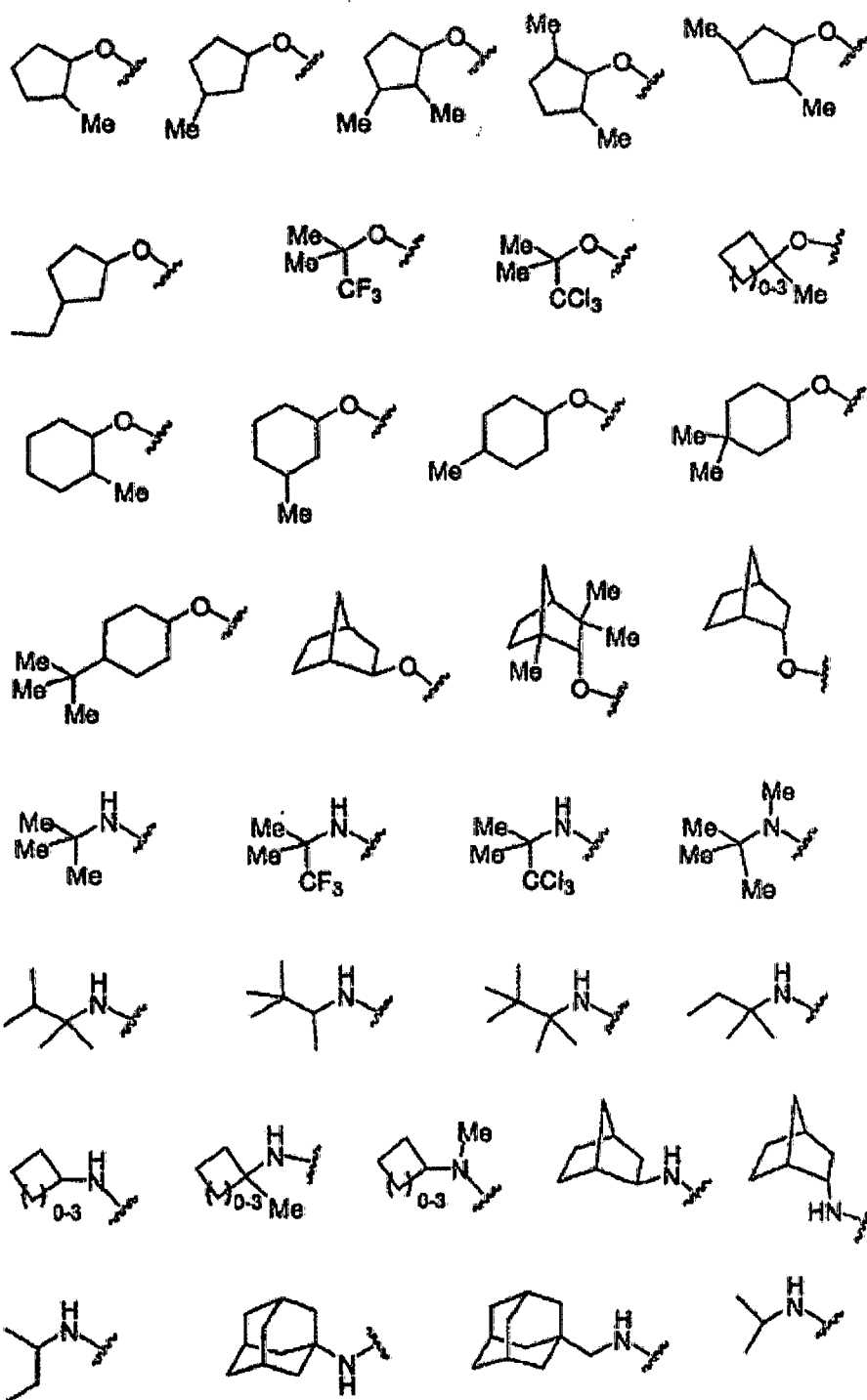
12



B



H



donde

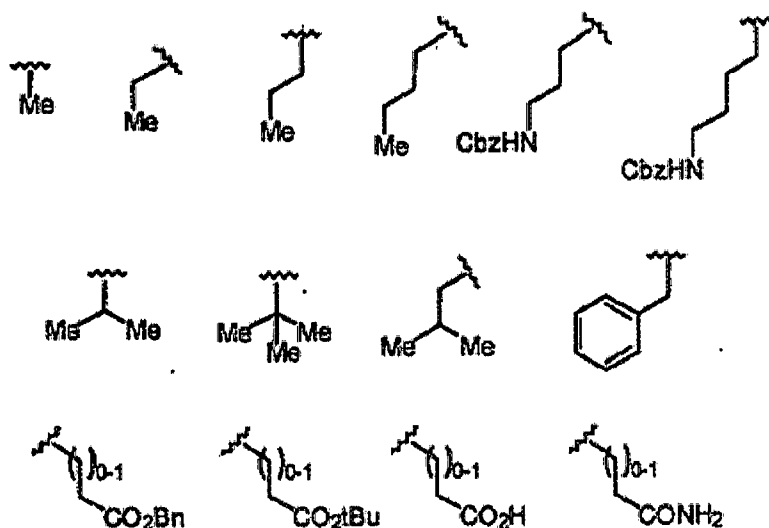
Y^{11} se selecciona de H, COOH, COOEt, OMe, Ph, OPh, NHMe, MHAc, NHPh, CH(Me)₂, 1-triazolilo, 1-imidazolilo, y NHCH₂COOH;

Y^{12} se selecciona de H, COOH, COOMe, OMe, F, Cl, o Br;

Y^{13} se selecciona de las siguientes fracciones:

23/10

B



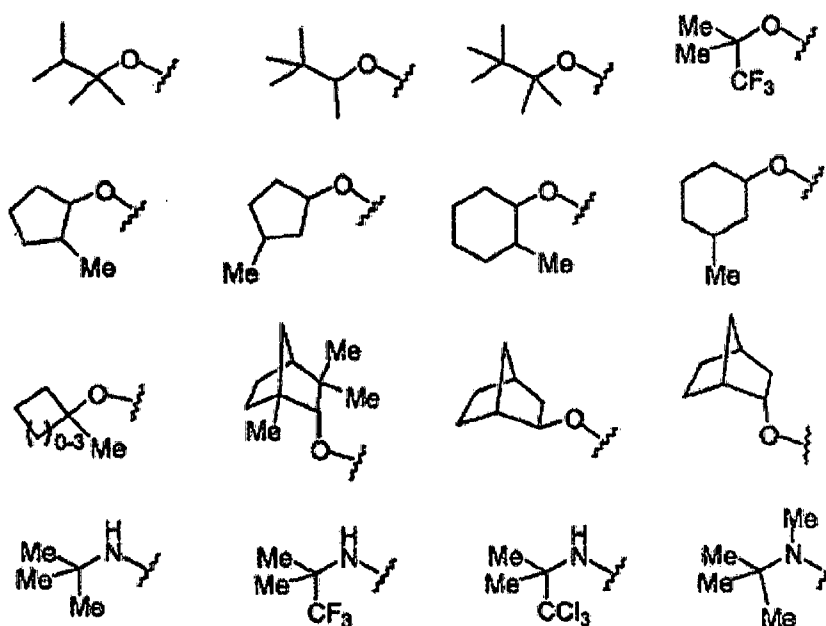
Y¹⁴ se selecciona de MeSO₂, Ac, Coc, iBoc, Cbz o Alloc;

Y¹⁵ e Y¹⁶ se seleccionan de forma independiente de alquilo, arilo, heteroalquilo, y heteroarilo;

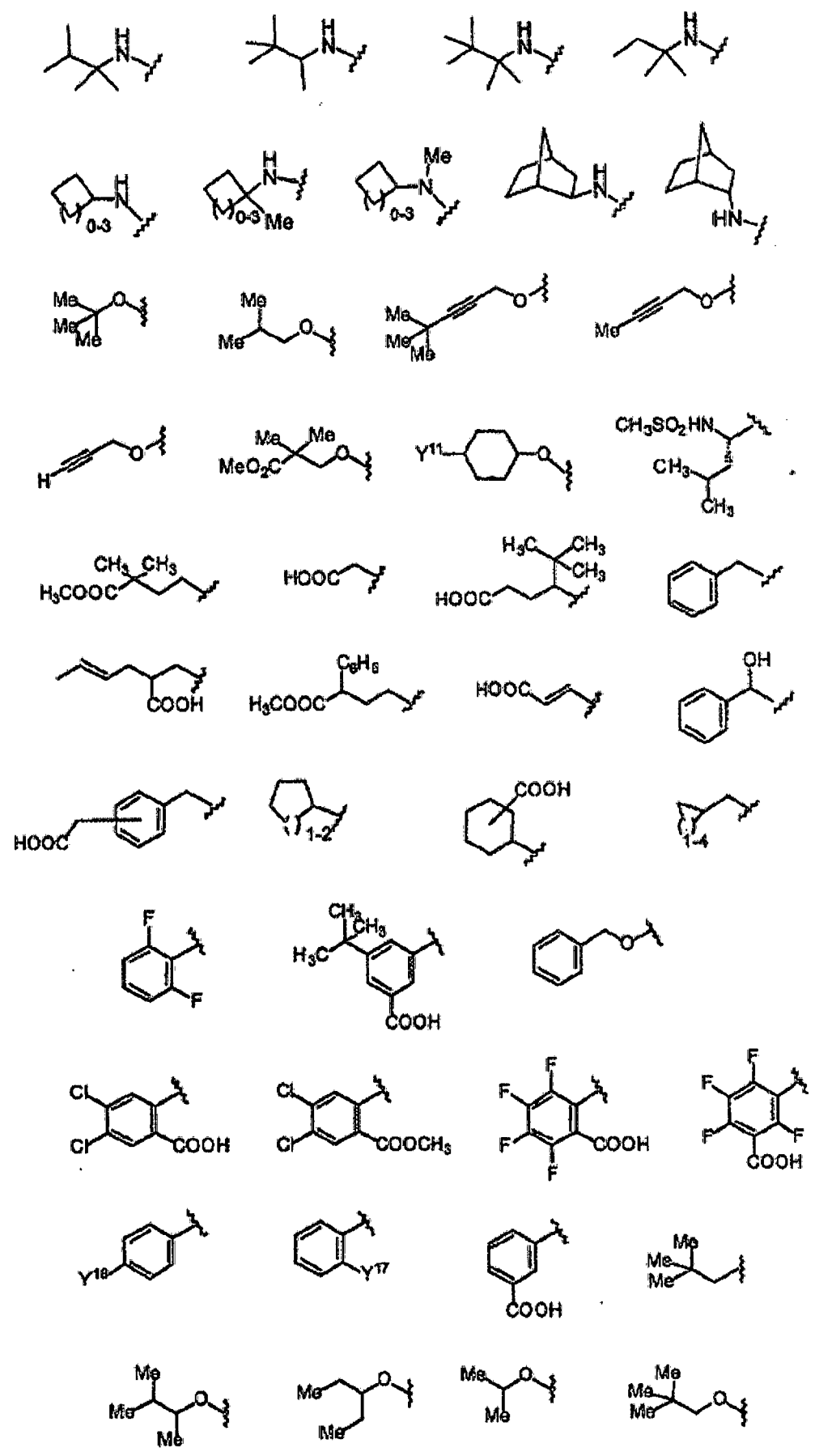
Y¹⁷ es CF₃, NO₂, CONH₂, OH, COOCH₃, OCH₃, OC₆H₅, C₆H₅, COC₆H₅, NH₂, o COOH, y

Y¹⁸ es COOCH₃, NO₂, N(CH₃)₂, F, OCH₃, CH₂COOH, COOH, SO₂NH₂, o NHCOCH₃.

11. El compuesto de la Reivindicación 10, en el cual Y se selecciona del grupo que consiste de:



16



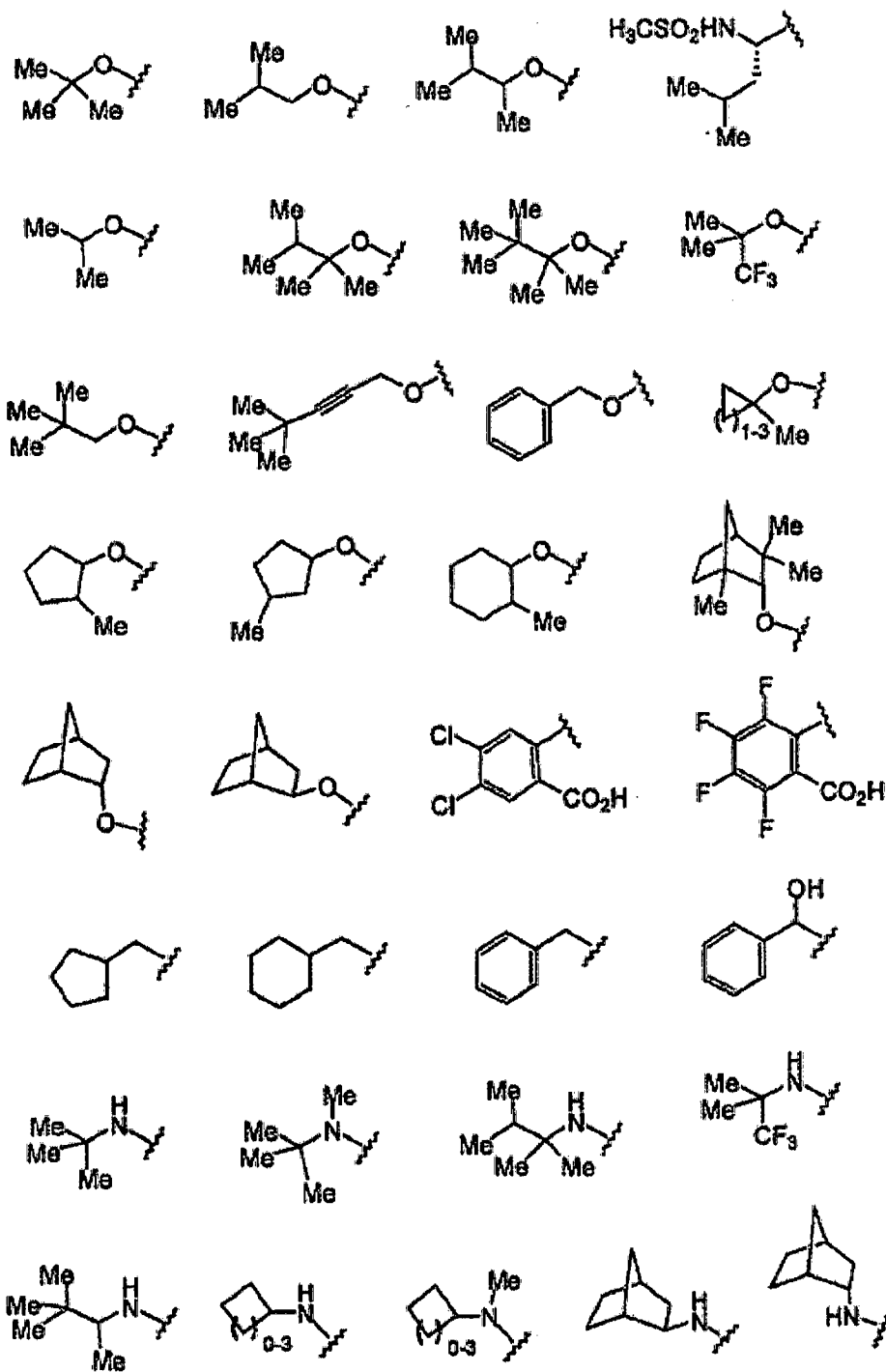
donde

$Y^{17} = CF_3, NO_2, CONH_2, OH, NH_2, \text{ o } COOH;$

$Y^{18} = F, COOH.$

17

12. El compuesto de la Reivindicación 11, en el cual Y se selecciona de las siguientes fracciones:



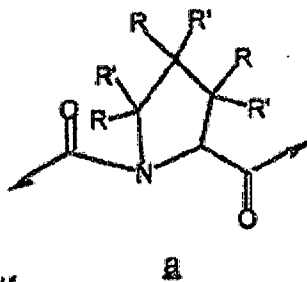
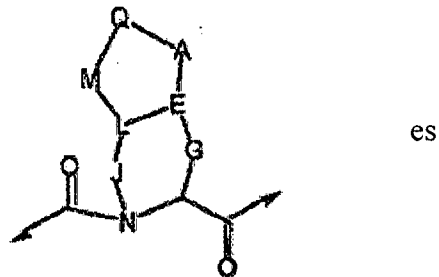
23/13
16

13. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual L y M están ausentes, y J está enlazado directamente a E.

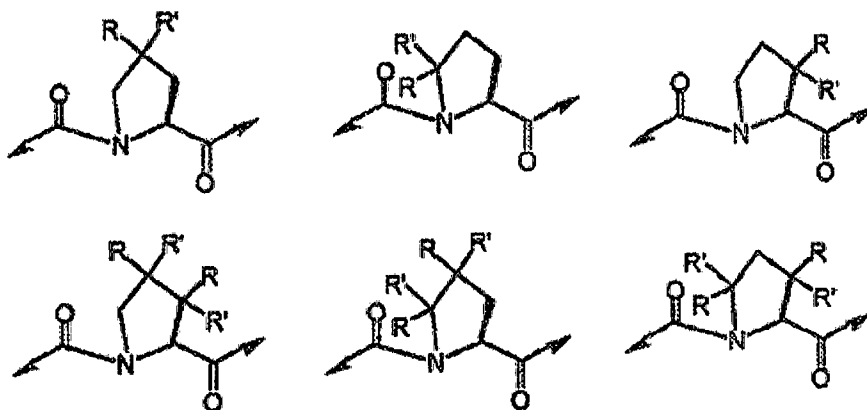
14. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual L, J y M están ausentes, y E está enlazado directamente a N.

15. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual G y M están ausentes.

16. El compuesto de la Reivindicación 12 en el cual la fracción



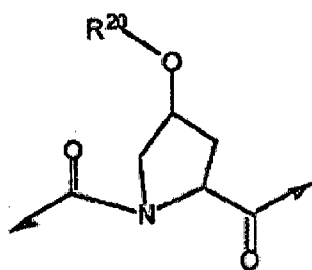
17. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a se selecciona de las siguientes estructuras:



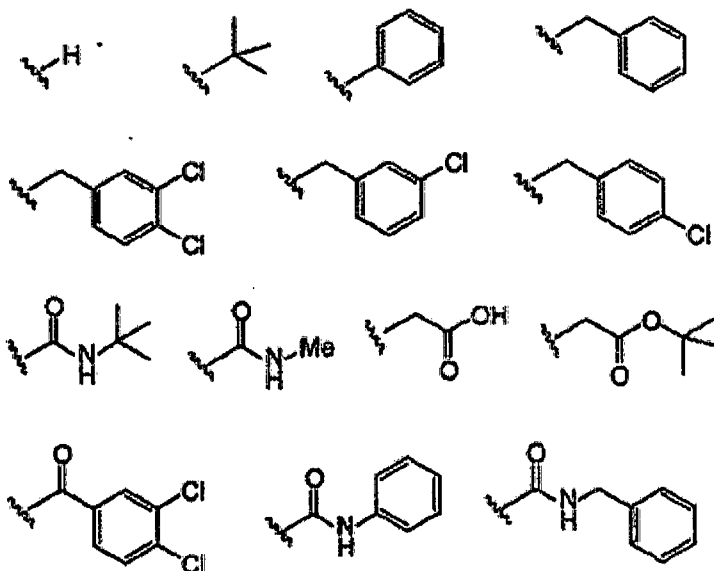
23/14

19

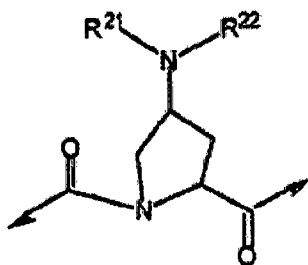
18. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a es:



en el cual R^{20} se selecciona de las siguientes estructuras:

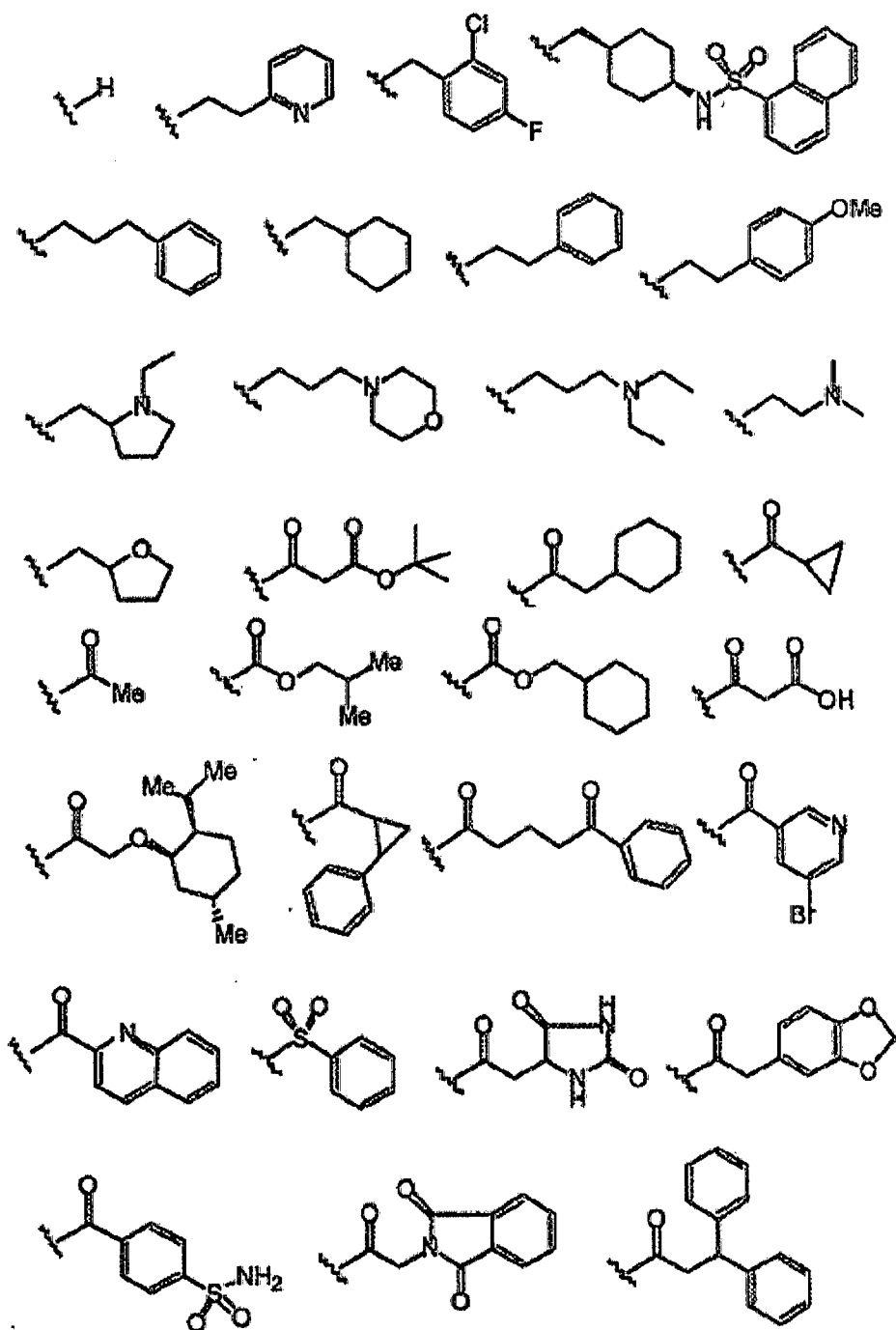


19. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a es:



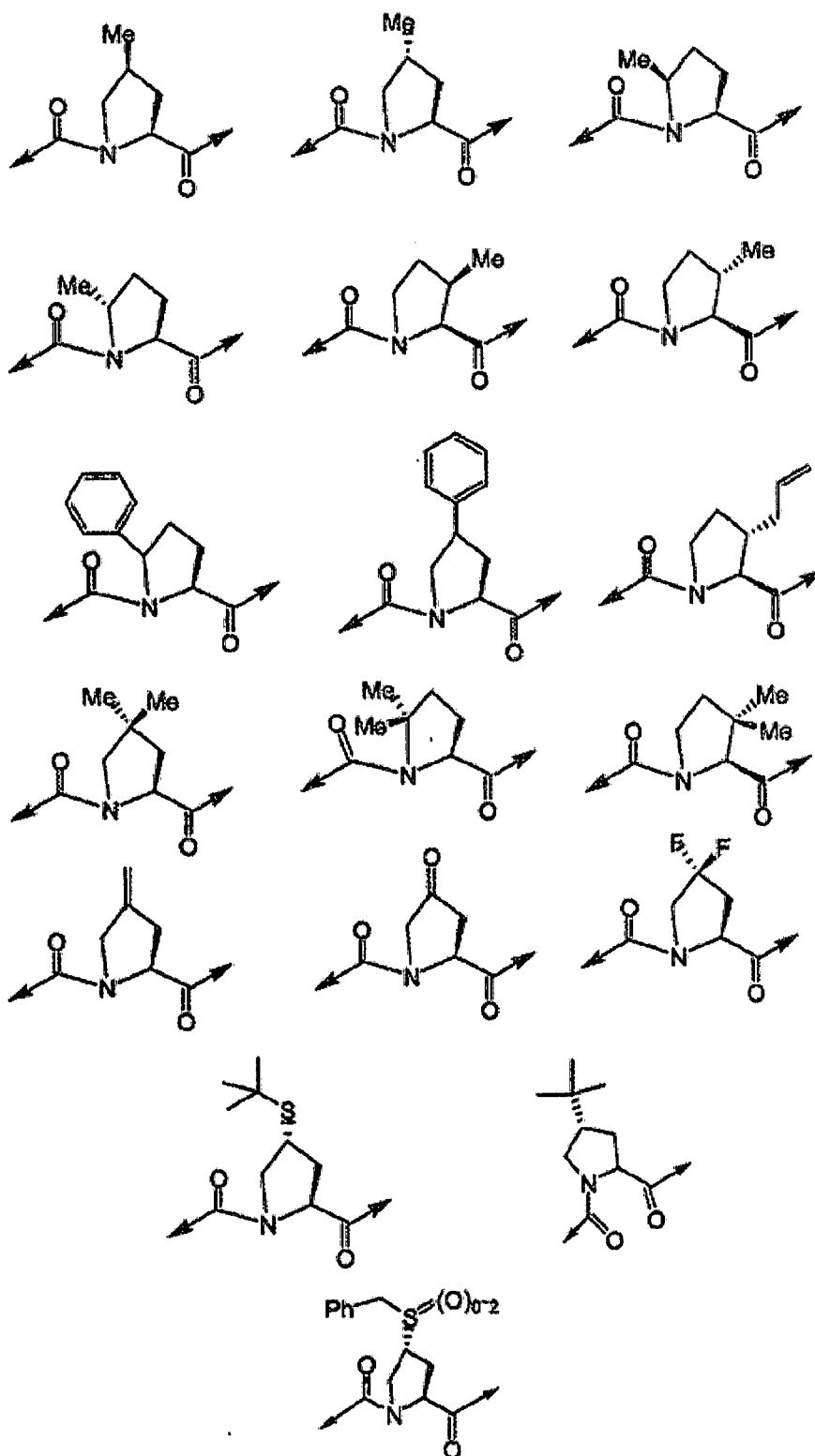
donde R^{21} y R^{22} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan en forma independiente de las siguientes estructuras:

23/15
20

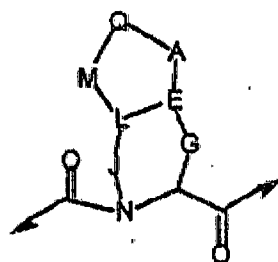


20. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a se selecciona de las siguientes estructuras:

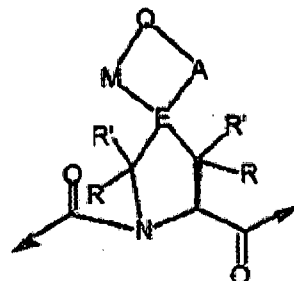
23/6
21



21. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:



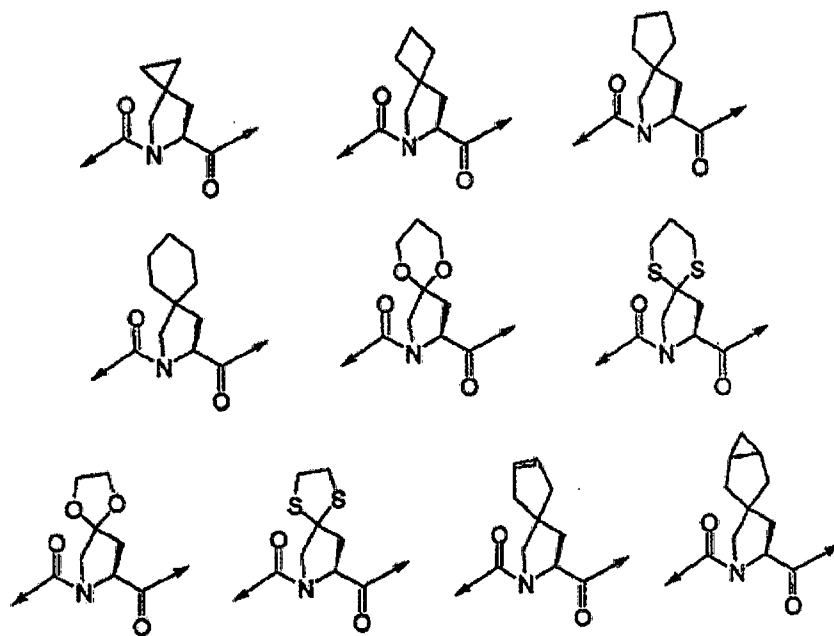
es



b

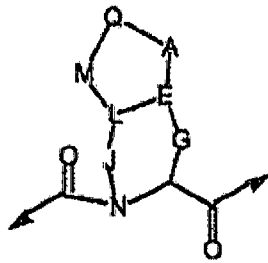
en el cual Q puede estar presente o ausente, y su Q está ausente, M está enlazado directamente a A.

22. El compuesto de la Reivindicación 21, en el cual la estructura b se selecciona de las siguientes estructuras:

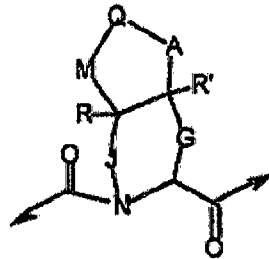


23. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:

23/18
B



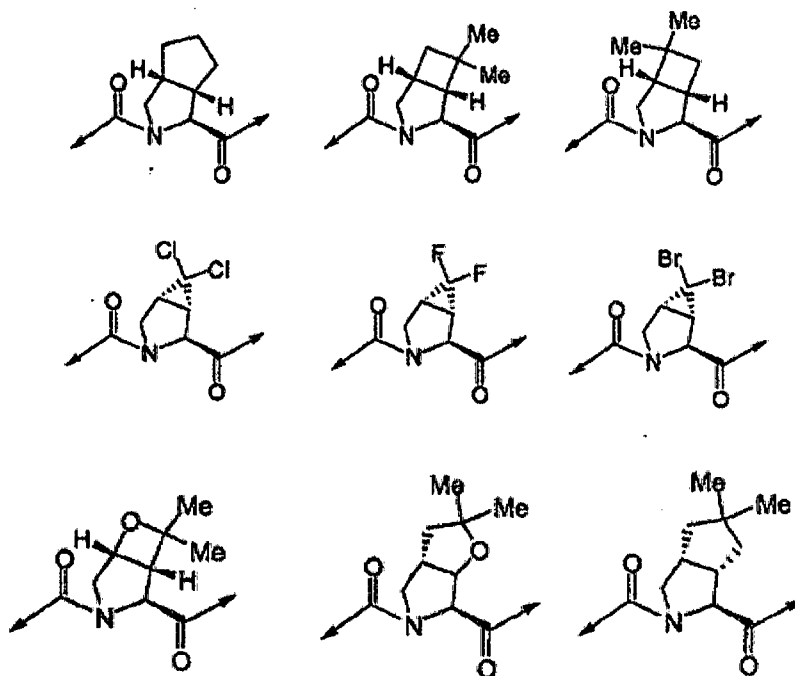
is



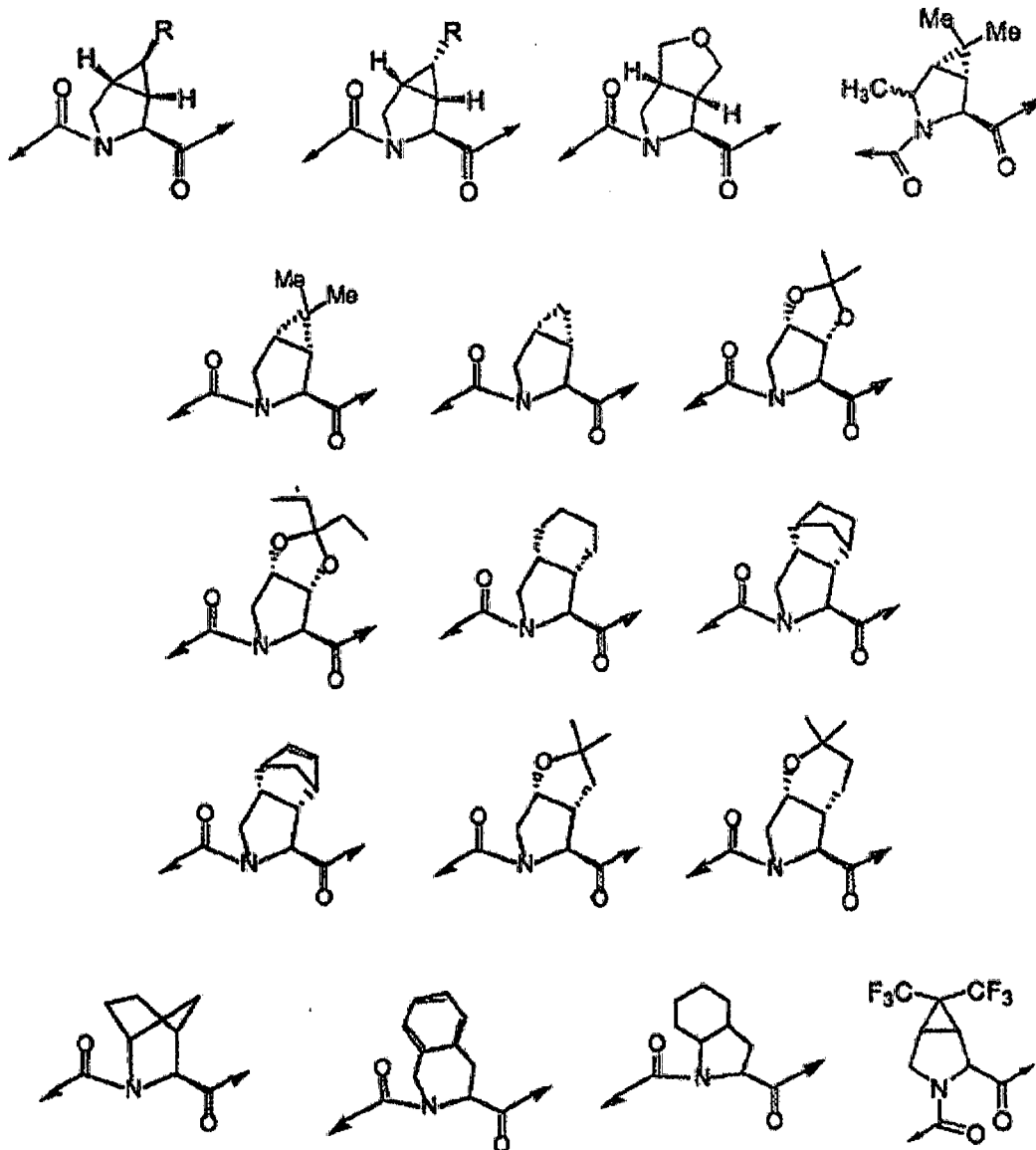
c

donde G y J se seleccionan en forma independiente del grupo que consiste de $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, $(CHR-CHR)_p$ y $(CRR')_p$, A y M se seleccionan en forma independiente del grupo que consiste de O, S, SO_2 , NR, $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, $(CHR-CHR)_p$ y $(CRR')_p$ y Q es CH_2 , CHR, CRR', NH, NR, O, S, SO_2 , NR; $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, y $(CRR')_p$.

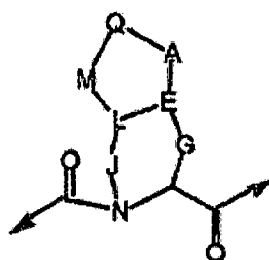
24. El compuesto de la Reivindicación 23, en el cual la estructura c se selecciona de las siguientes estructuras:



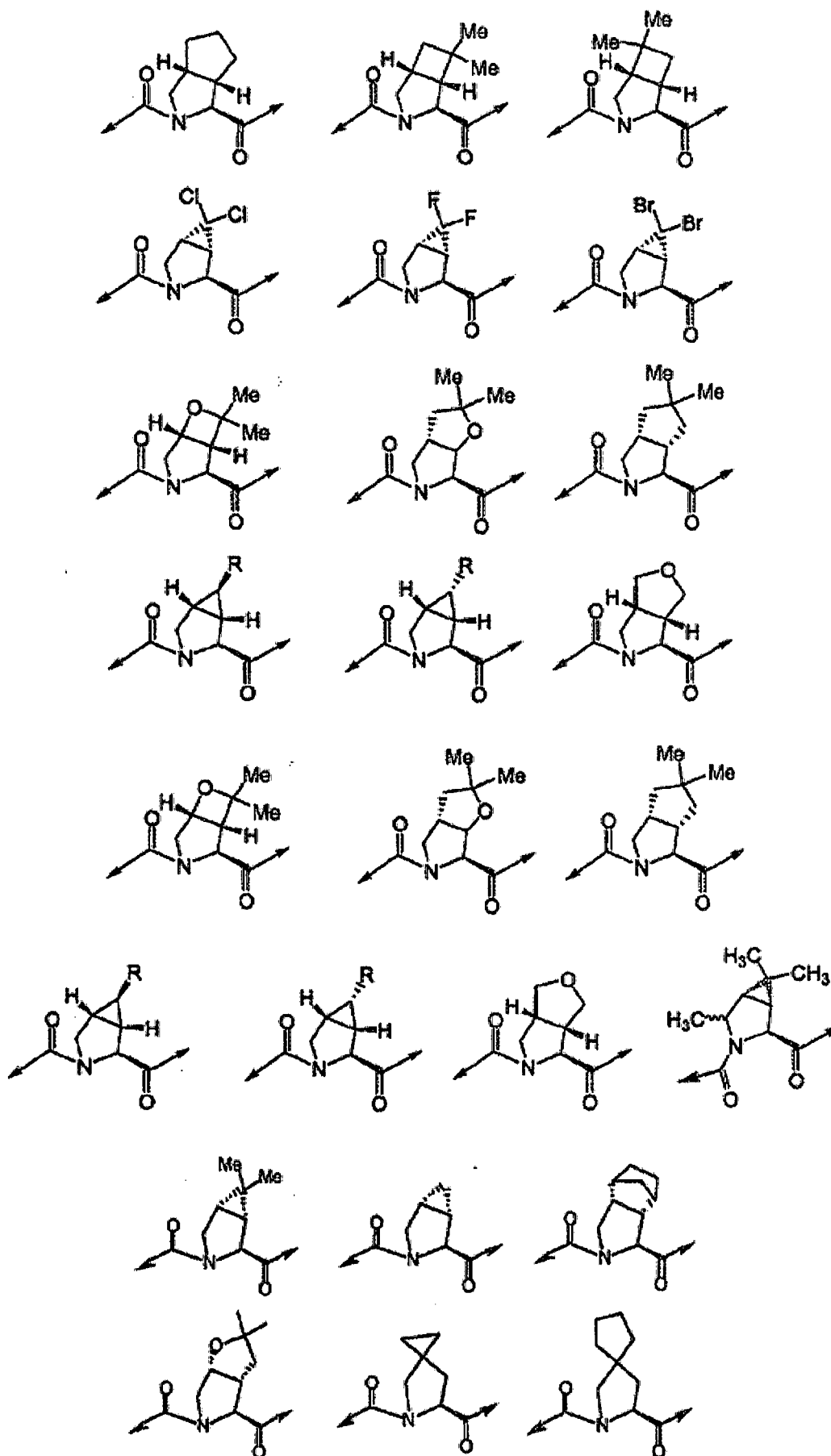
23/19
24



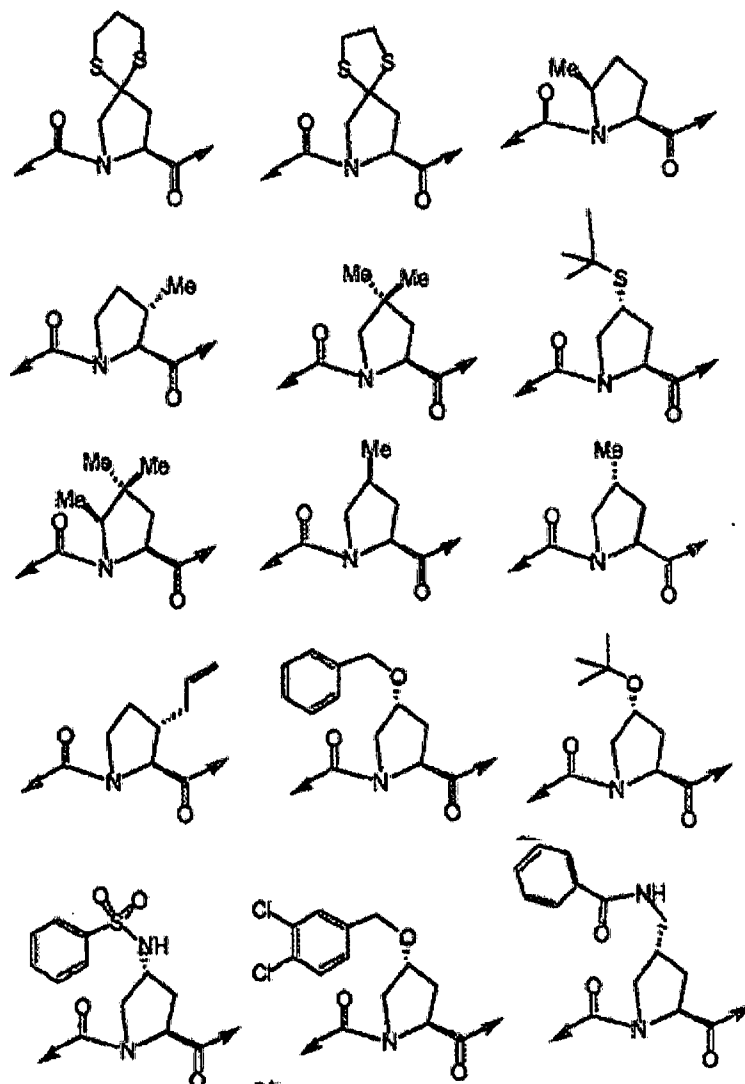
25. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:



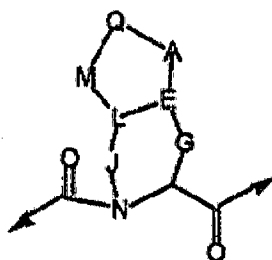
se seleccionan las siguientes estructuras:



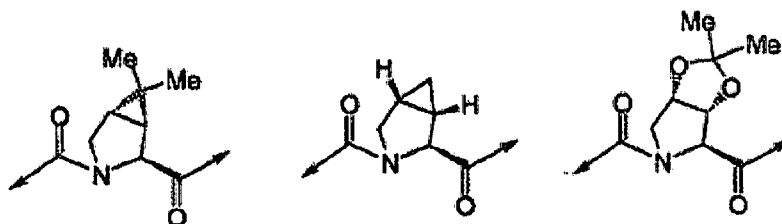
2321
96

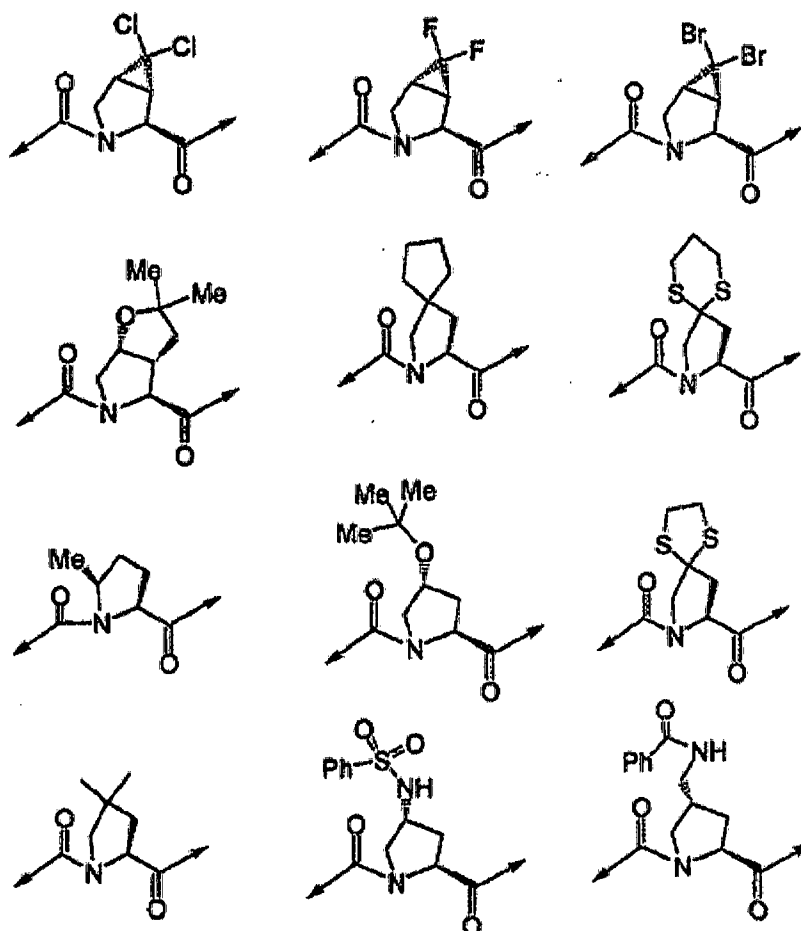


26. El compuesto de la Reivindicación 25, en el cual



se selecciona de las siguientes estructuras:



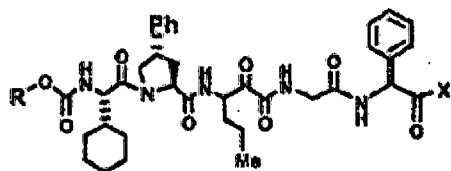


27. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-26.

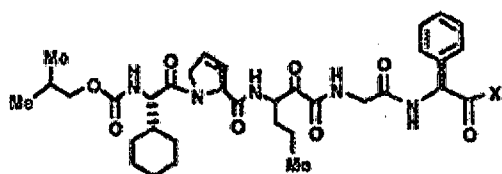
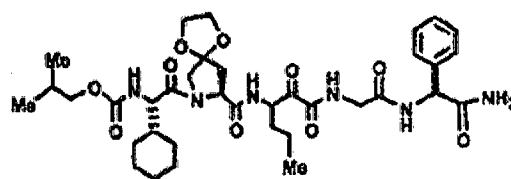
28. La composición farmacéutica de la Reivindicación 27, que contienen adicionalmente (a) un agente antiviral o (b) un interferón, o ambos (a) y (b).

29. La composición de la Reivindicación 28, en donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón o interferón pegilado.

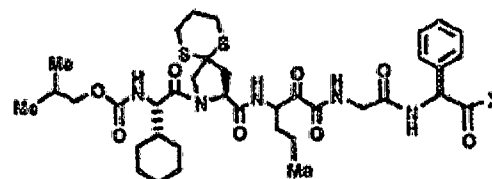
30. Un compuesto que exhibe actividad de inhibición de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros, rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y las sales farmacéuticamente aceptables o solvatos de dicho compuesto, dicho compuesto se selecciona de los compuestos o estructuras que aparecen a continuación:



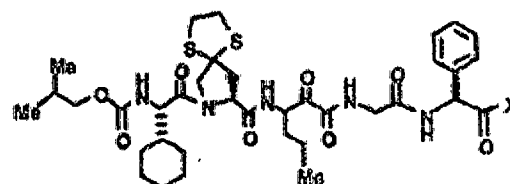
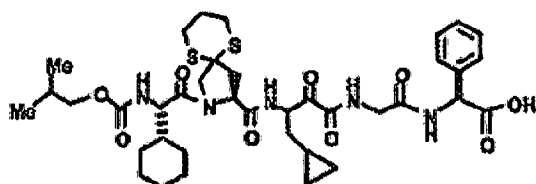
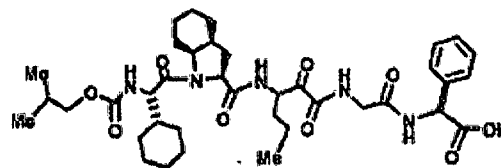
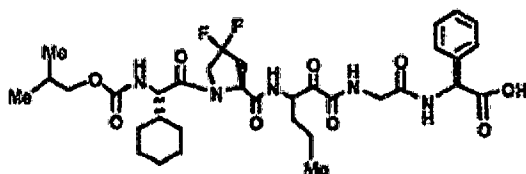
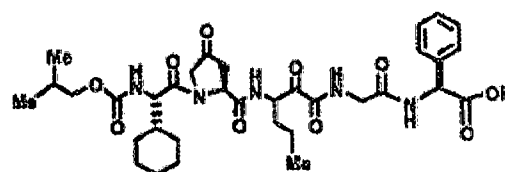
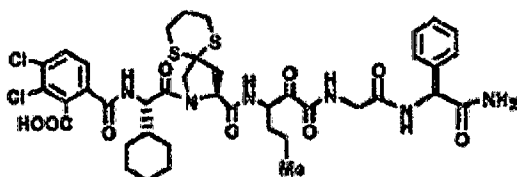
(R = t-butil, X=NH₂)
(R = isobutil, X=NH₂)
(R = t-butil, X=OH)
(R=triclouroetil, X=OH)



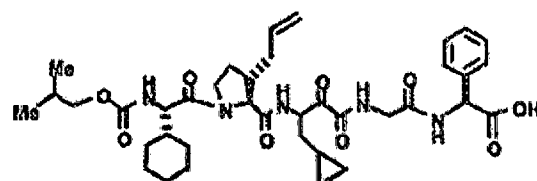
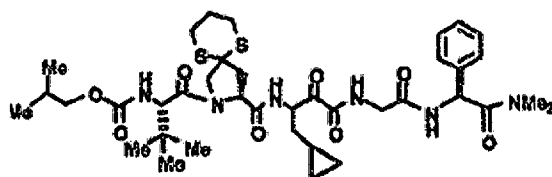
(X = O^tBu)
(X = OH)



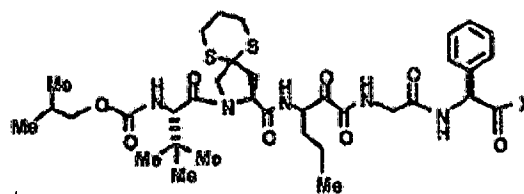
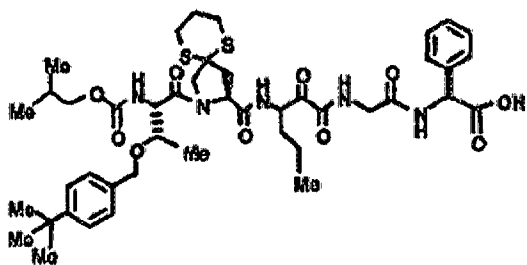
(X = OH)
(X = O^tBu)
(X = NH₂)
(X = NHMe)
(X = NMe₂)



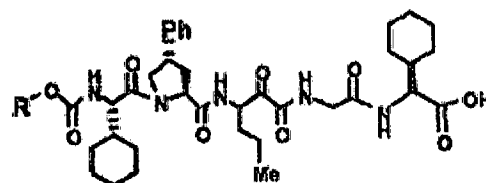
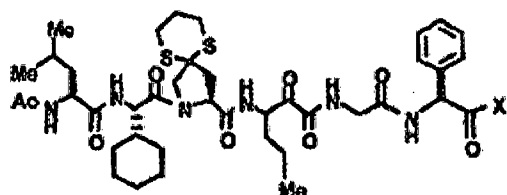
(X = NH₂)
(X = NMe₂)
(X = NHMe)
(X = OH)



29

(X = O^tBu)

(X = OH)

(X = NH₂)(X = NMe₂)(X = O^tBu)

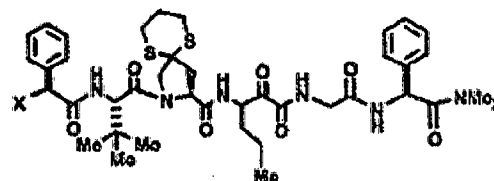
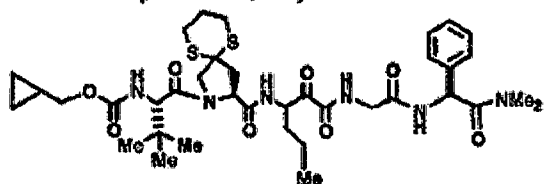
(X = OH)

(X = NH₂)(X = NMe₂)

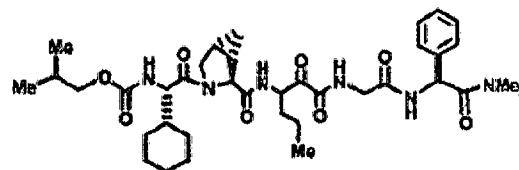
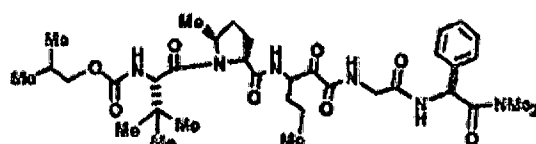
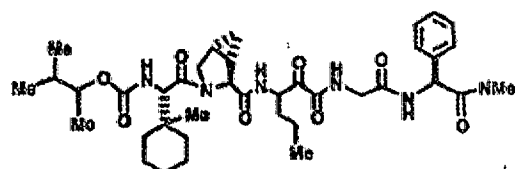
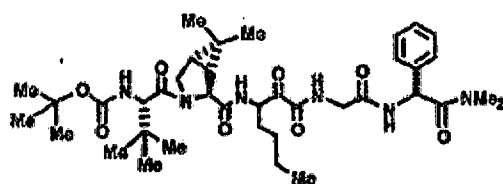
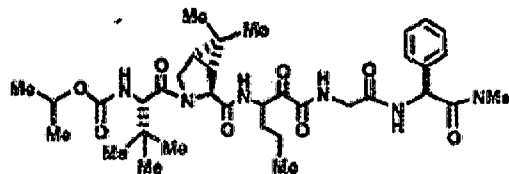
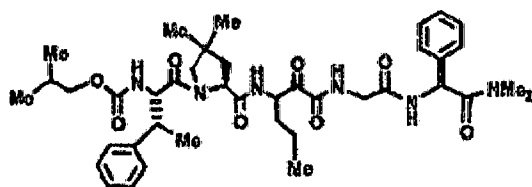
(X = NMeOMe)

(R = t-butyl)

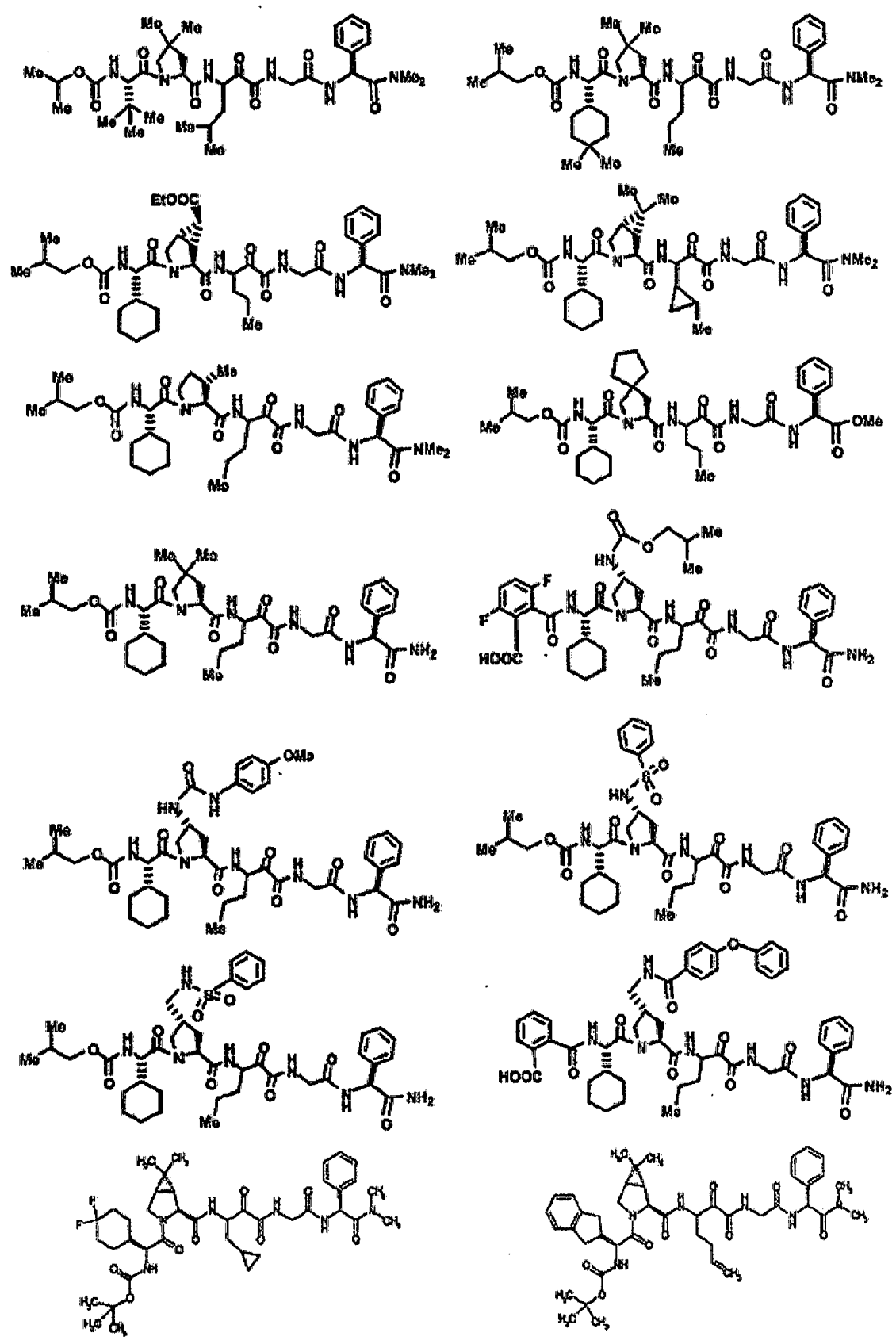
(R = isobutyl)

(X = Me, Y = CH₂Me)

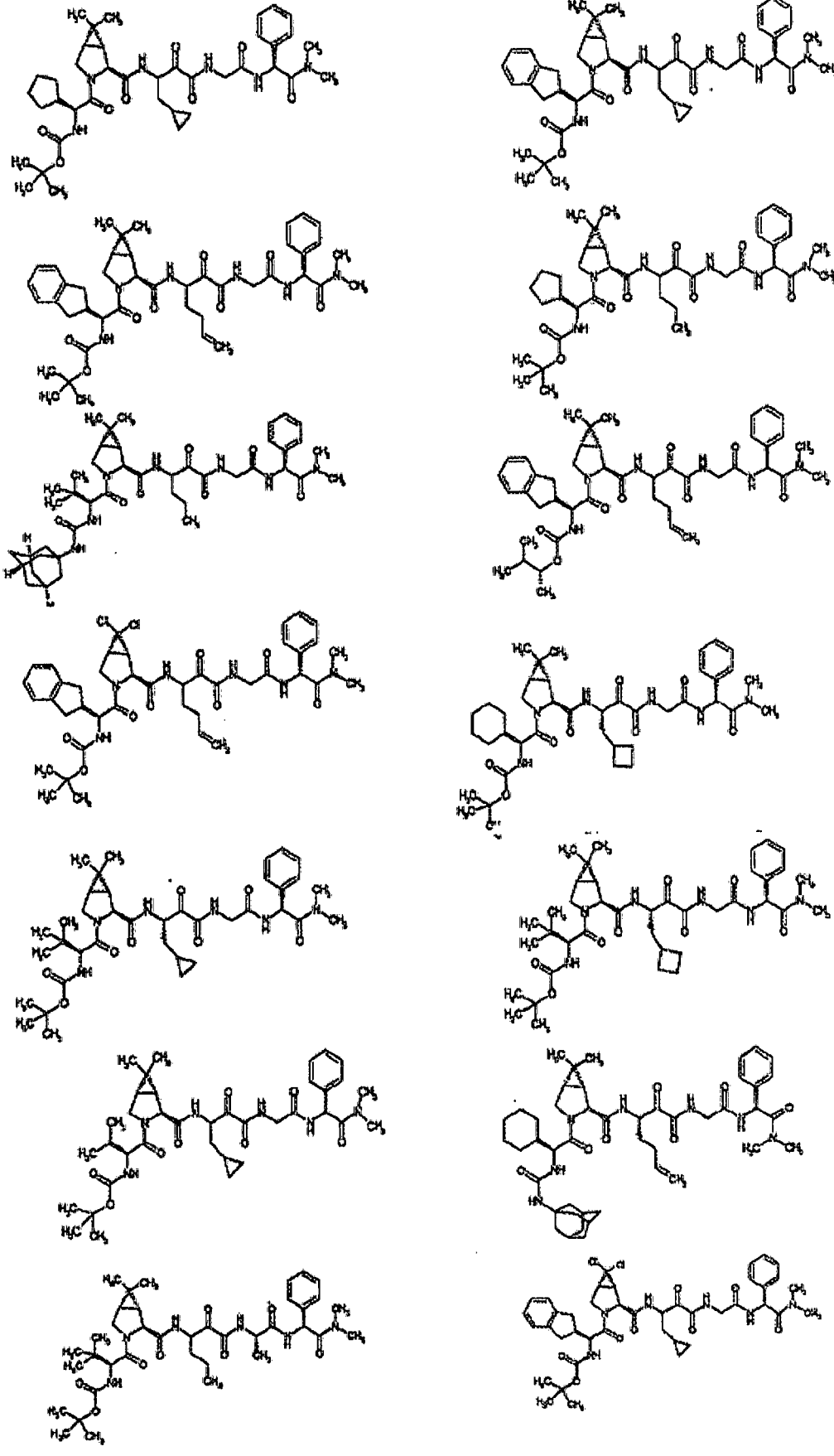
(X = OAc, Y = Me)



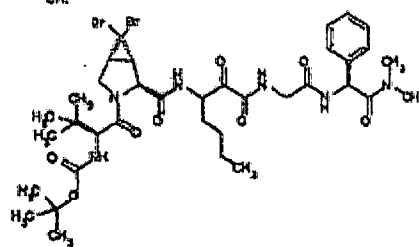
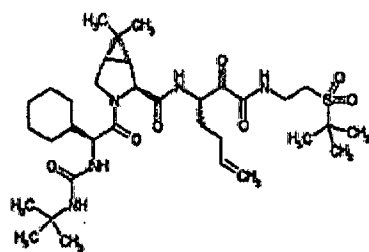
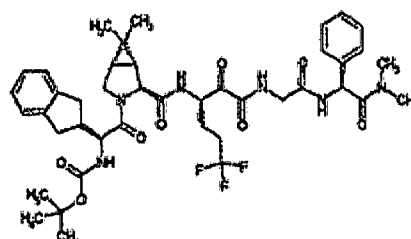
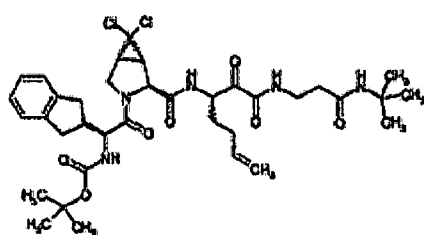
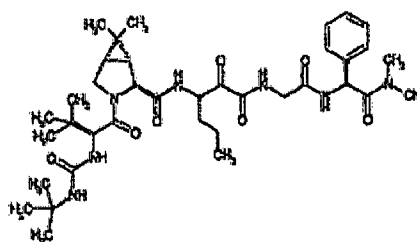
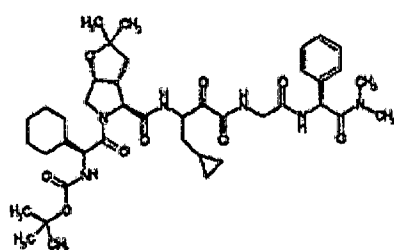
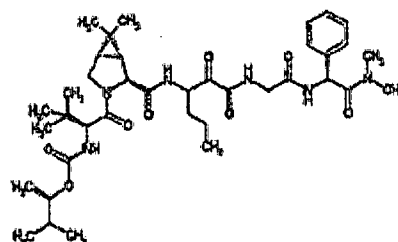
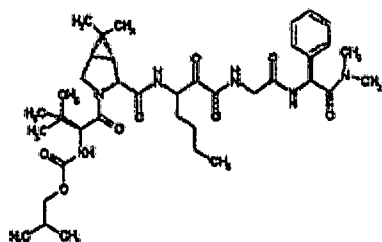
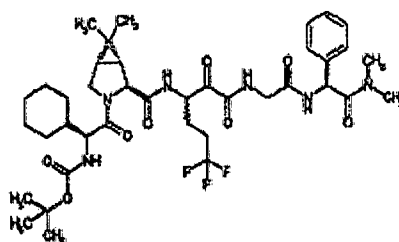
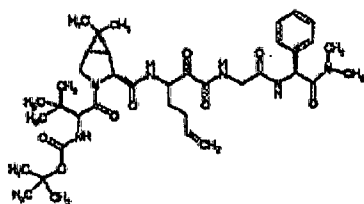
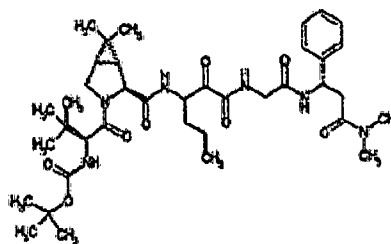
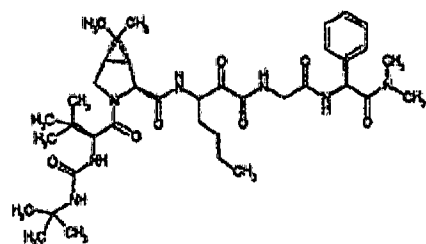
30



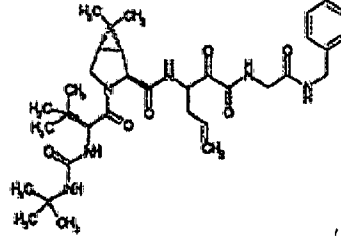
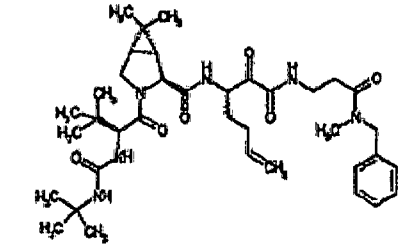
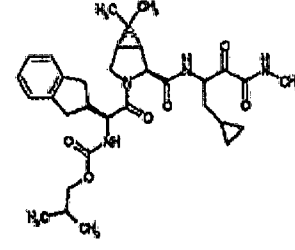
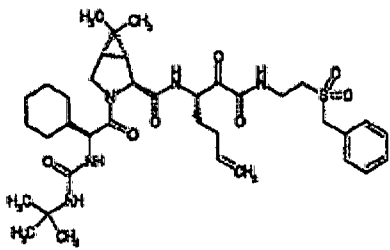
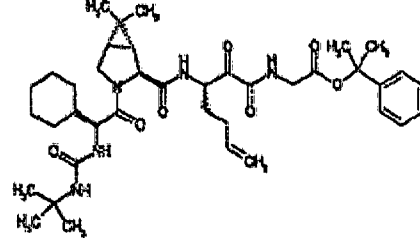
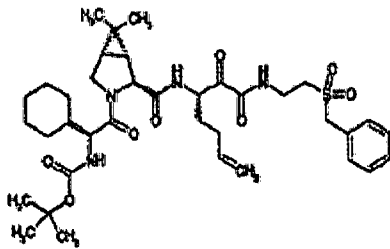
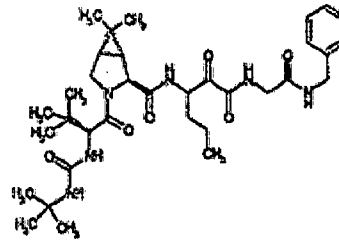
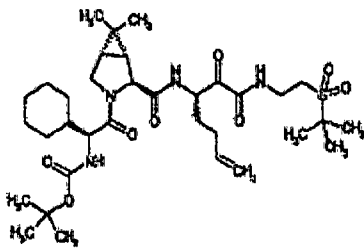
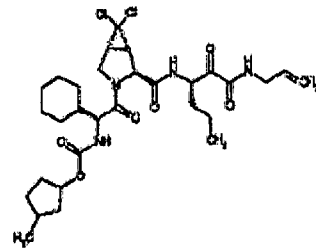
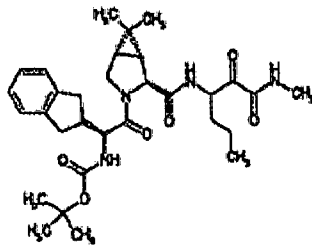
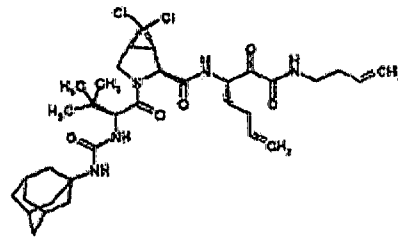
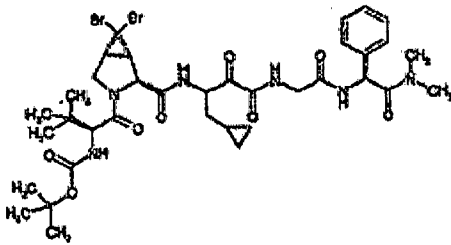
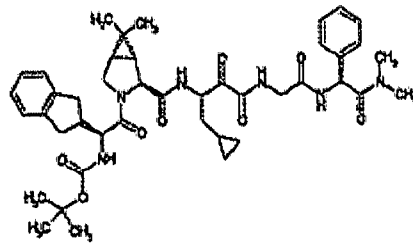
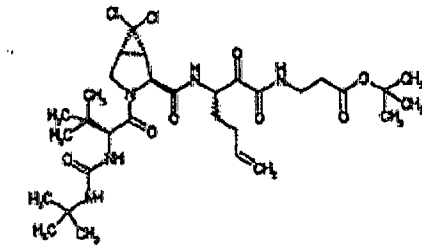
31



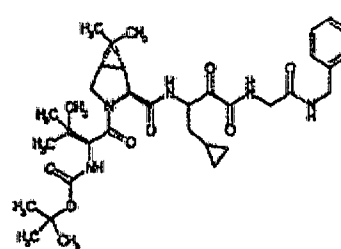
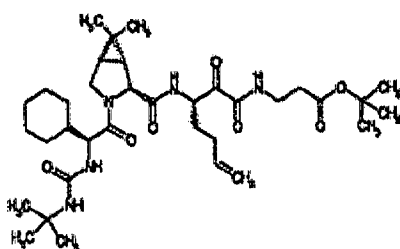
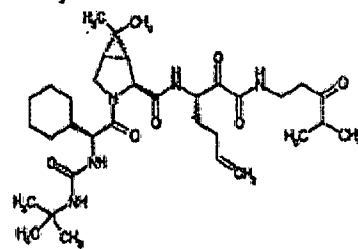
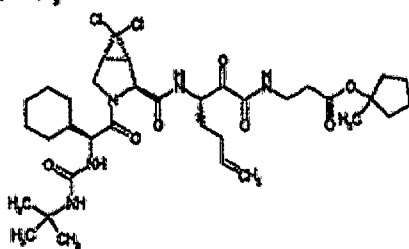
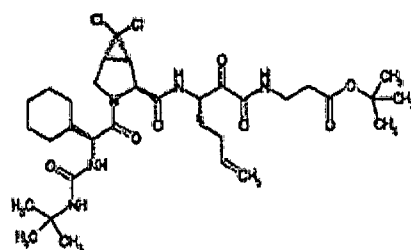
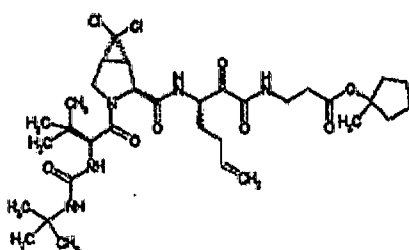
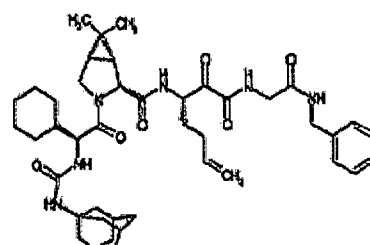
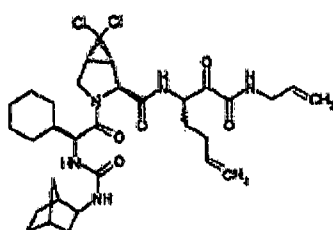
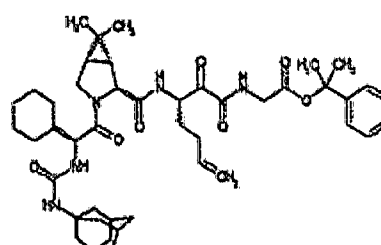
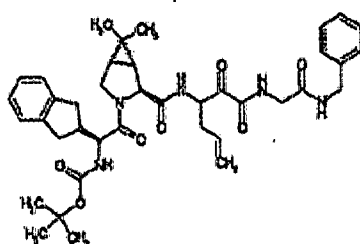
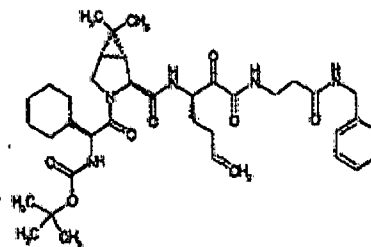
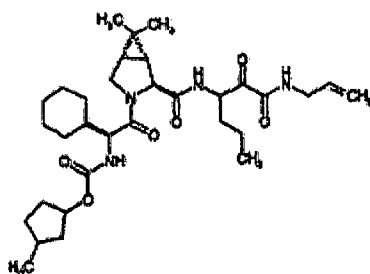
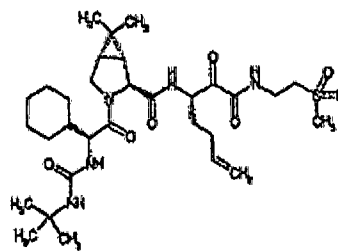
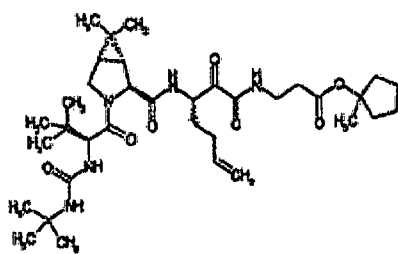
32

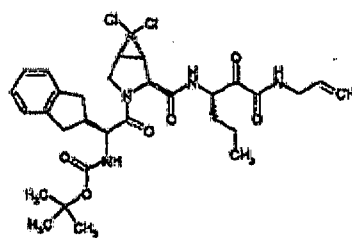
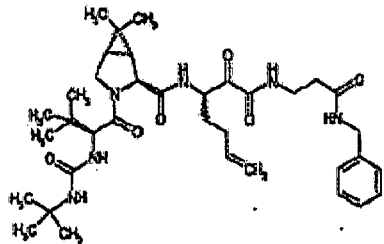
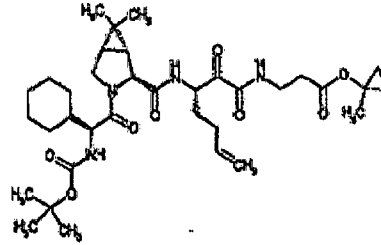
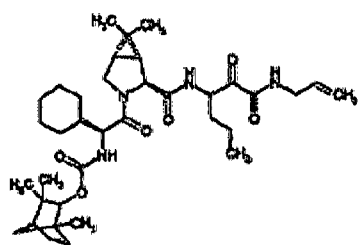
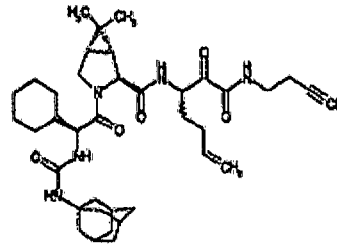
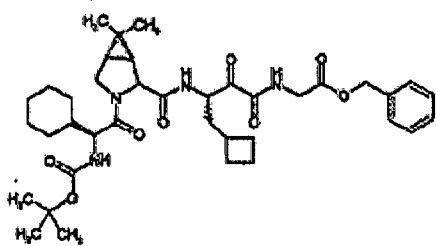
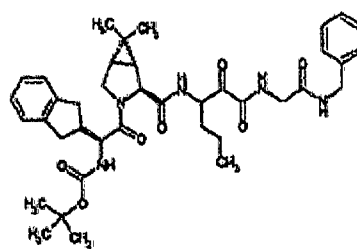
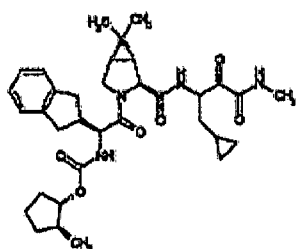
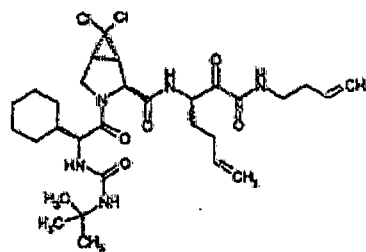
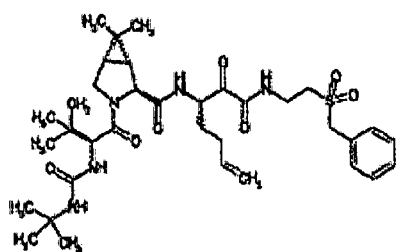
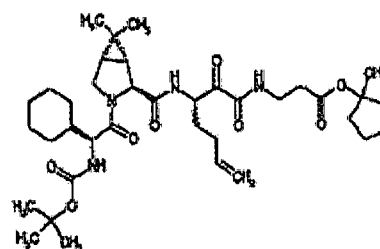
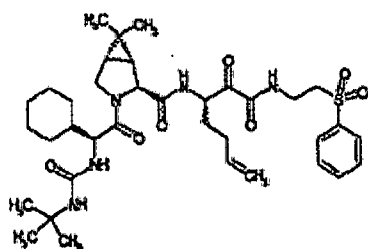
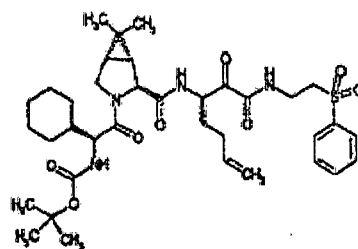
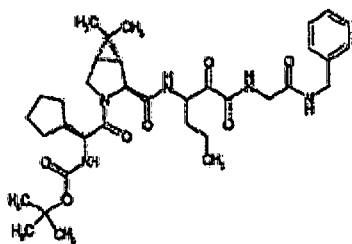


33

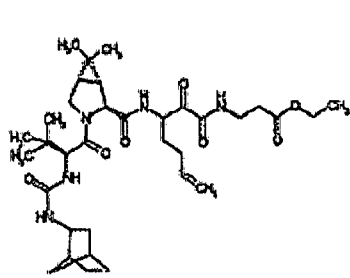
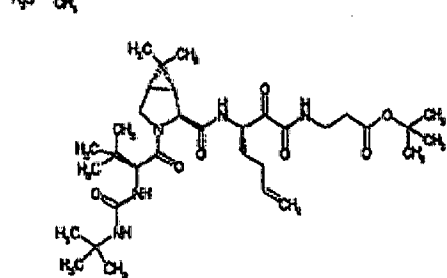
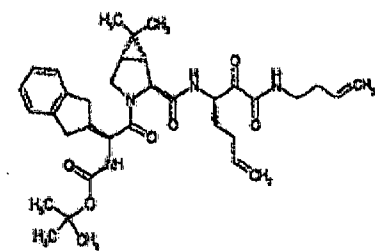
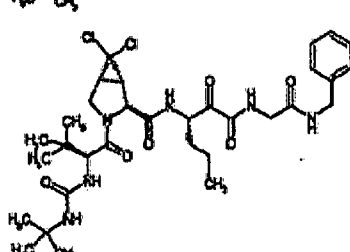
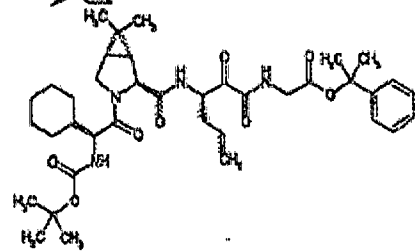
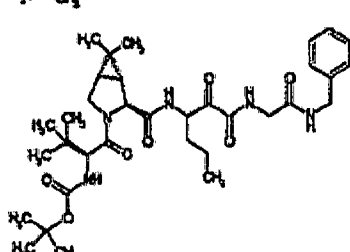
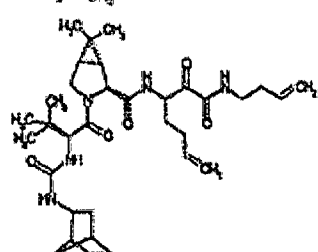
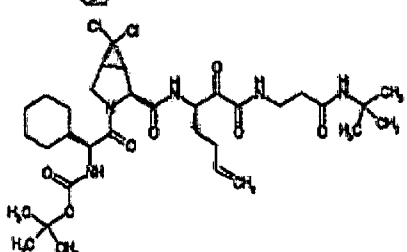
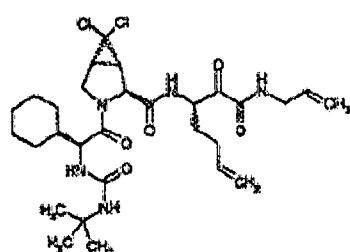
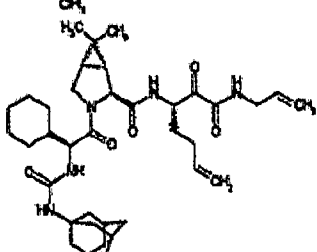
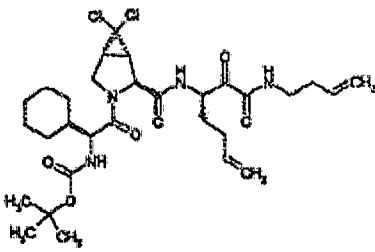
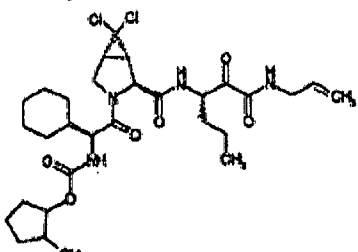
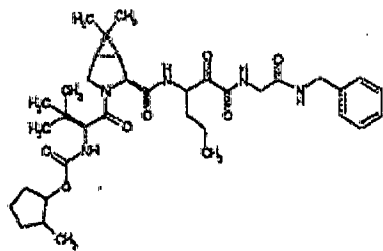
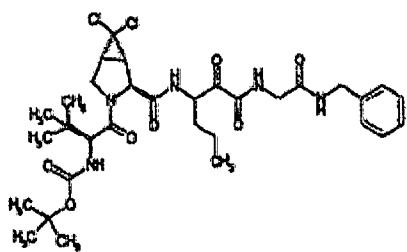


34

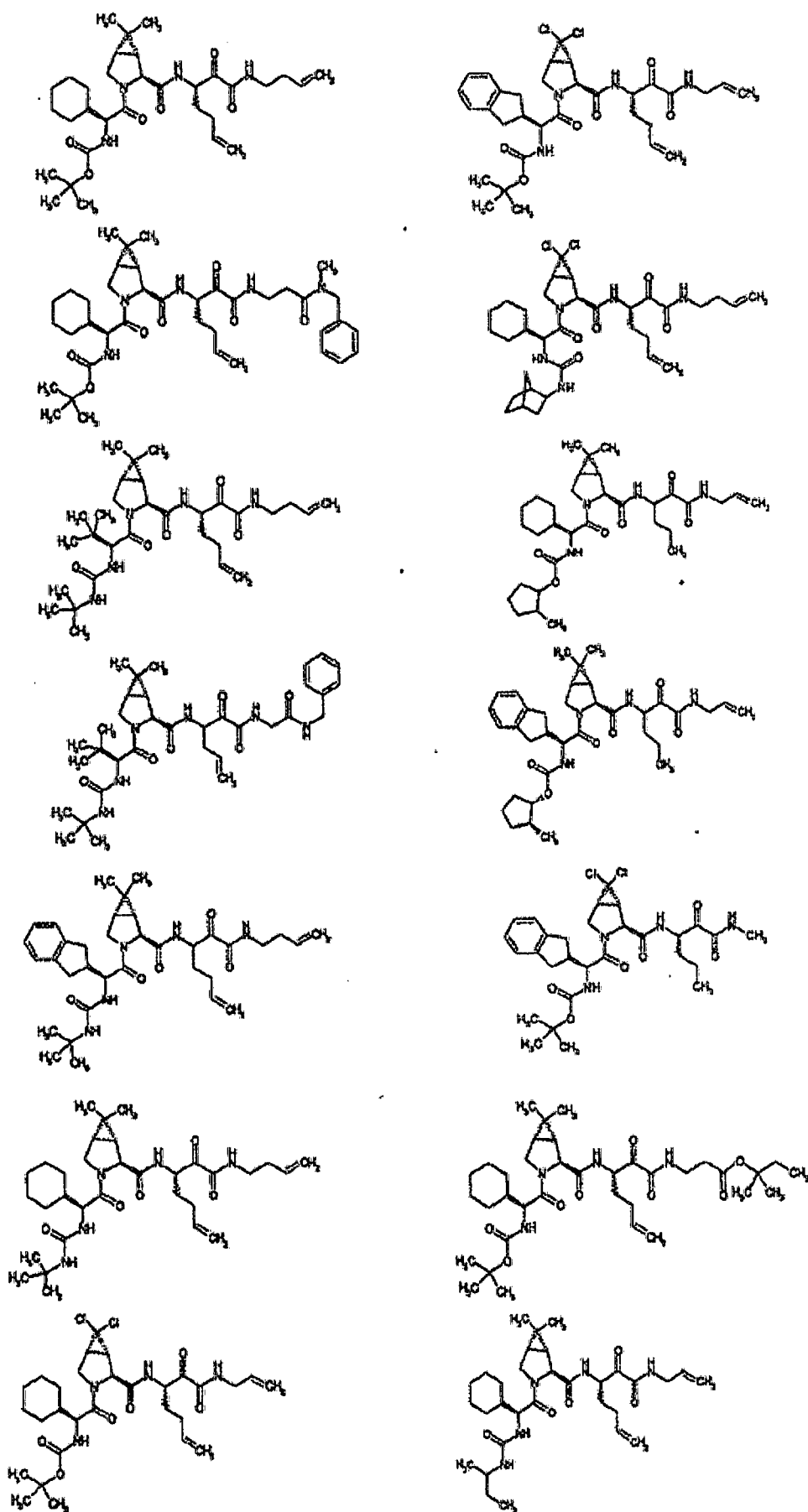


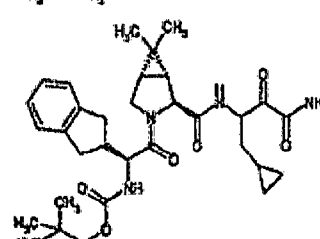
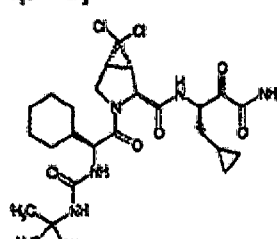
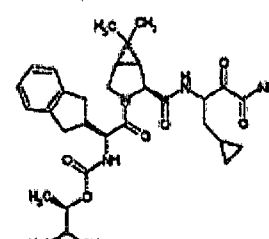
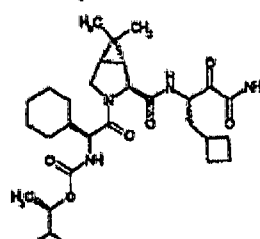
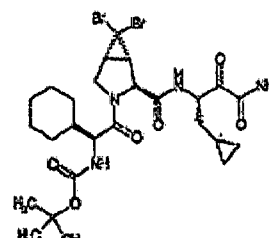
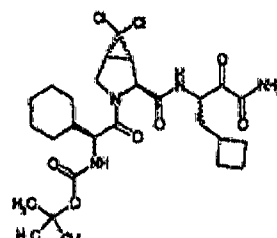
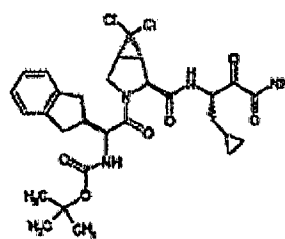
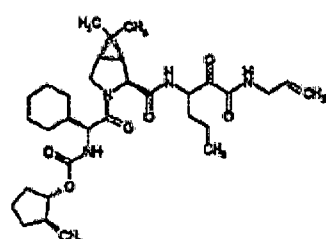
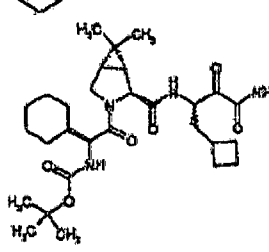
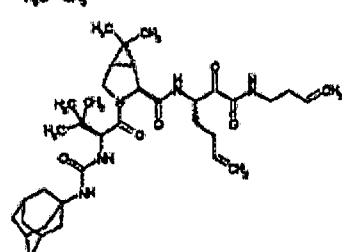
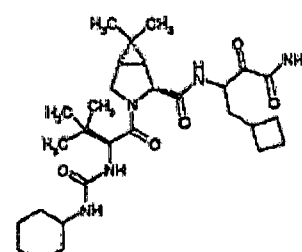
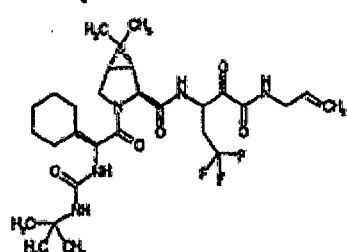
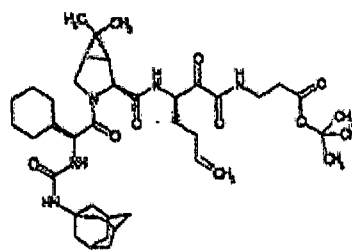
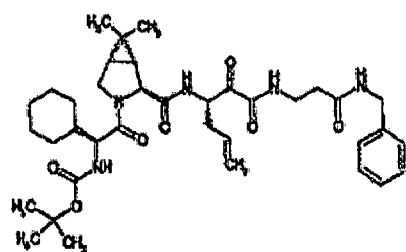


36

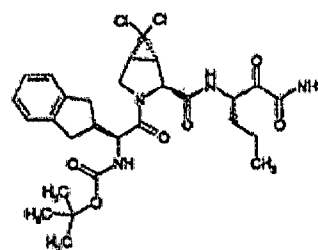
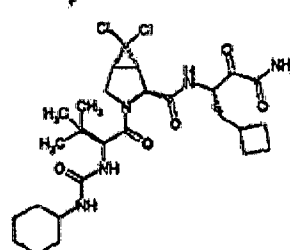
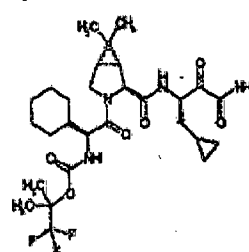
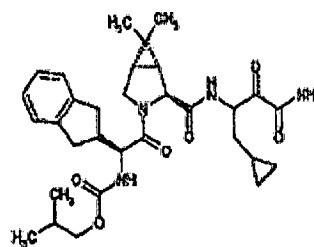
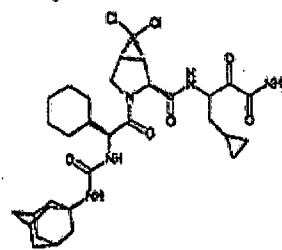
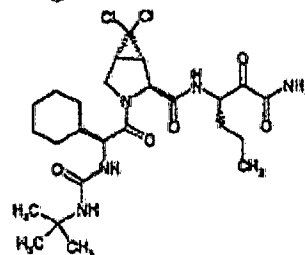
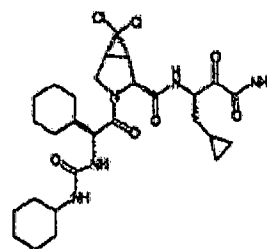
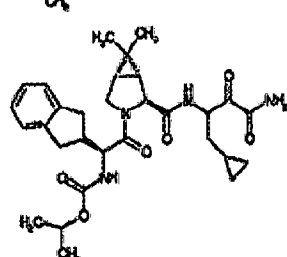
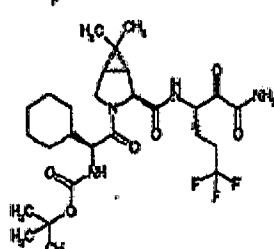
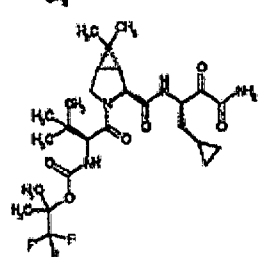
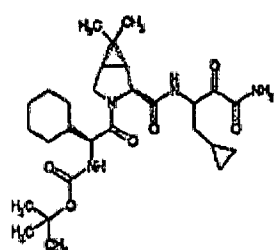
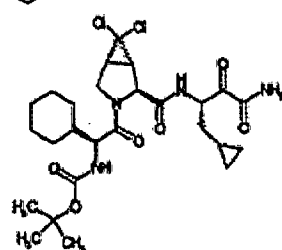
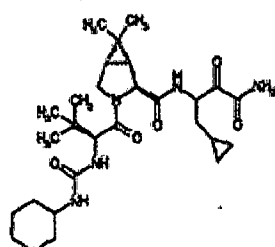
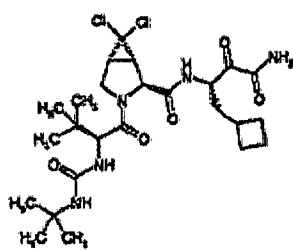


37

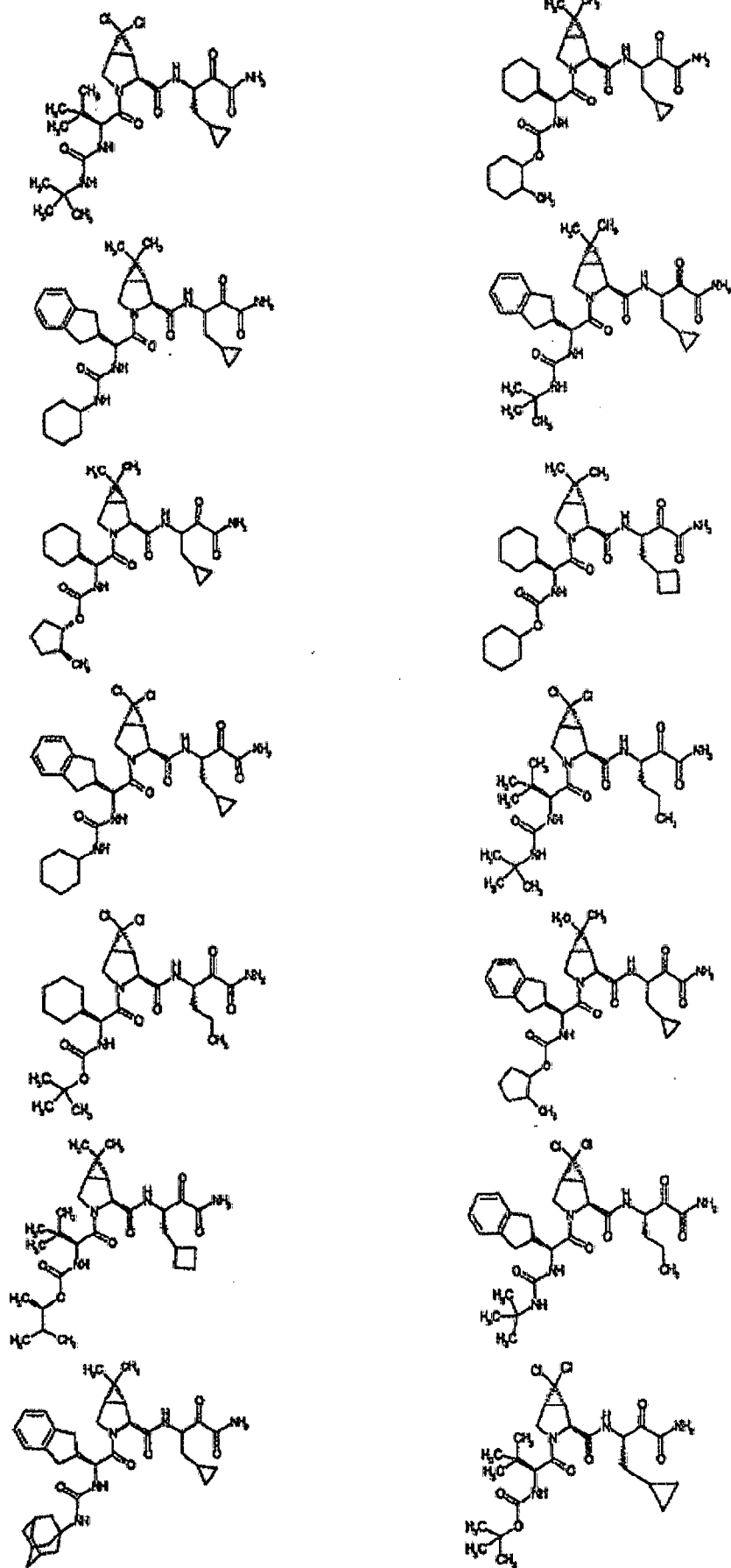


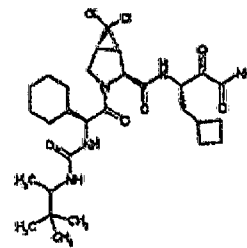
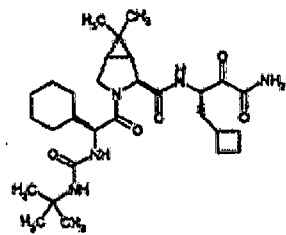
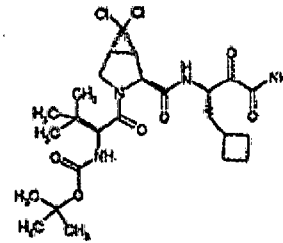
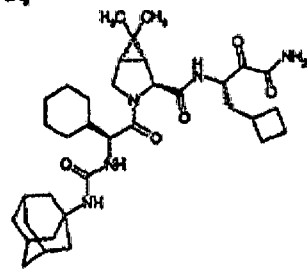
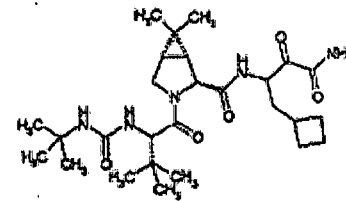
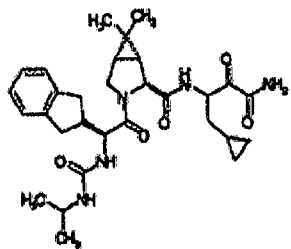
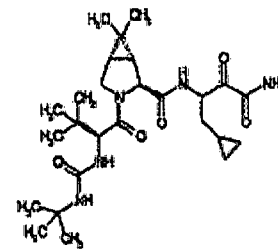
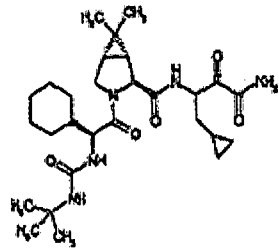
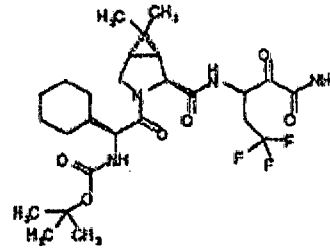
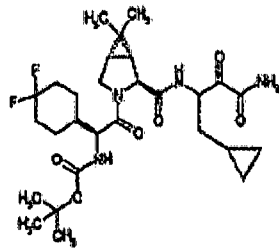
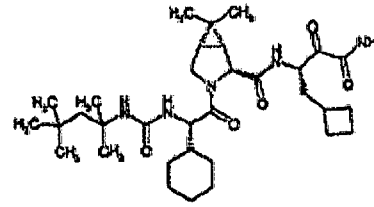
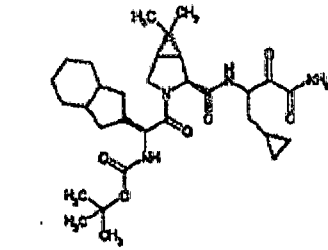


39

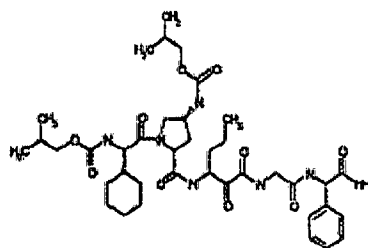
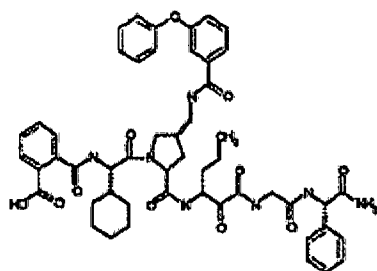
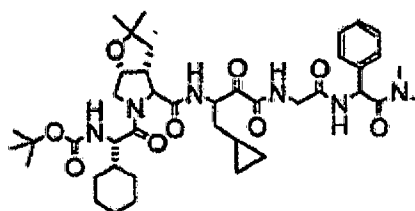
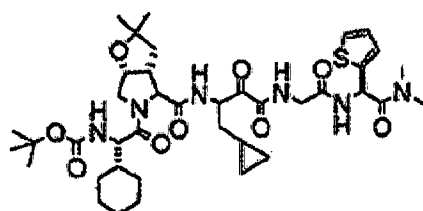
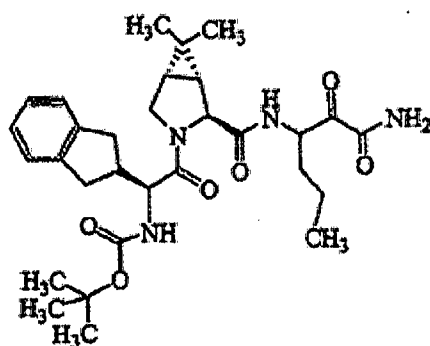
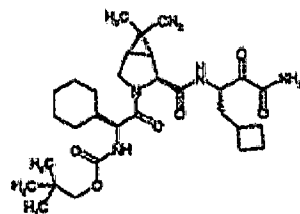
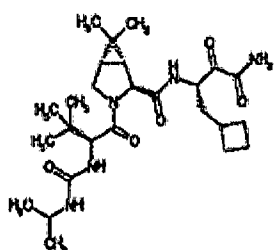
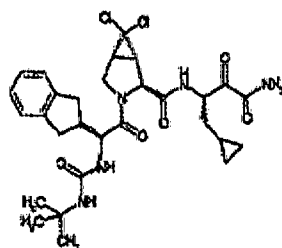
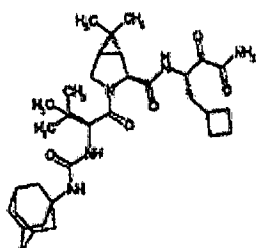
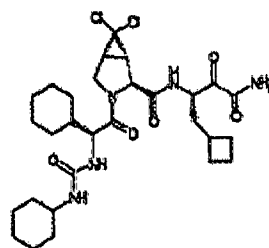
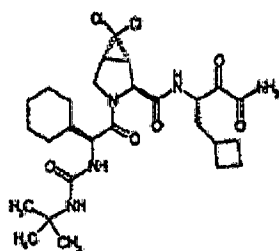


[Handwritten signature]

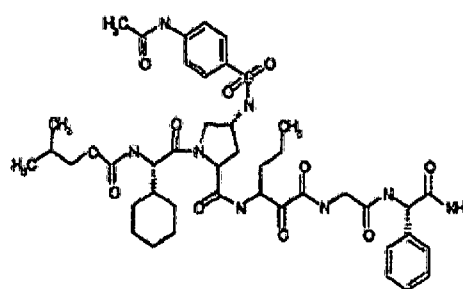
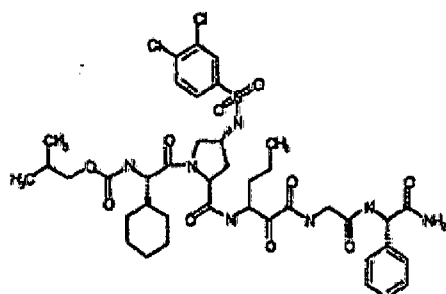
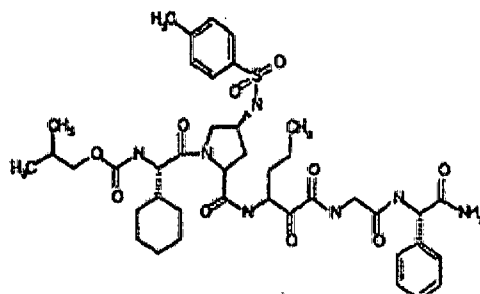
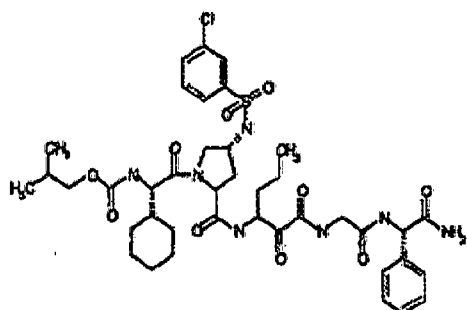
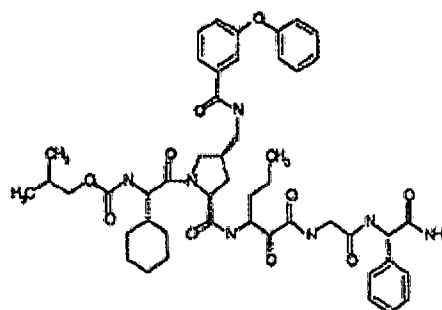
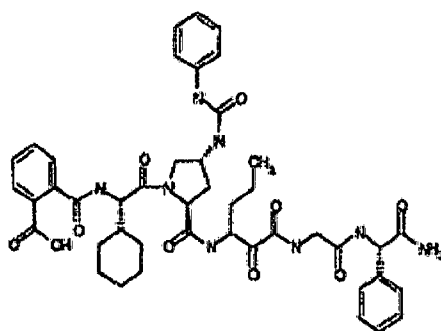
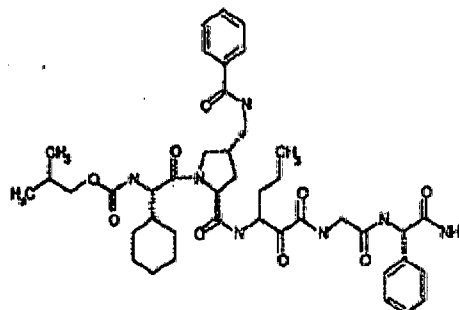
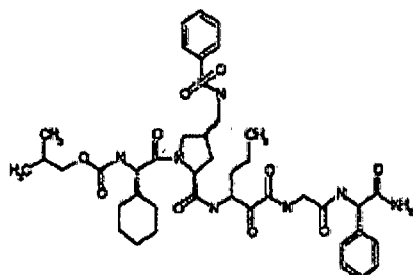
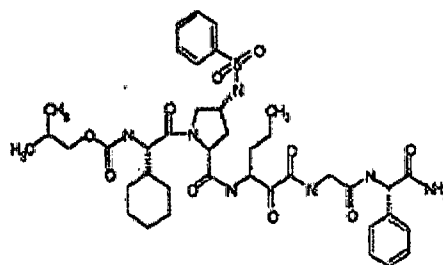
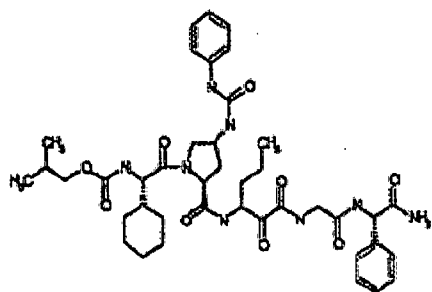




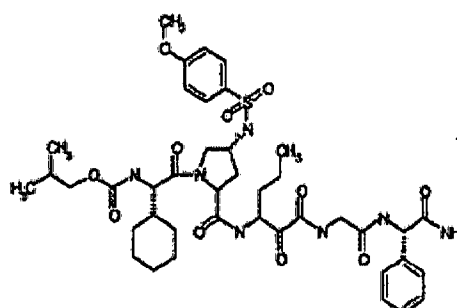
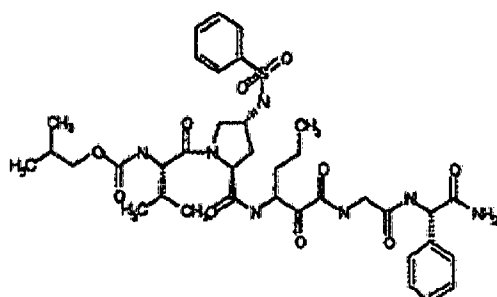
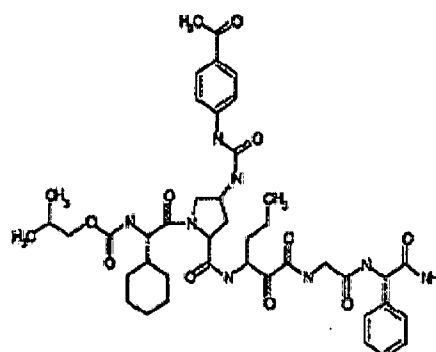
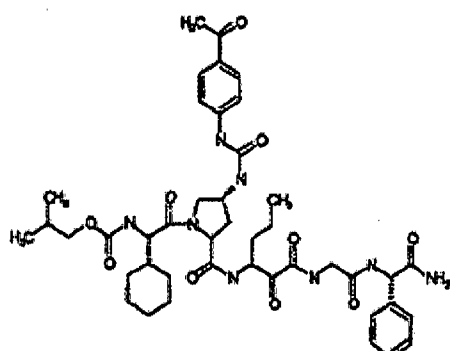
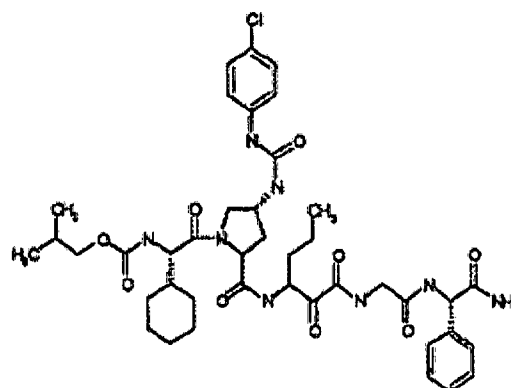
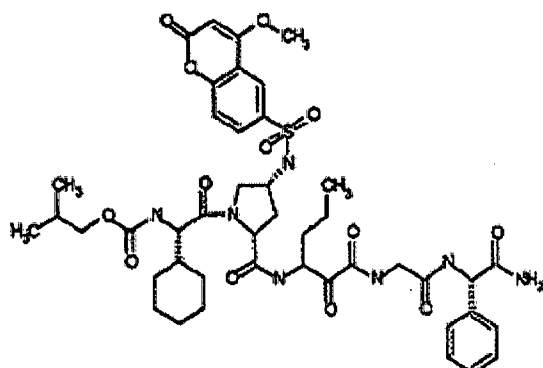
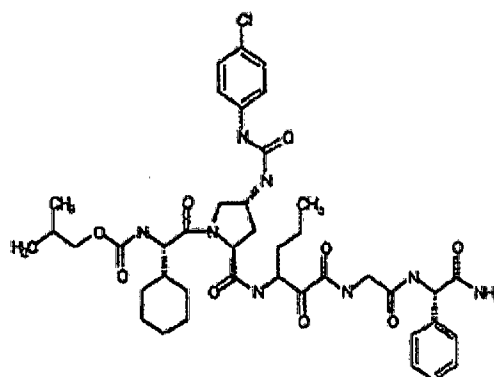
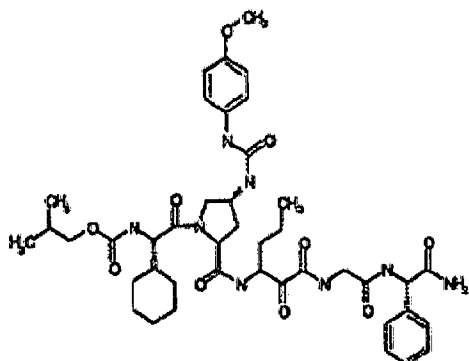
V2



B

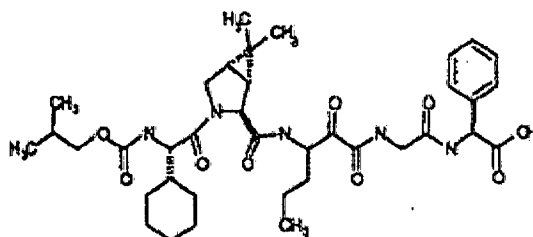
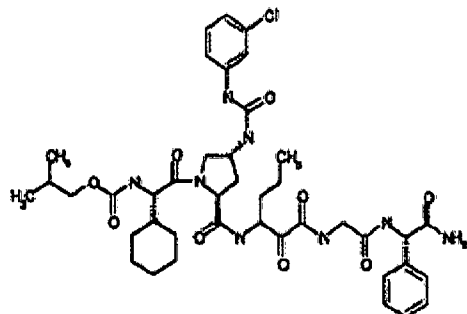
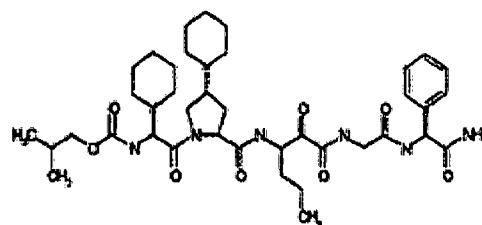
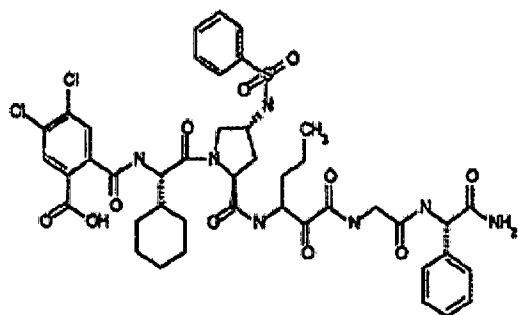
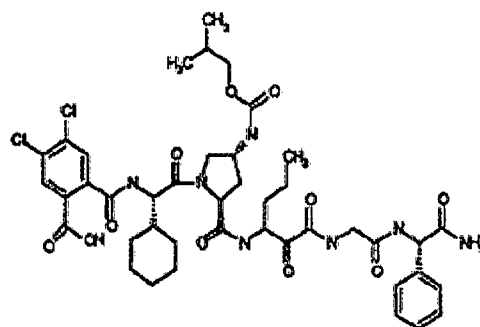
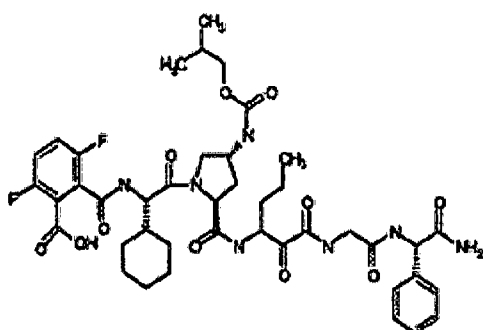
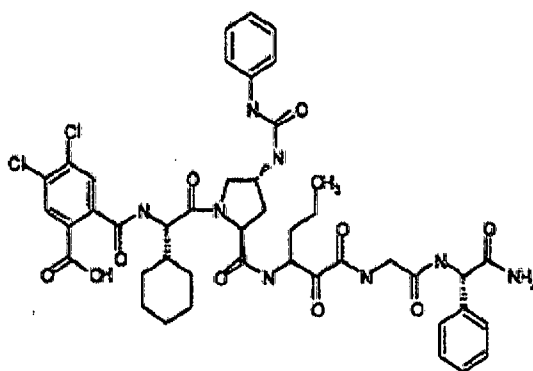
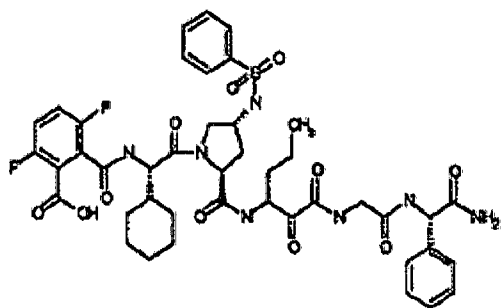
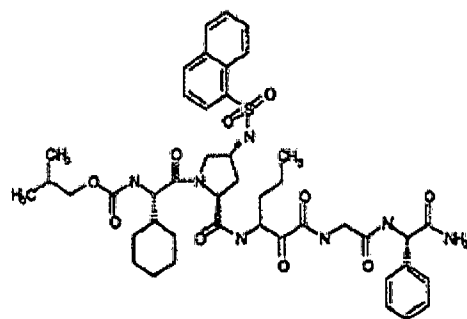
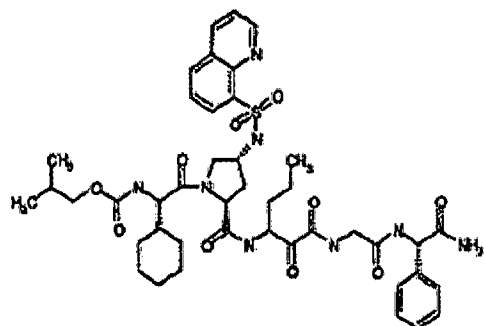


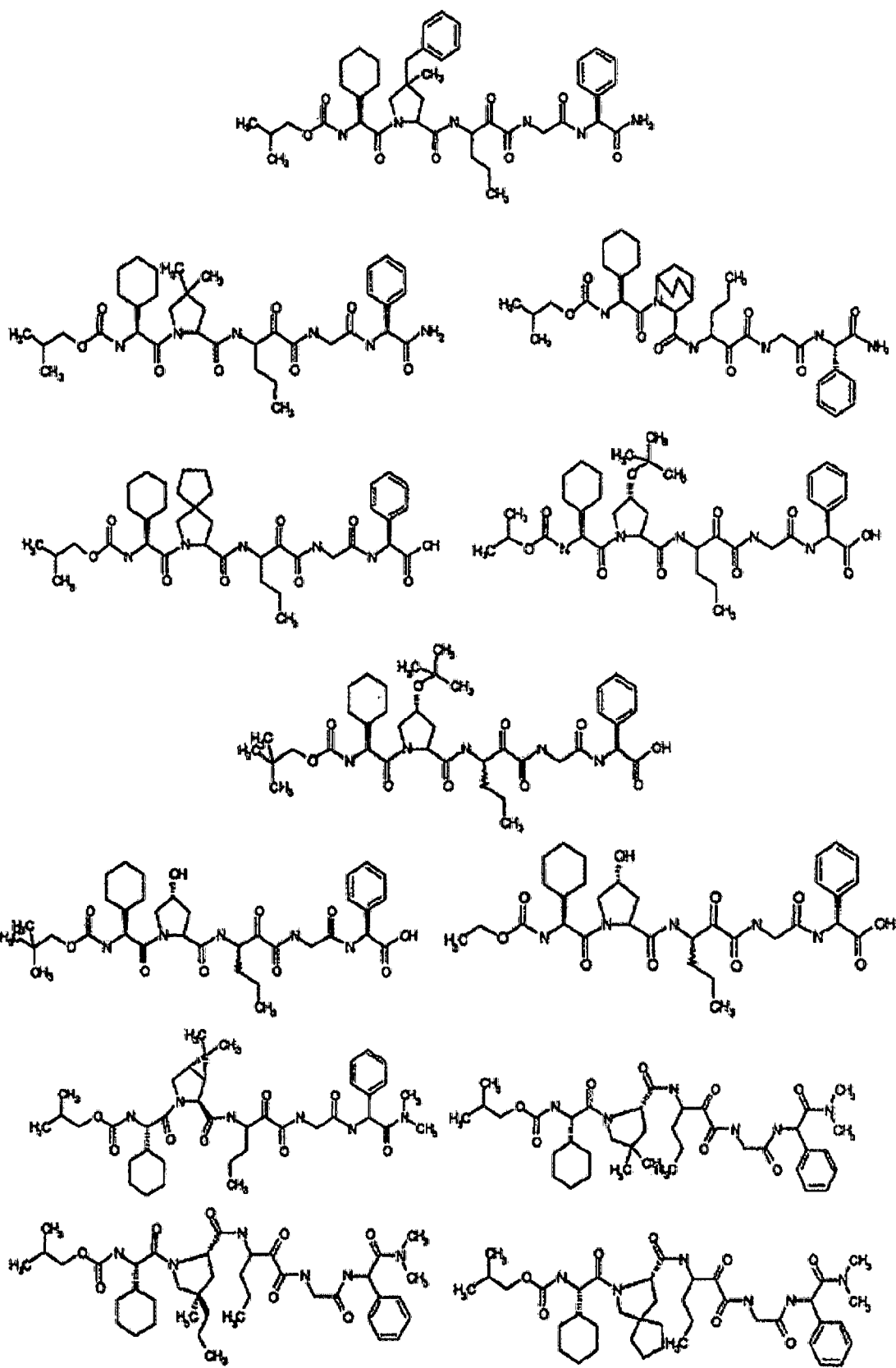
VS



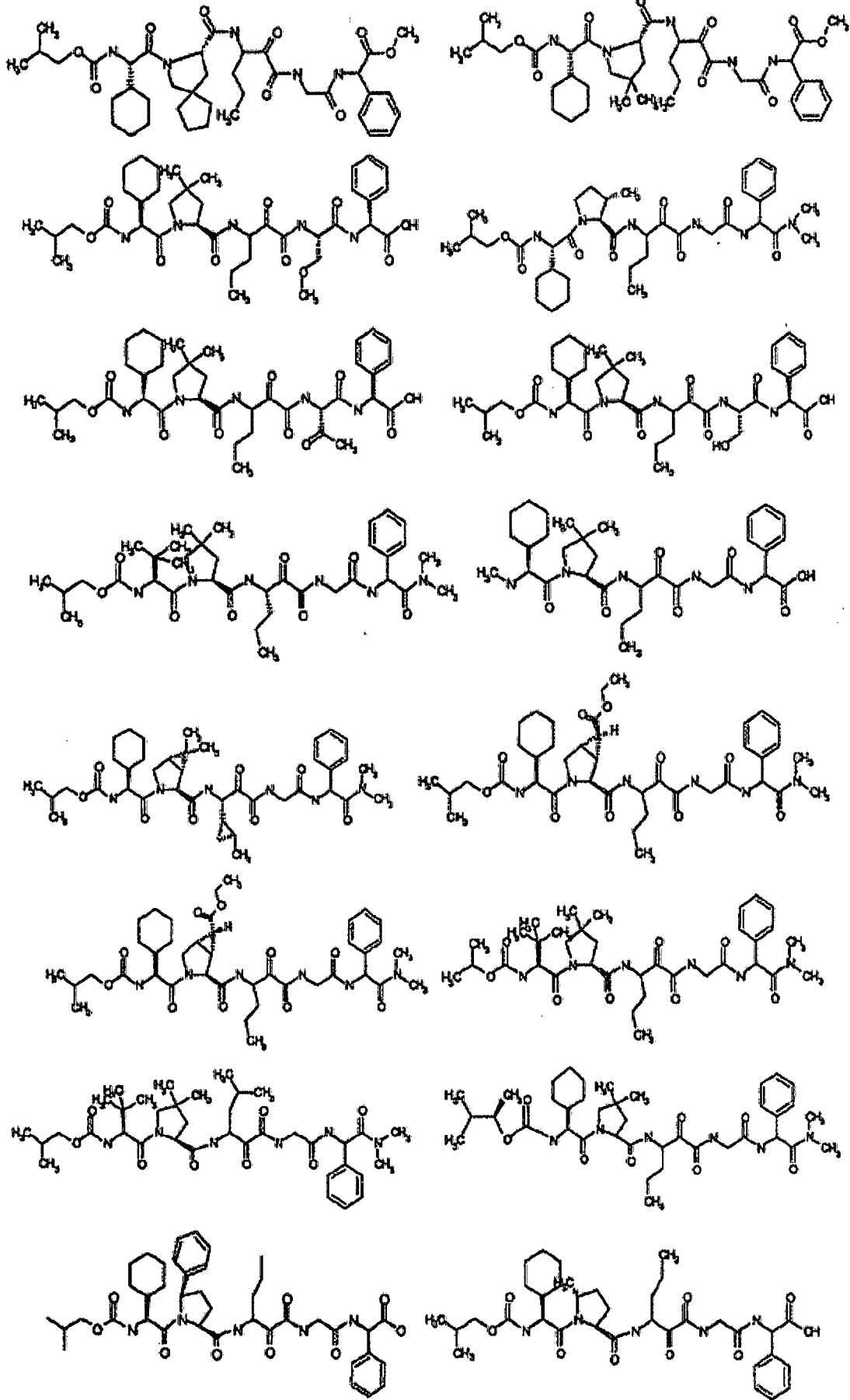
2341

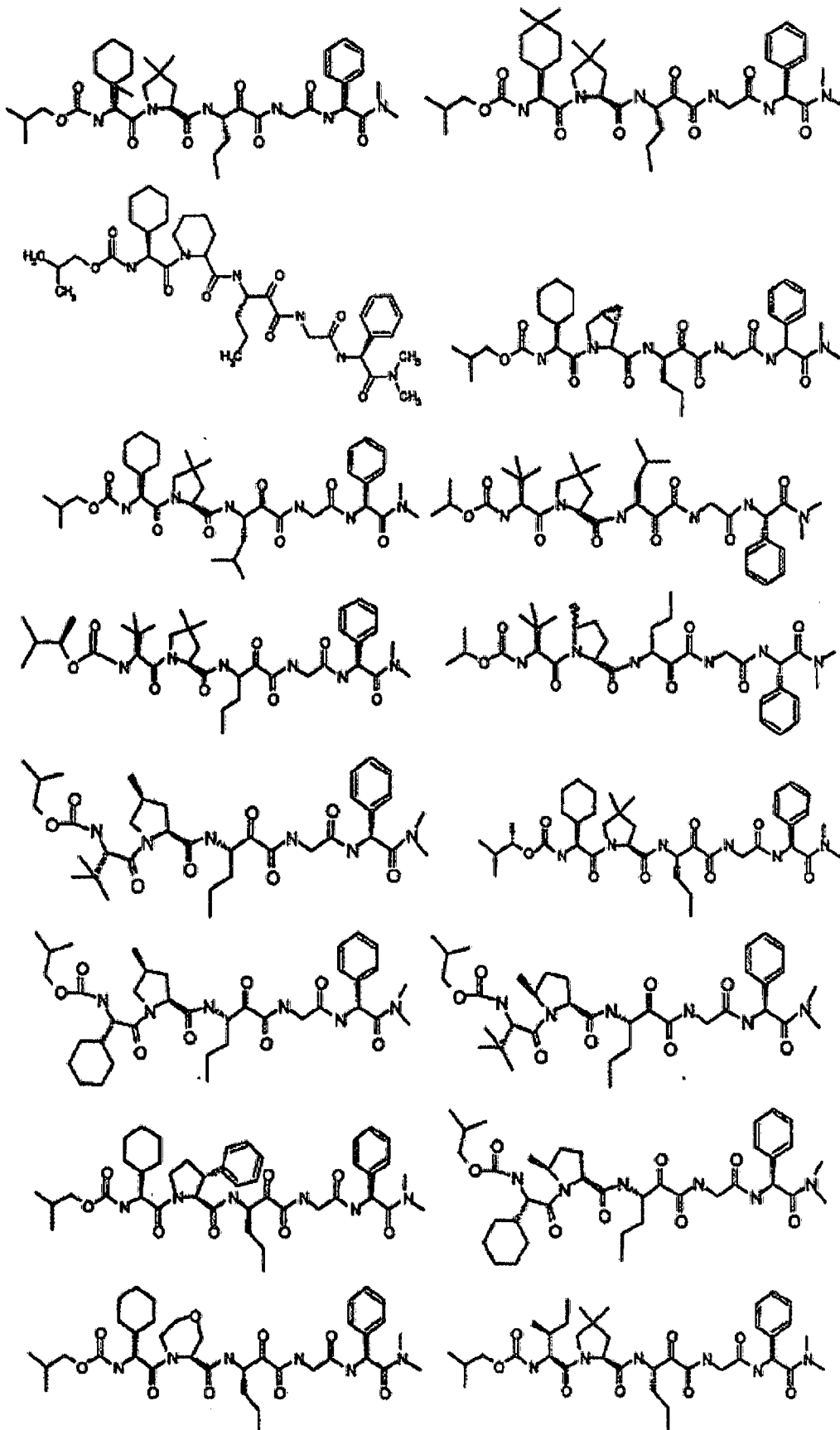
V6



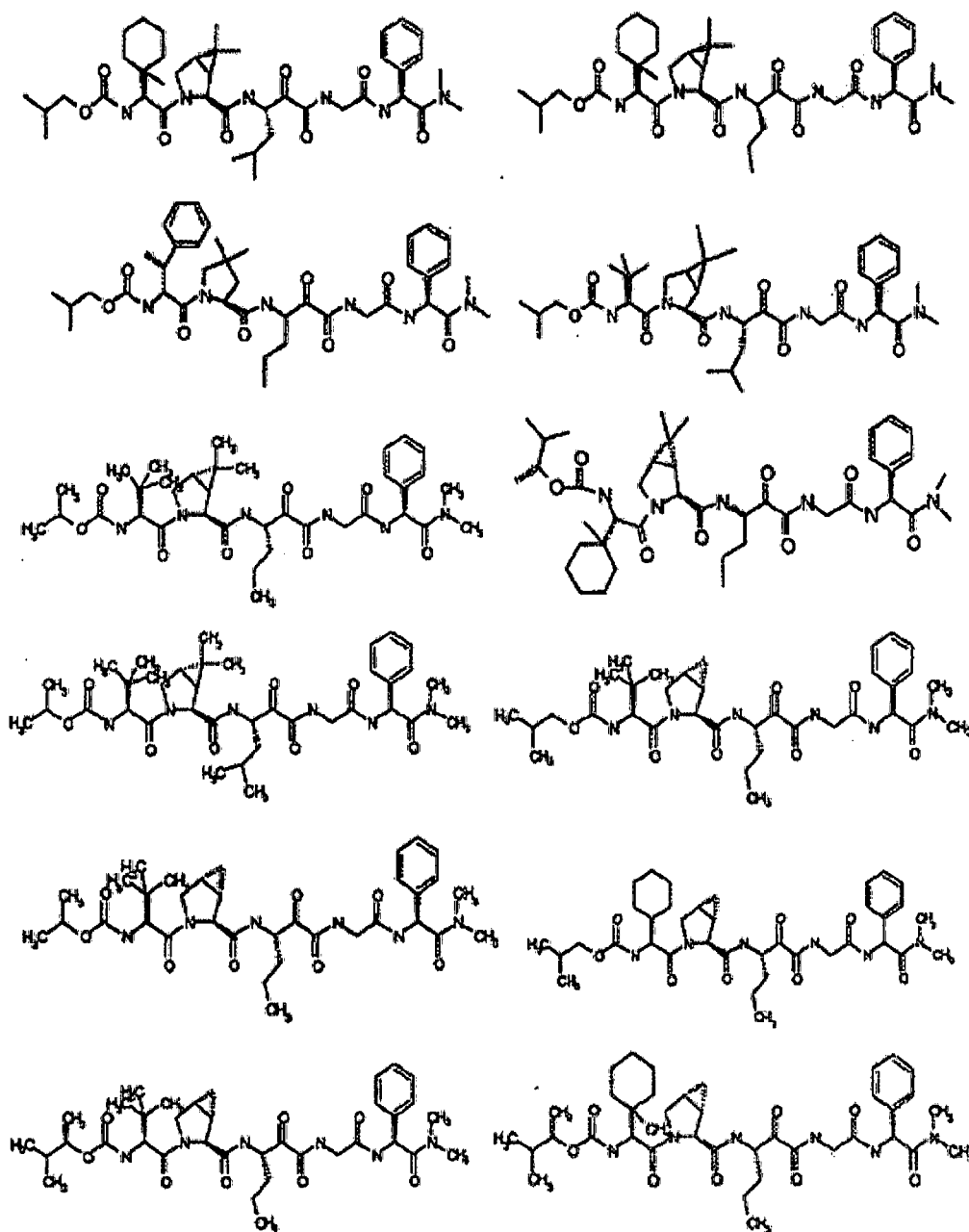


48





50



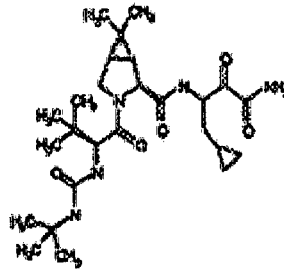
31. Una composición farmacéutica para el tratamiento de trastornos asociados con el HCV, dicha composición comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de uno o más compuestos de la Reivindicación 30 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

32. La composición farmacéutica de la Reivindicación 31, que contiene adicionalmente un (a) agente antiviral o (b) un interferón o un conjugado alfa del PEG-interferon, o ambos (a) y (b).

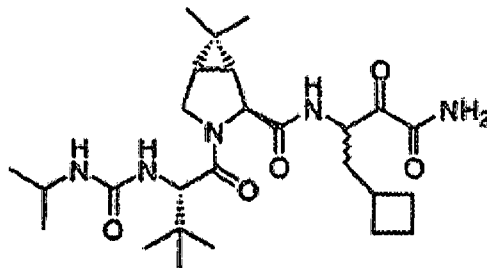
51

33. La composición farmacéutica de la Reivindicación 32, donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón.

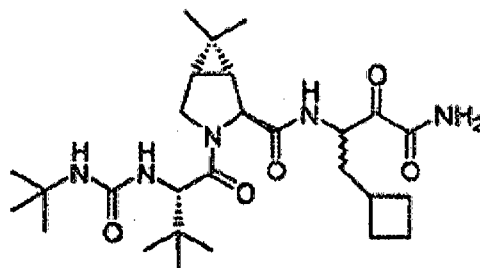
34. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



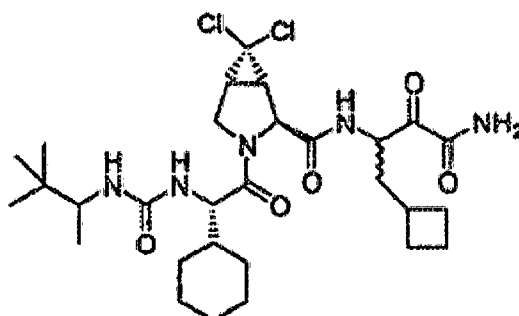
35. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



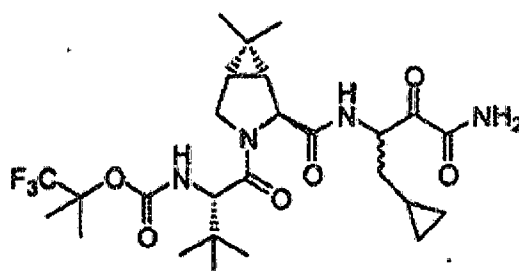
36. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



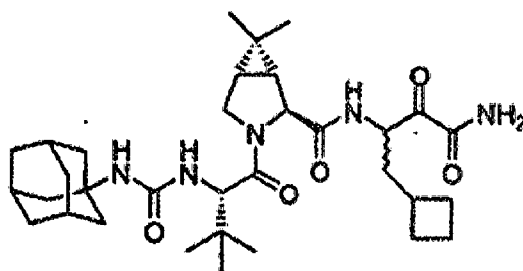
37. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



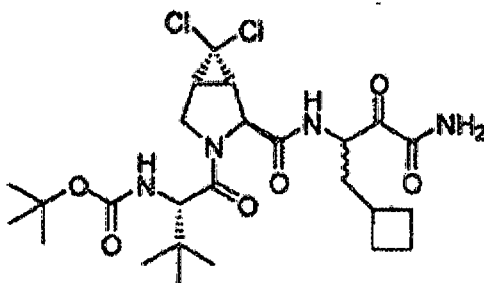
38. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



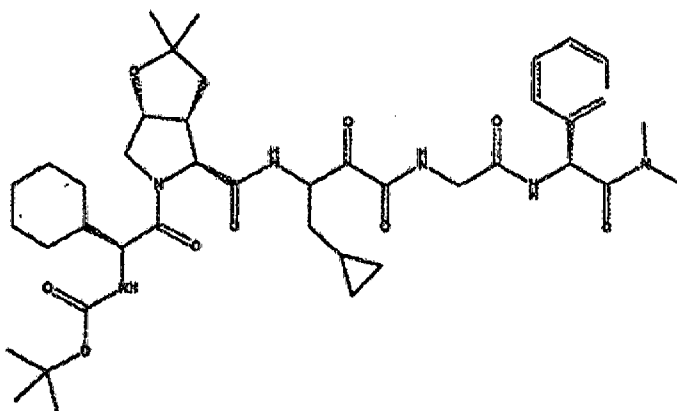
39. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



40. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

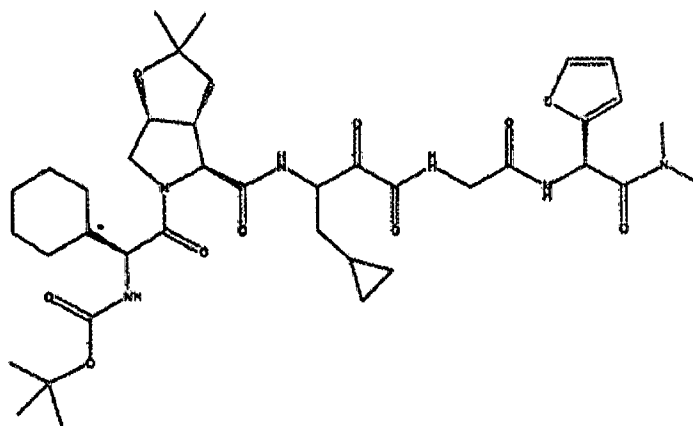


41. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

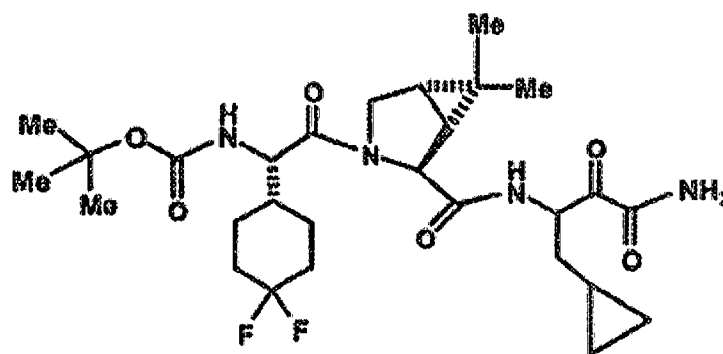


42. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

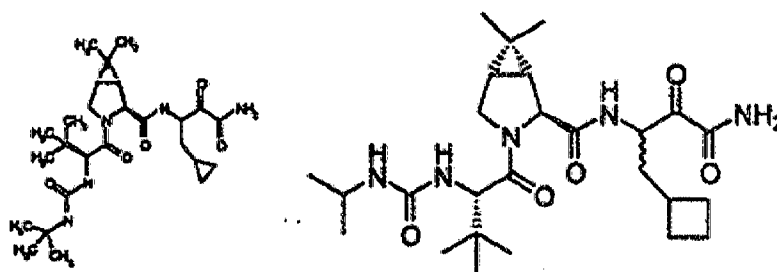
54

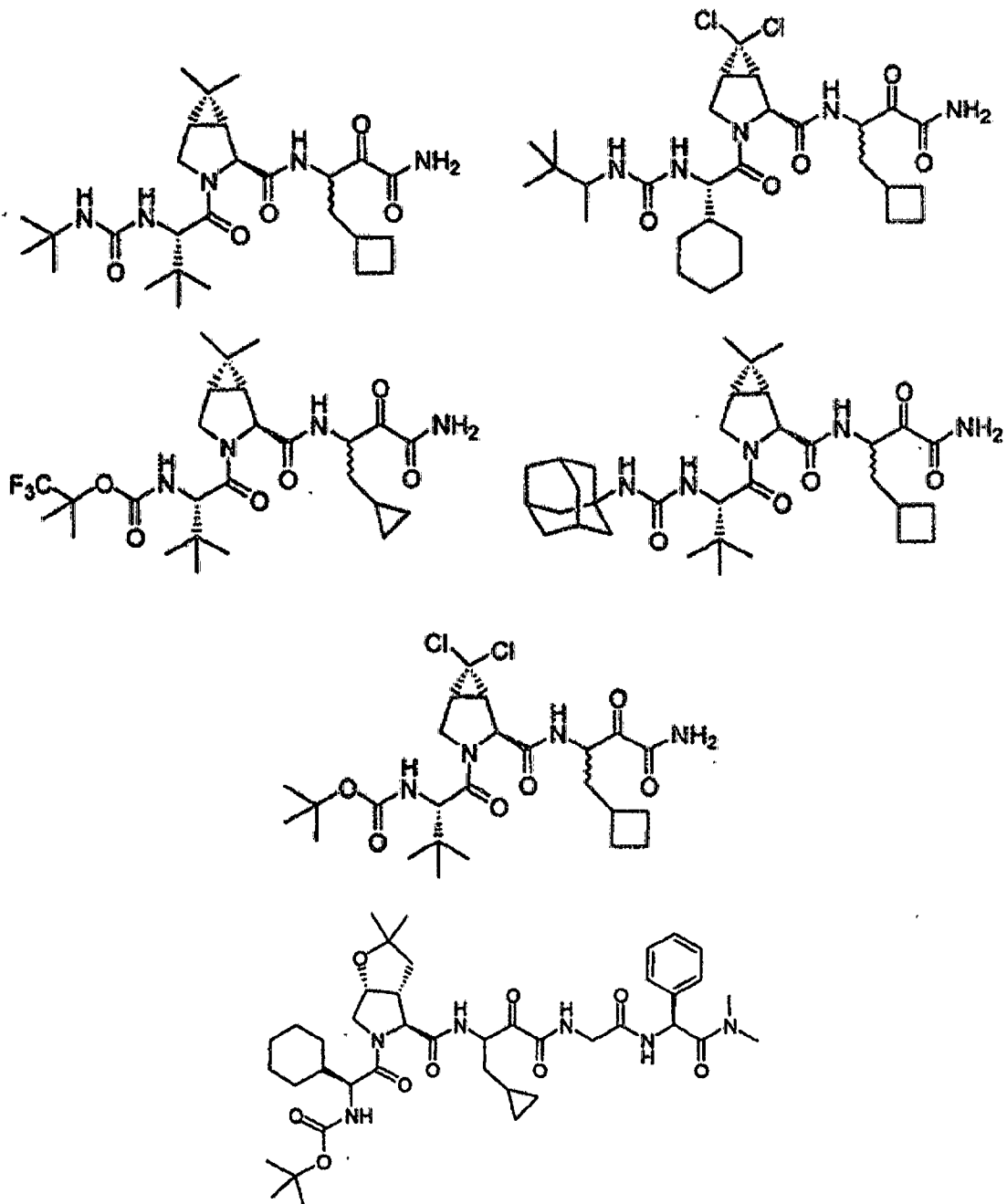


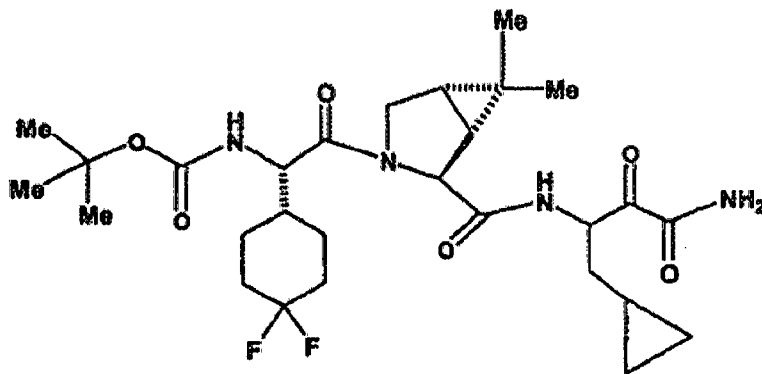
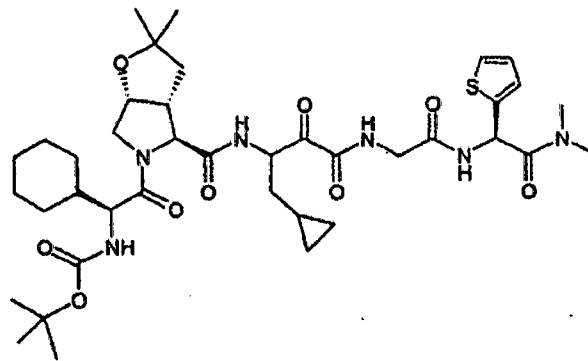
43. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



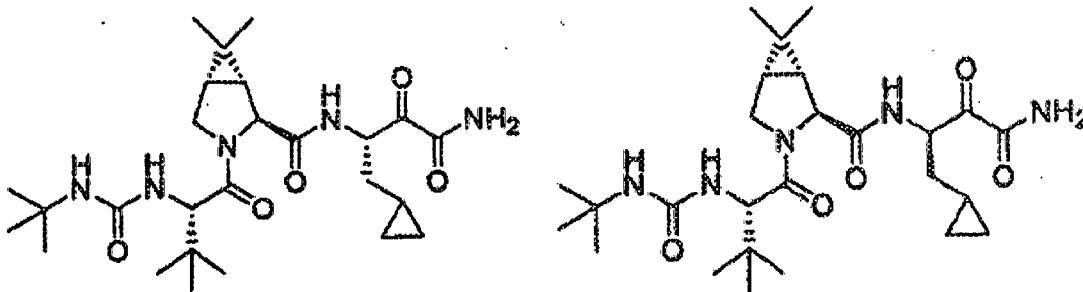
44. Una composición farmacéutica que comprende como ingrediente activo un compuesto, incluyendo enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, donde dicho compuesto es seleccionado de los siguientes:



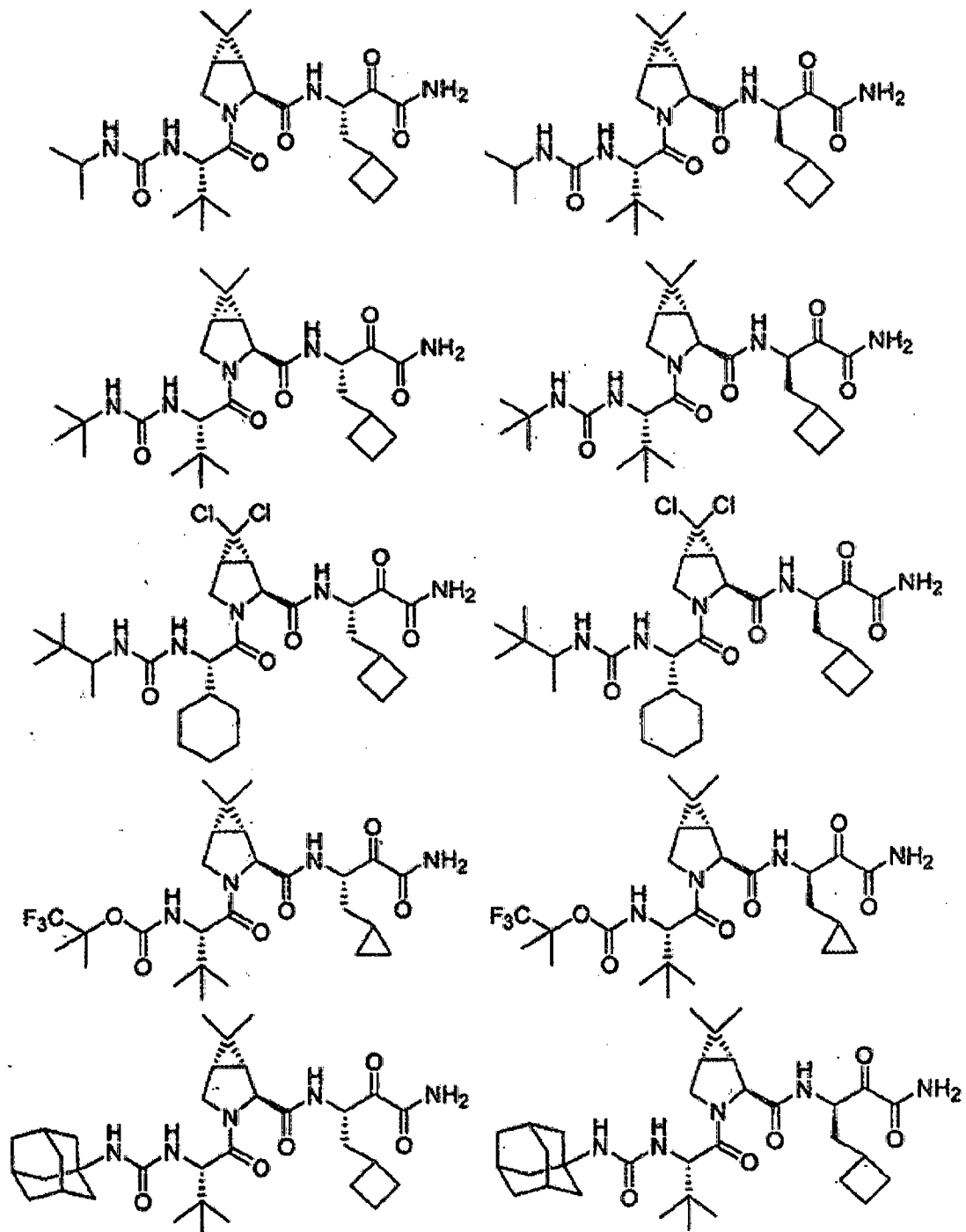


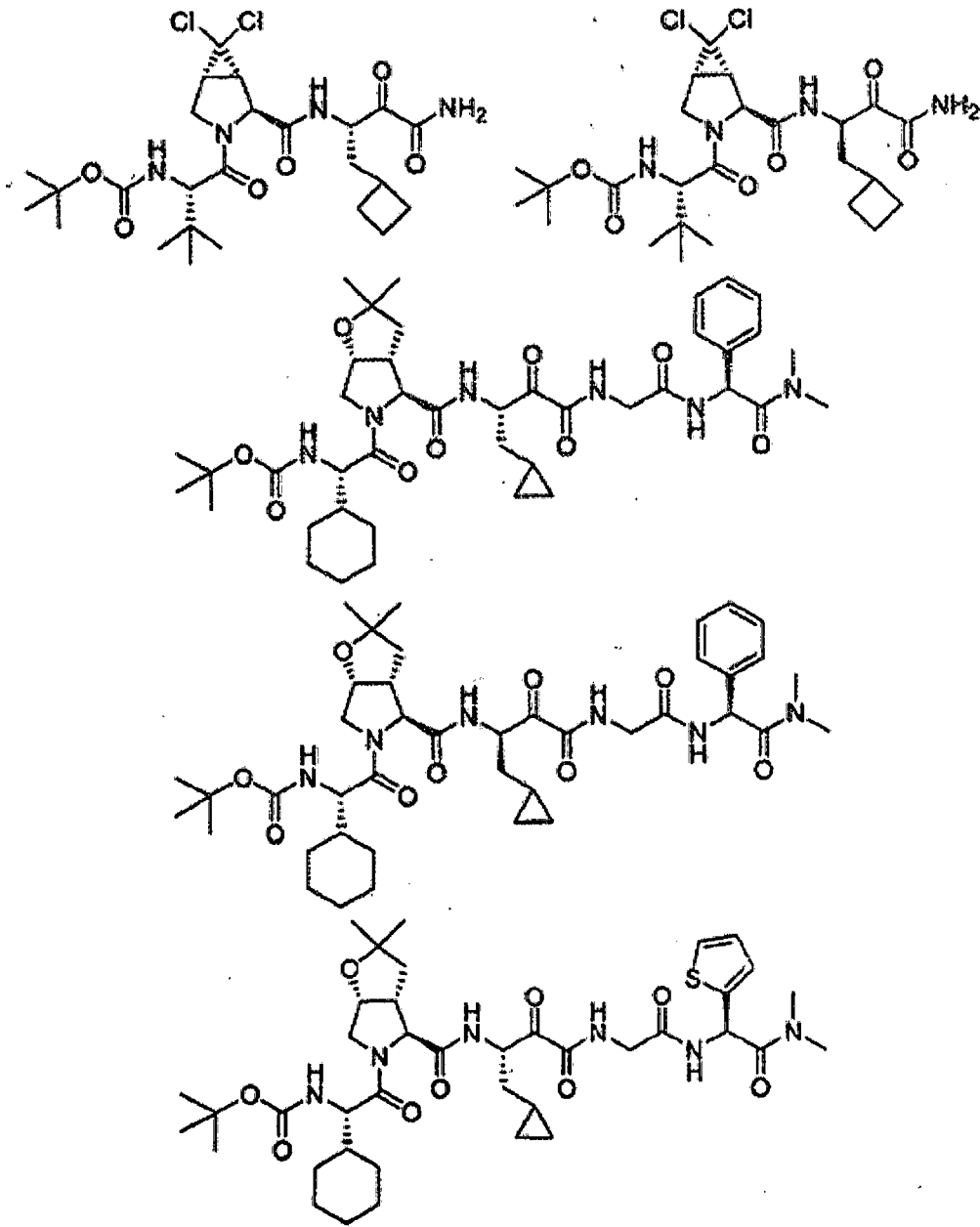


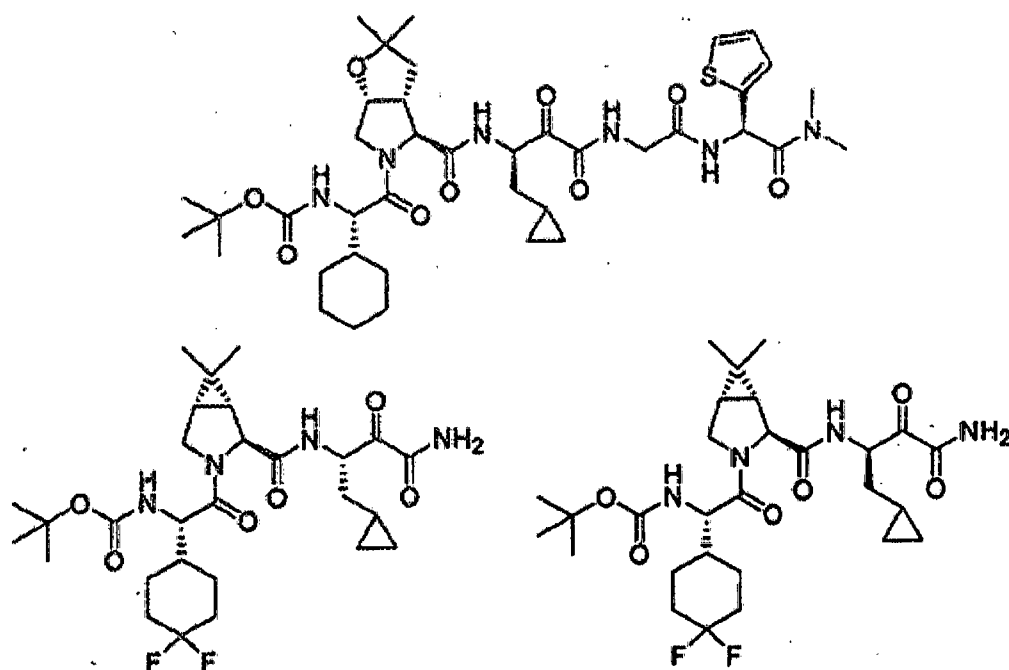
45. La composición farmacéutica de la Reivindicación 44 que contiene (a) un agente antiviral o (b) un interferón o un conjugado de PEG-interferón alfa, o ambos (a) y (b).
46. La composición farmacéutica de la Reivindicación 45, en donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón.
47. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de la Reivindicaciones 34 a 46, dicho compuesto se selecciona de los siguientes:



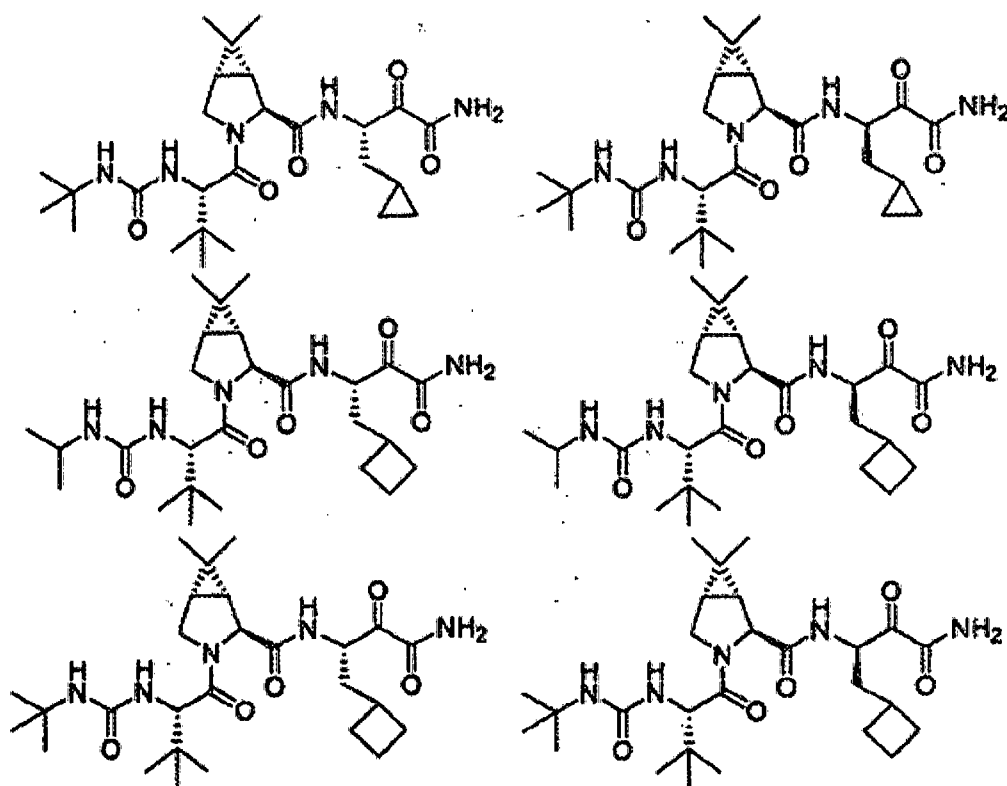
57



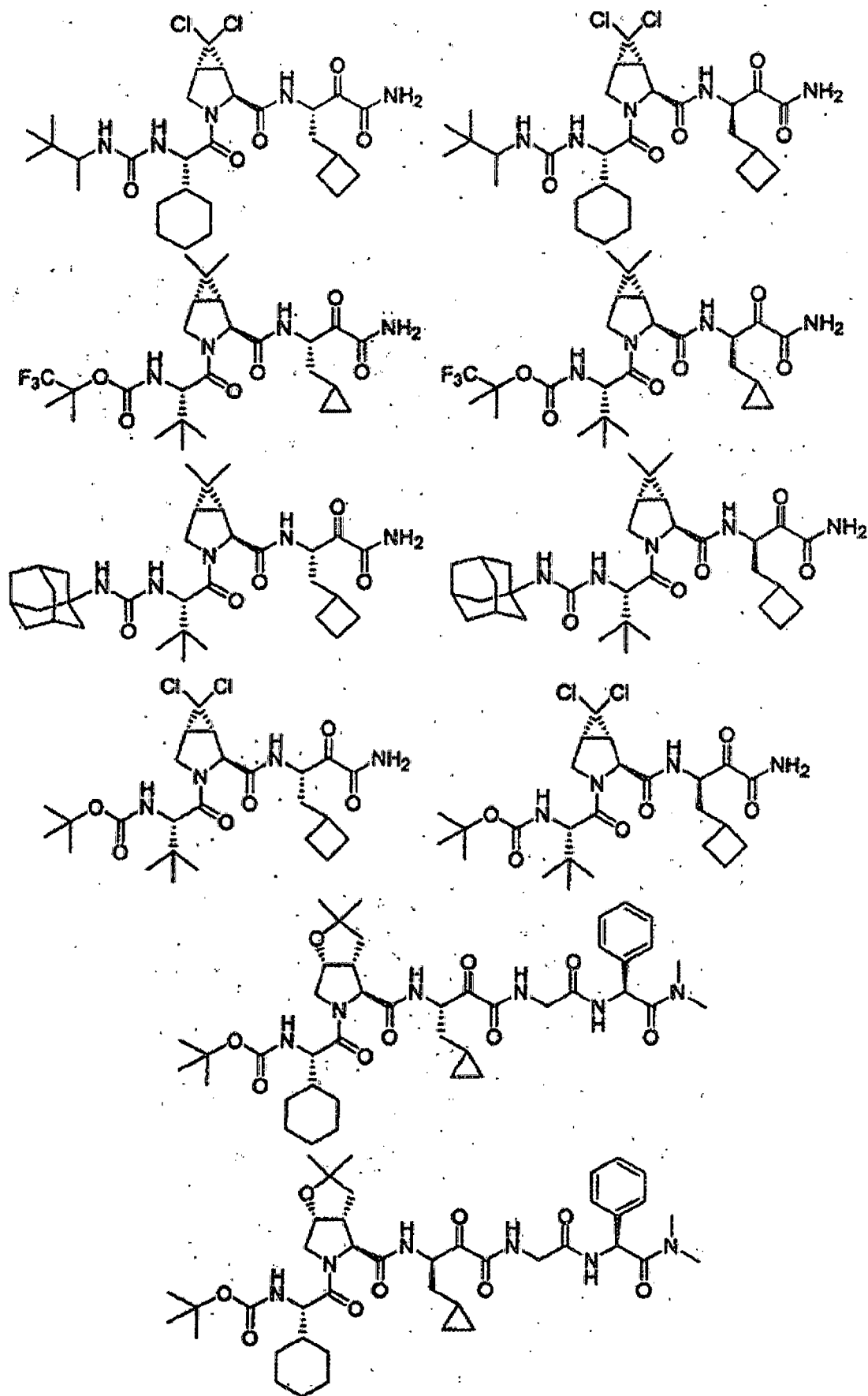




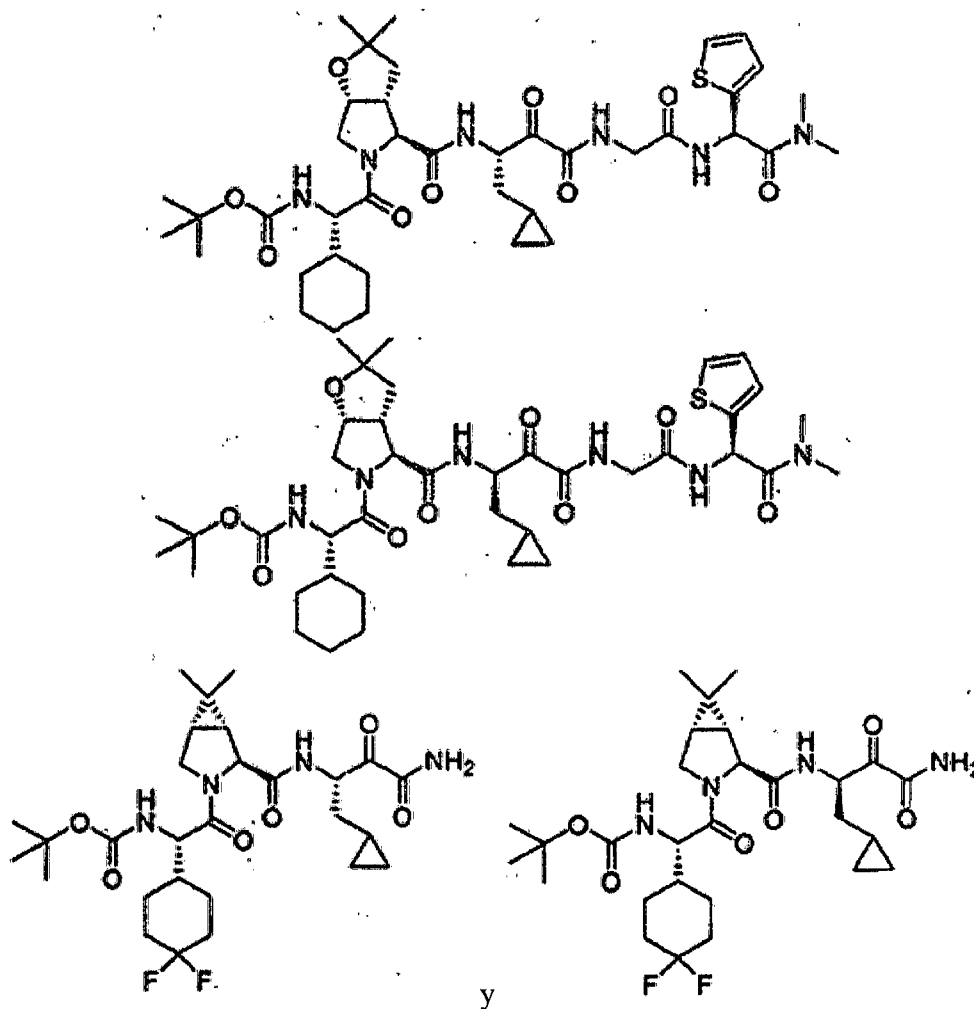
48. La composición farmacéutica de la Reivindicación 44, donde dicho compuesto se selecciona de los siguientes:



60



61



49. La composición farmacéutica de la Reivindicación 48, que contiene adicionalmente (a) un agente antiviral, o (b) un interferón o un conjugado interferón-alfa, o ambos (a) y (b).

50. La composición farmacéutica de la Reivindicación 49, donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es interferón-alfa.

52

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

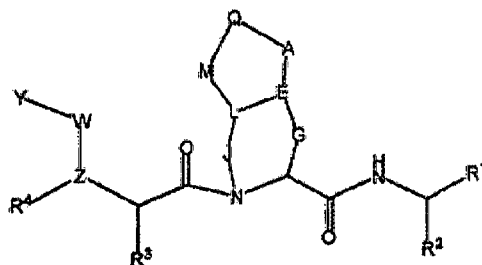
- Se eliminaron las Reivindicaciones 2, 3, 30, 31, 33, 35-38, 42, 44-50, 63, 65-85, 88, 90-103.
- Se adicionó la Reivindicación 47, compuesta por las estructuras de las antiguas Reivindicaciones 66 a 85.
- Se eliminó el término prófármaco.

63

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto, que incluye enantiómeros, esteroisómeros, rotámeros, tautómeros y racematos, de dicho compuesto, y sus sales aceptables para uso farmacéutico o los solvatos de dicho compuesto, dicho compuesto posee la estructura que se muestra en la Fórmula I:



Fórmula I

en la cual:

Y se selecciona del grupo que consiste de los siguiente grupos funcionales: alquilo, alquil-arilo, heteroalquilo, heteroarilo, aril-heteroarilo, alquil-heteroarilo, cicloalquilo, alquiloxi, alquil-ariloxi, ariloxi, heteroariloxi, heterocicloalquiloxi, cicloalquiloxi, alquilamino, arilamino, alquil-arilamino, arilamino, heteroarilamino, cicloalquilamino y heterocicloalquilamino, con la condición de que Y puede ser sustituido en forma opcional con X^{11} o X^{12} ;

X^{11} es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, alquilarilo, arilalquilo, heteroarilo, alquilheteroarilo, o heteroarilalquilo, con la condición de que X^{11} puede sustituirse en forma opcional con X^{12} ;

X^{12} es hidroxí, alcoxi, ariloxi, tio, alquiltio, ariltio, amino, alquilamino, arilamino, alquilsulfonilo, alquilsulfonamido, arilsulfonamido, carboxi, carbalcoxi, carboxamido, alcóxicarbonilamino, alcóxicarboniloxi, alquilureido, arilureido, alógeno, ciano, o nitro, con la condición de que dicho alquilo, alcoxi, y arilo pueden sustituirse en forma opcional con grupos funcionales seleccionados en forma independiente de X^{12} ;

R^1 es $\text{COCONR}^9\text{R}^{10}$, donde R^9 es H, R^{10} es H, R^{14} , $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]\text{pCOOR}^{11}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]\text{pCONR}^{12}\text{R}^{13}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]\text{pSO}_2\text{R}^{11}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]\text{pSO}_2\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$, $[\text{CH}(\text{R}^{1'})]\text{pCOR}^{11}$,

2359
61

$\text{CH}(\text{R}^1)\text{CONHCH}(\text{R}^2)\text{COOR}^{11}$, $\text{CH}(\text{R}^1)\text{CONHCH}(\text{R}^2)\text{CONR}^{12}\text{R}^{13}$, o $\text{CH}(\text{R}^1)\text{CONHCH}(\text{R}^2)(\text{R}')$, donde R^1 , R^2 , R^{11} , R^{12} , y R^{13} se seleccionan en forma independiente del grupo que comprende H, alquilo, arilo, heteroalquilo, heteroarilo, cicloalquilo, alquil-arilo, alquil-heteroarilo, aril-alquilo y heteroaralquilo, y donde R^{14} es H, alquilo, arilo, heteroalquilo, heteroarilo, cicloalquilo, alquil-arilo, alquil-heteroarilo, aril-alquilo, alquénilo, alquinilo o heteroaralquilo;

Z se selecciona de O, N, H, CH, o CR;

W puede estar presente o ausente, y si W está presente, W se selecciona de C=O, C=S, C(=N-CN) o SO₂;

Q puede estar presente o ausente, y cuando Q está presente, Q es CH, N, P, (CH₂)_p, (CHR)_p, (CRR')_p, O, NR, S o SO₂; y cuando Q está ausente, M puede estar presente o ausente; cuando Q y M están ausentes, A se enlaza directamente a L;

A es O, CH₂, (CHR)_p, (CHR-CHR')_p, (CRR')_p, NR, S o SO₂ o un enlace;

E es CH, N, CR, o un doble enlace hacia, A, L o G;

G puede estar presente o ausente, y cuando G está presente, G es (CH₂)_p, o (CRR')_p; y cuando G está ausente, J está presente y E está enlazado directamente al átomo de carbono así como G se encuentra enlazado en la Fórmula I;

J puede estar presente o ausente, y cuando J está presente, J es (CH₂)_p, (CHR)_p, o (CRR')_p, SO₂, NH, NR u O; y cuando J está ausente, G está presente y E está unido directamente al N que se muestra en la Fórmula I unido a J;

L puede estar presente o ausente, y cuando L está presente, L es CH, CR, O, S o NR; y cuando L está ausente, entonces M puede estar presente o ausente, y si M está presente cuando L está ausente, entonces M se enlaza en forma directa e independiente a E, y J se enlaza directa e independientemente a E;

M puede estar presente o ausente, y cuando M está presente, M es O, NR, S, SO₂, (CH₂)_p, (CHR)_p(CHR-CHR)_p, o (CRR')_p;

p es un número de 0 a 6; y

R, R', R², R³ y R⁴ se seleccionan de forma independiente del grupo que comprende H; alquilo C₁-C₁₀, alquénilo C₂-C₁₀; cicloalquilo C₃-C₈, heterocicloalquilo, alcoxi, ariloxi, alquiltio, ariltio, amino, amido, éster, ácido carboxílico, carbamato, urea, cetona, aldehído, ciano, nitro halógeno; (cicloalquilo)alquilo y (heterocicloalquilo)alquilo, donde dicho cicloalquilo está formado por tres a ocho átomos de carbono, y de cero a seis átomos de oxígeno, nitrógeno, azufre o fósforo, y

dicho alquilo es de 1 a seis átomos de carbono; arilo, heteroarilo, alquil-arilo y alquil-heteroarilo;

donde dichos grupos funcionales alquilo, heteroalquilo, alquenilo heteroalquenilo, arilo, heteroarilo, cicloalquilo y heterocicloalquilo pueden ser sustituidos opcionalmente y químicamente apropiado para la química, donde dicho término "sustituidos" se refiere a una sustitución opcional y químicamente apropiada con uno o más grupos funcionales seleccionados del grupo que comprende alquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, aralquilo, cicloalquilo, heterocíclico, halógeno, hidroxilo, tio, alcoxi, ariloxi, alquiltio, ariltio, amino, amido, éster, ácido carboxílico, carbamato, urea, cetona, aldehído, ciano, nitro, sulfonamido, sulfóxido, sulfato, sulfonil urea, hidrazina, e hidroxamato;

además donde dicha unidad N-C-G-E-L-J-N representa una estructura de anillo cíclico de cinco a seis miembros con la condición de que cuando dicha unidad N-C-G-E-L-J-N representa una estructura de anillo cíclico de cinco miembros, o cuando la estructura de anillo bicíclico de la Fórmula I comprende N, C, G, E, L, J, N, A, Q y M representa una estructura de anillo cíclico de cinco miembros, dicha estructura de anillo cíclico de cinco miembros carece de un grupo carbonilo como parte del anillo cíclico.

2. El compuesto de la Reivindicación 1, en el cual R^{10} es H, R^{14} , $[CH(R^{1'})]_pCOOR^{11}$, $CH(R^{1'})CONR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})CONR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2R^{11}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2NR^{12}R^{13}$, $CH(R^{1'})CH(R^{1'})COR^{11}$, $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR^{11}$, $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR^{12}R^{13}$, o $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})(R')$, en donde $R^{1'}$ es H o alquilo, y $R^{2'}$ es fenilo, fenilo sustituido, fenilo sustituido por un heteroátomo, tiofenilo, cicloalquilo, piperidilo o piridilo.

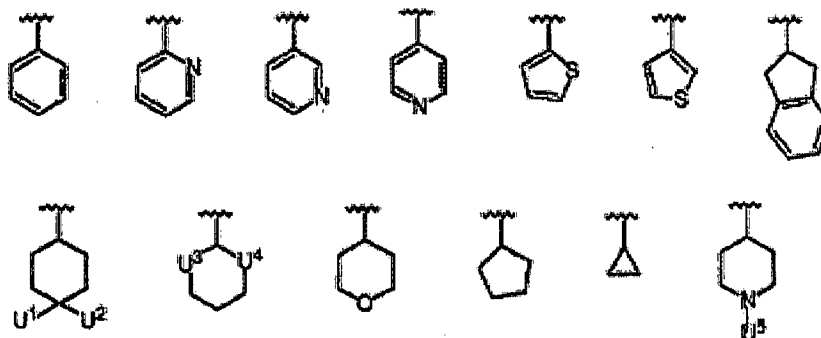
3. El compuesto de la Reivindicación 2, en el cual $R^{1'}$ es H.

4. El compuesto de la Reivindicación 3, en donde R^{11} es H, metilo, etilo, alilo, terbutilo, bencilo, α -metilbencilo, α,α -dimetilbencilo, 1-metilciclopropilo o 1-metilciclopropilo;

R' es hidroximetilo o $CH_2CONR^{12}R^{13}$;

$R^{2'}$ se selecciona de forma independiente del grupo que consta de:

2361
66



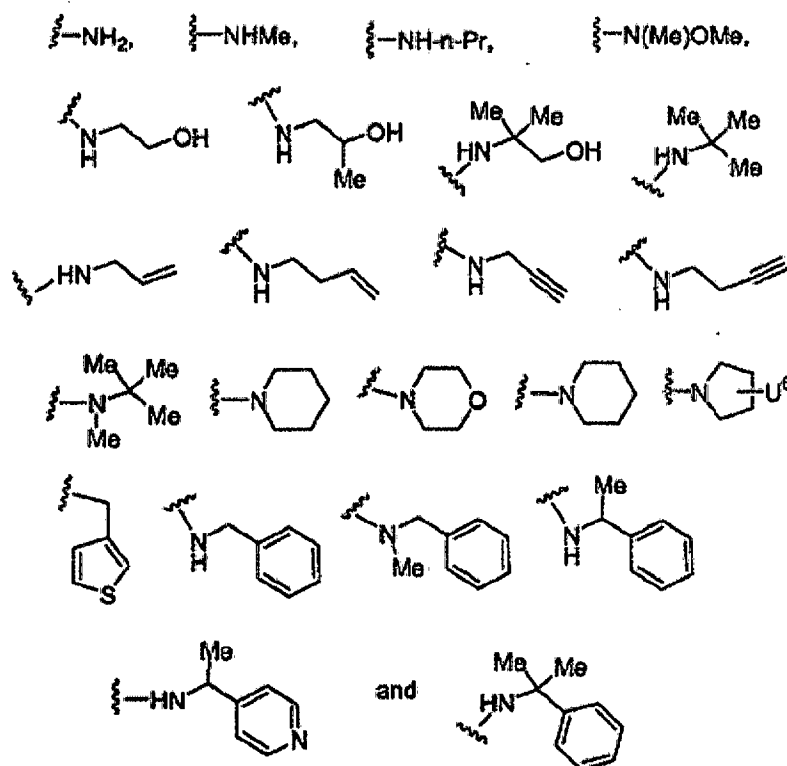
en donde:

U^1 y U^2 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre H, F, CH_2COOH , CH_2COOMe , CH_2CONH_2 , $CH_2CONHMe$, CH_2CONMe_2 azido, amino, hidroxilo, amino sustituido, hidroxilo sustituido;

U^3 y U^4 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de O y S;

U^5 se selecciona de los grupos funcionales que consisten de alquilo, sulfonilo, aril-sulfonilo, heteroalquil-sulfonilo, heteroaril-sulfonilo, alquil-carbonilo, aril-carbonilo, heteroalquilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, alcoxycarbonilo, ariloxycarbonilo, heteroariloxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo, heteroarilaminocarbonilo o una combinación de estos;

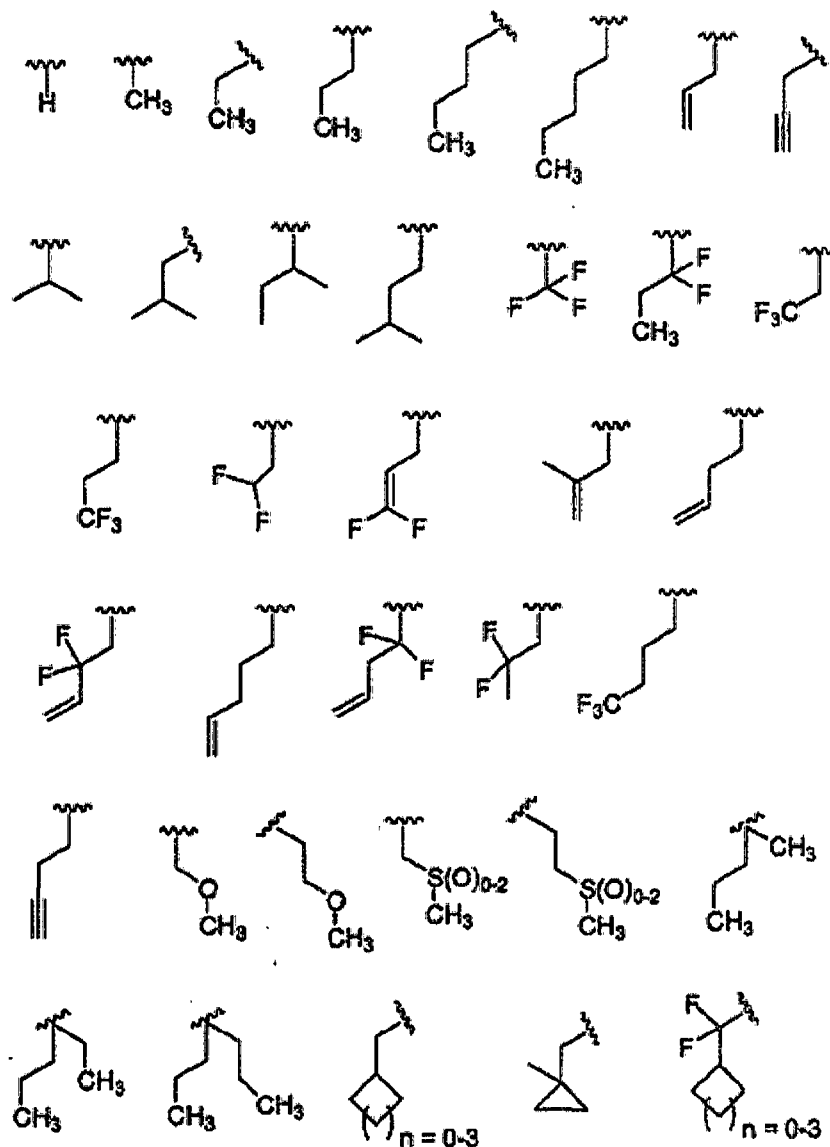
y $NR^{12}R^{13}$ se selecciona del grupo que comprende:

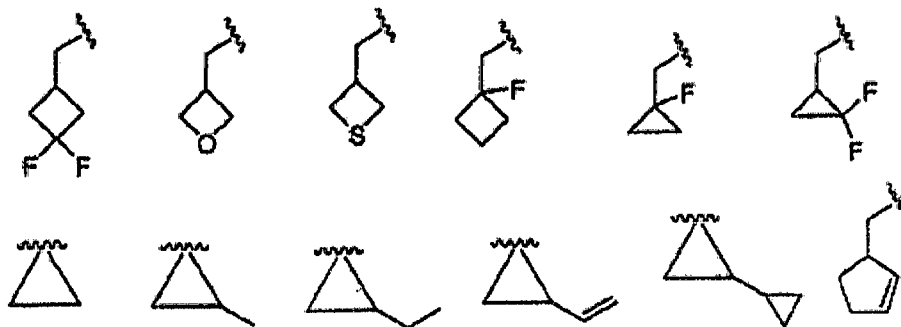


donde U^6 es H, OH, o CH_2OH , y

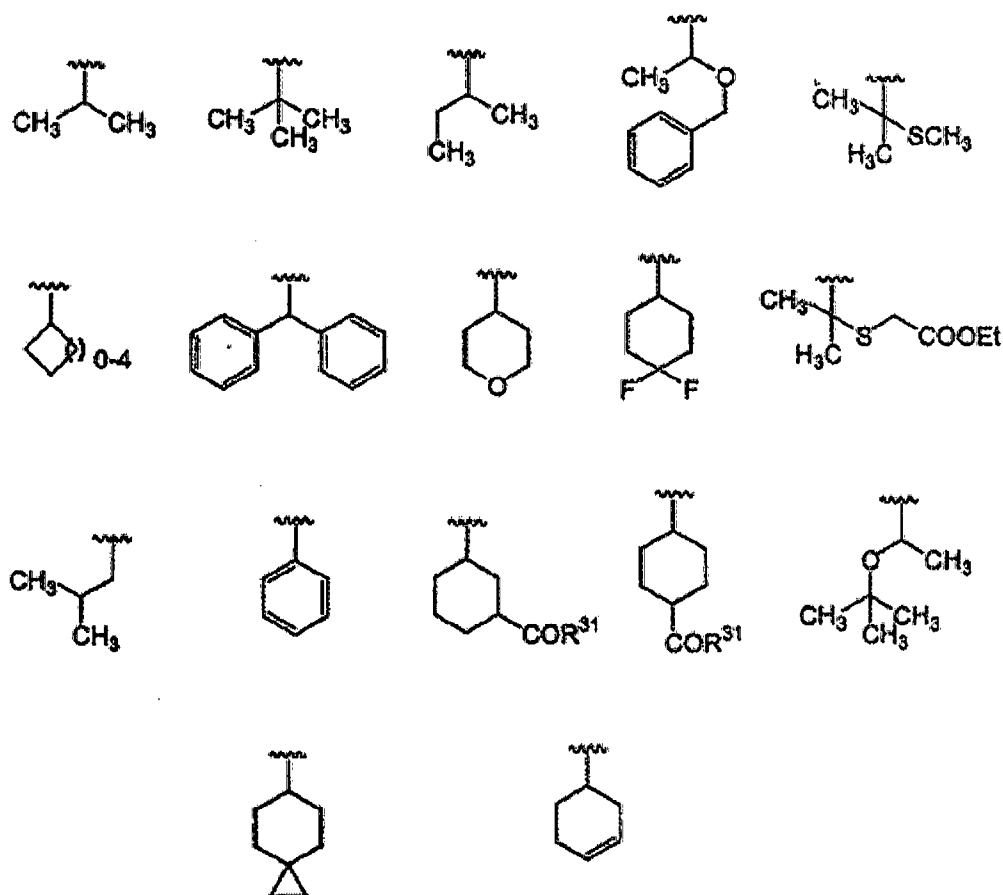
R^{14} se selecciona del grupo que comprende: H, Me, Et, n-propilo, metoxi, ciclopropilo, n-butilo, 1-but-3-inilo, bencilo, α -metilbencilo, fenetilo, alilo, 1-but-3-enilo, OMe, ciclopropilmetilo.

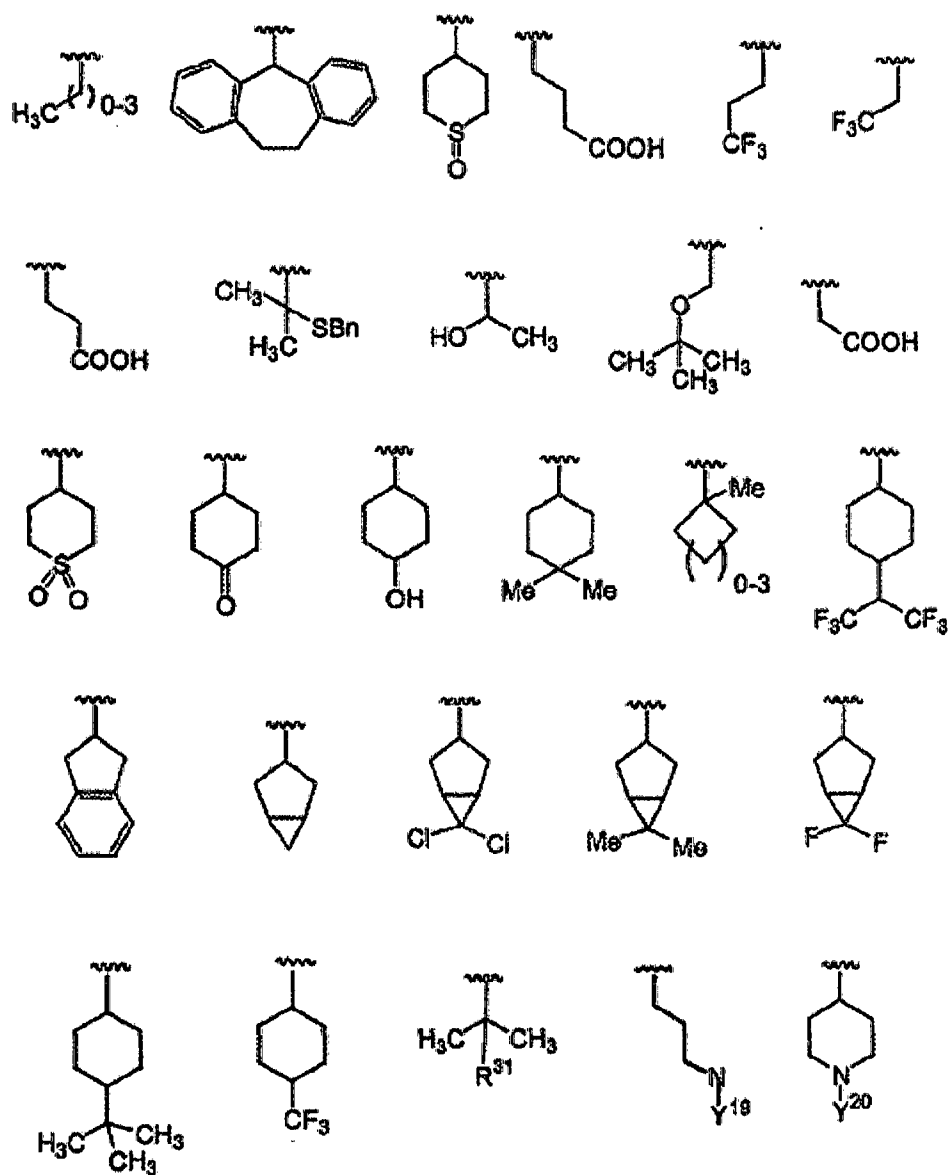
5. El compuesto de la Reivindicación 1 en donde R^2 se selecciona del grupo que comprende las siguientes fracciones:





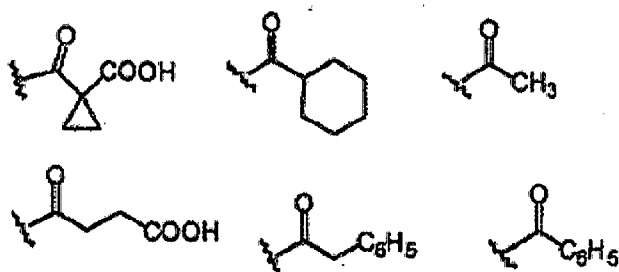
6. El compuesto de la Reivindicación 5, en el cual R^3 se selecciona del grupo que consiste de:



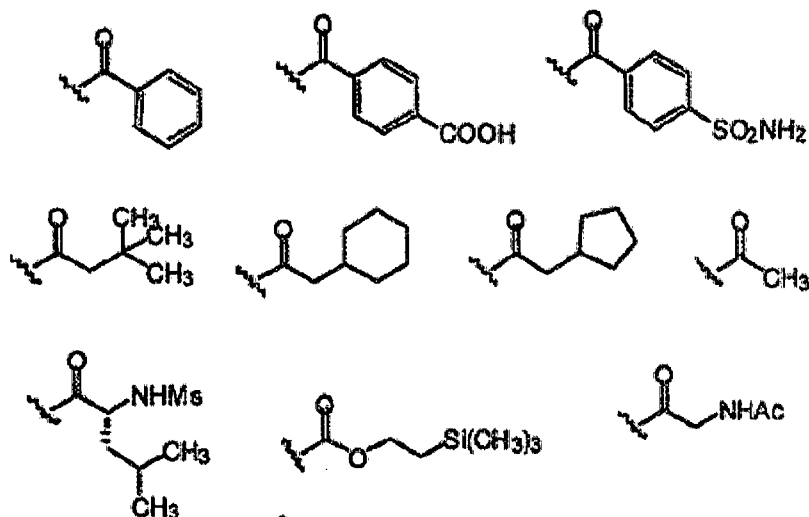


donde $R^{31} = \text{OH}$ u OH-alquilo;

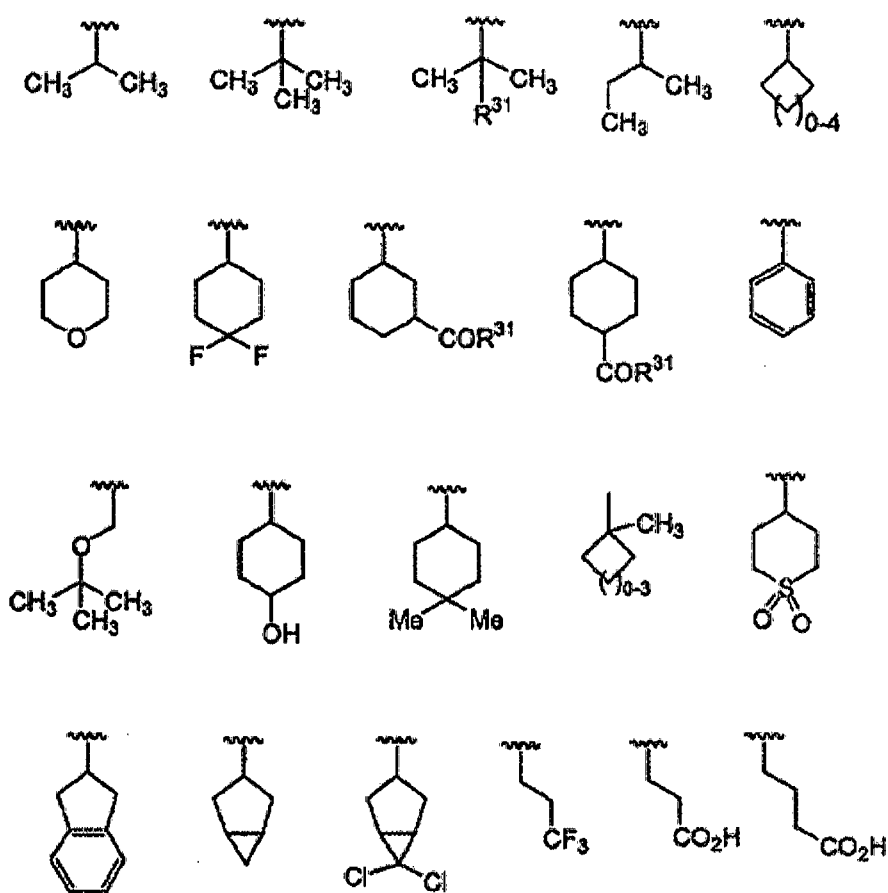
Y^{19} se selecciona de las siguientes fracciones:



e Y^{20} se selecciona de las siguientes fracciones:

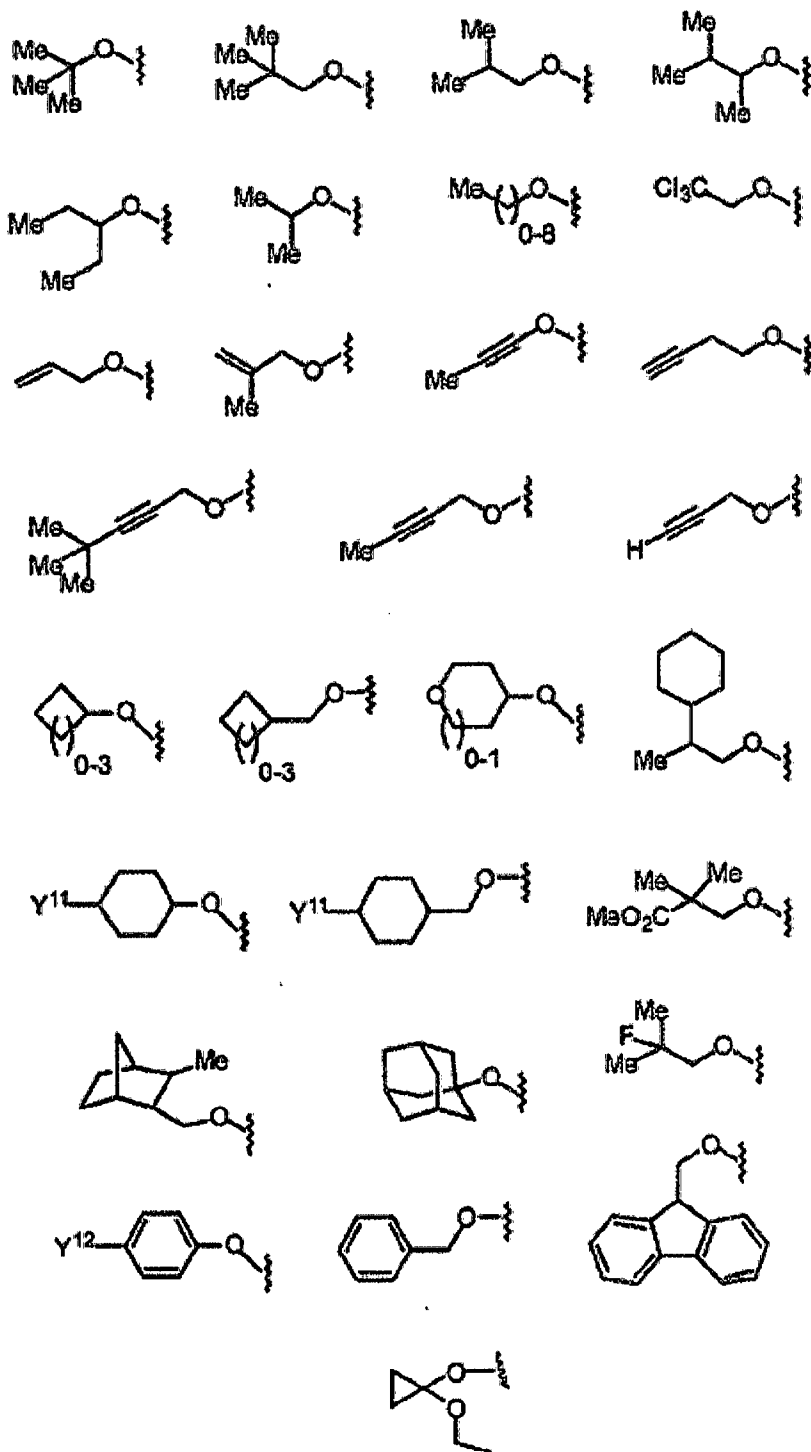


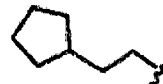
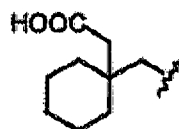
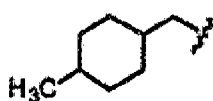
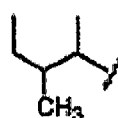
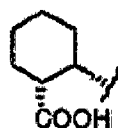
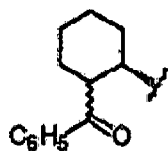
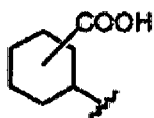
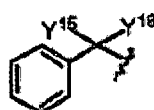
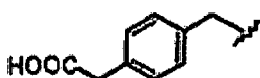
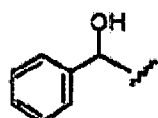
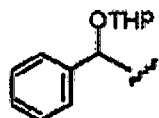
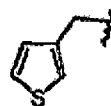
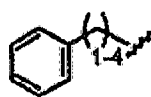
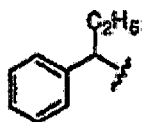
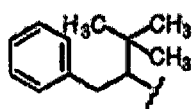
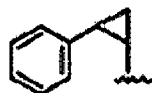
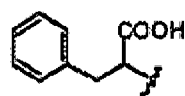
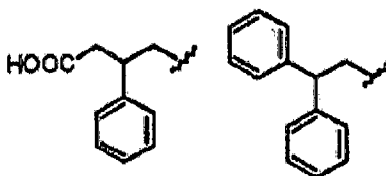
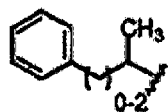
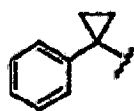
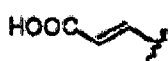
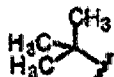
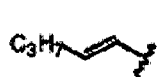
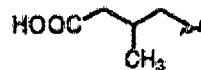
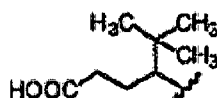
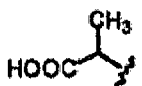
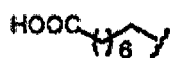
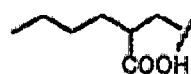
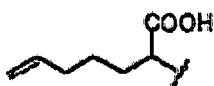
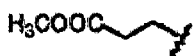
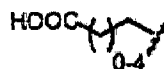
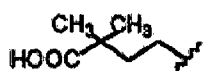
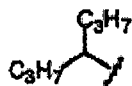
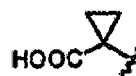
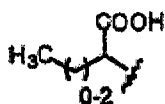
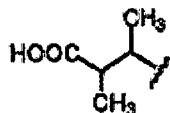
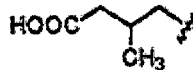
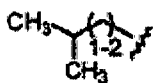
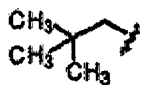
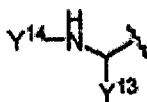
7. El compuesto de la Reivindicación 6, en el cual R^3 se selecciona del grupo que consiste de las siguientes fracciones:

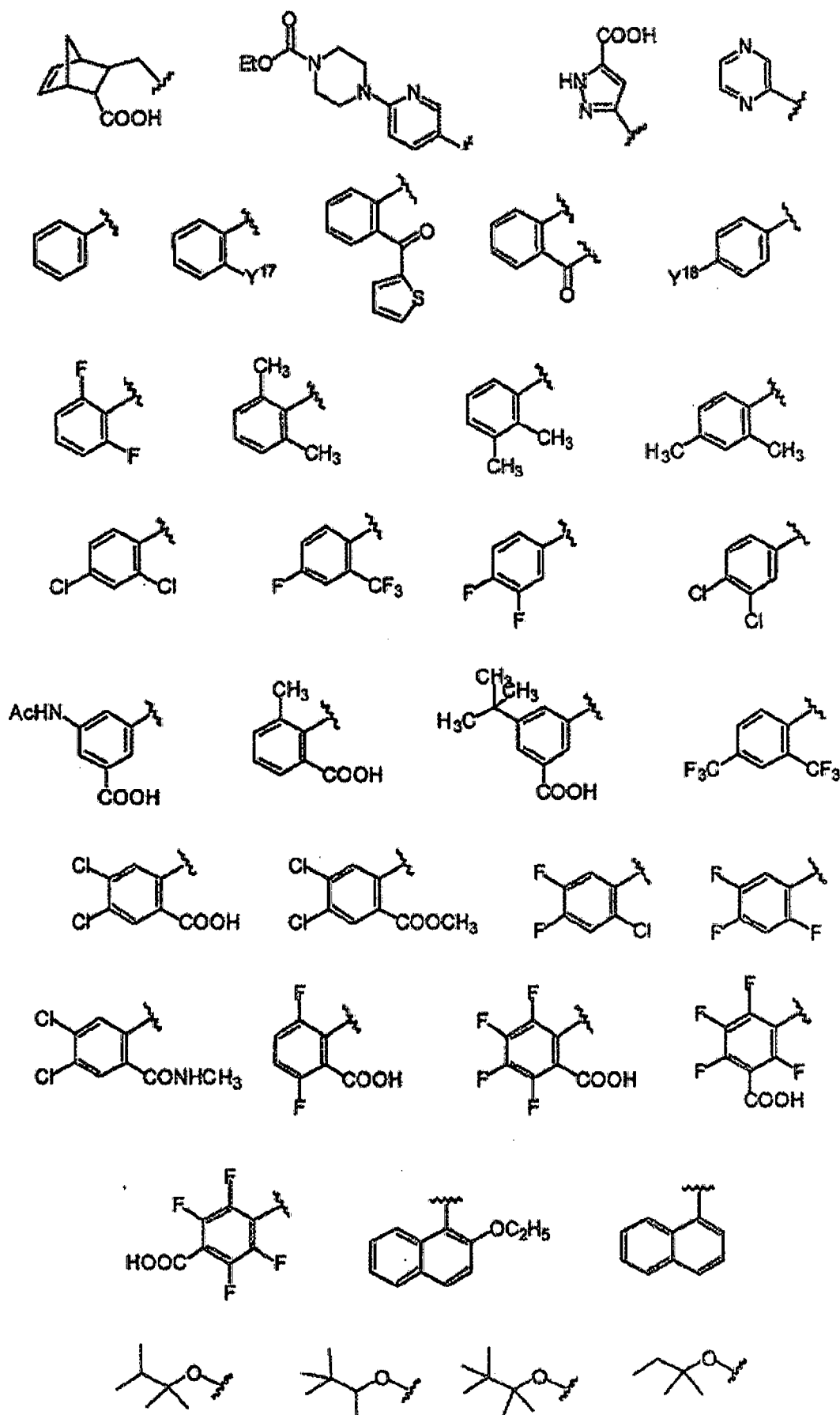


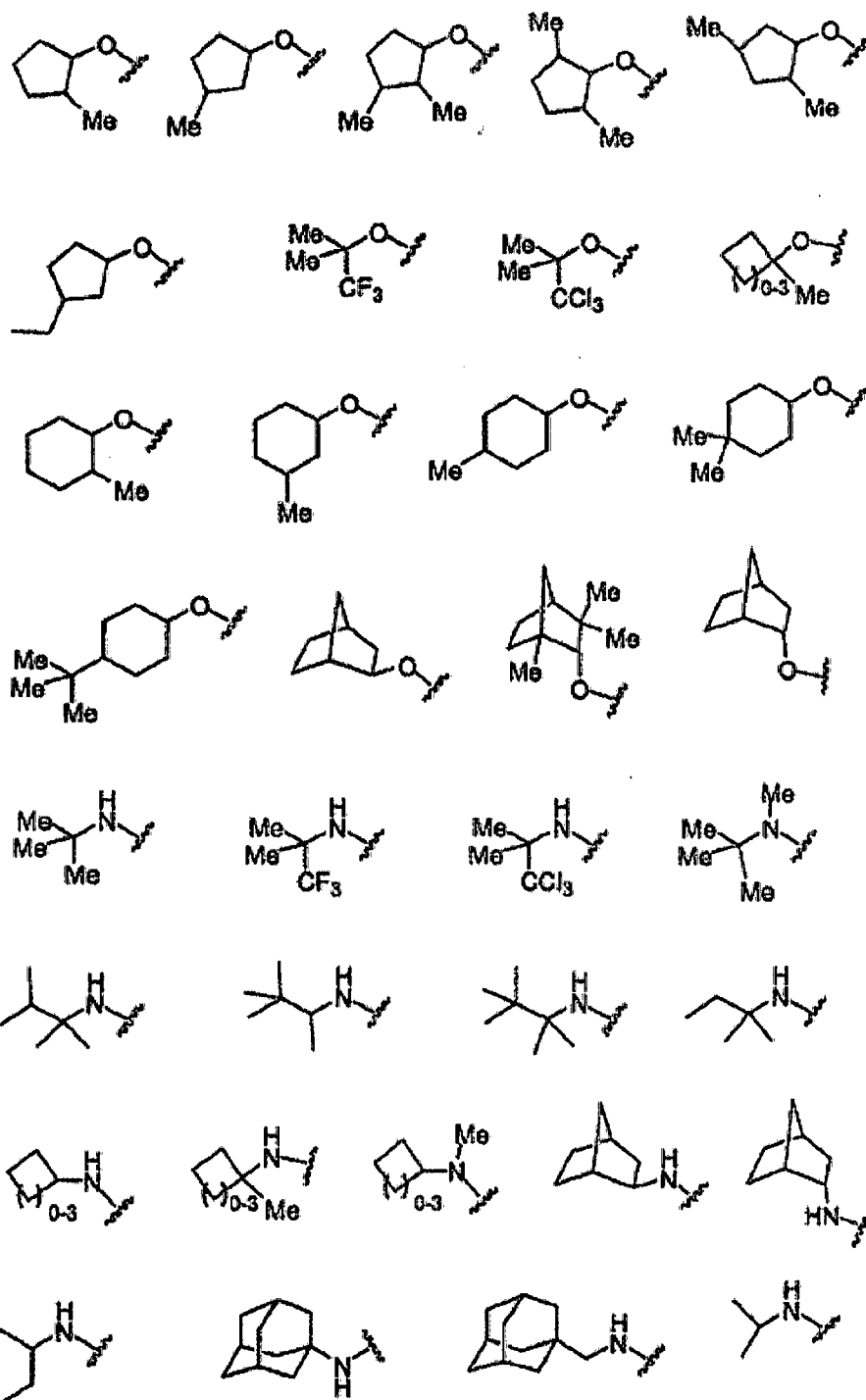
8. El compuesto de la Reivindicación 7, en el cual Z es N y R^4 es H.
9. El compuesto de la Reivindicación 8, en el cual W es C=O.

10. El compuesto de la Reivindicación 9, en el cual Y se selecciona de las siguientes fracciones:







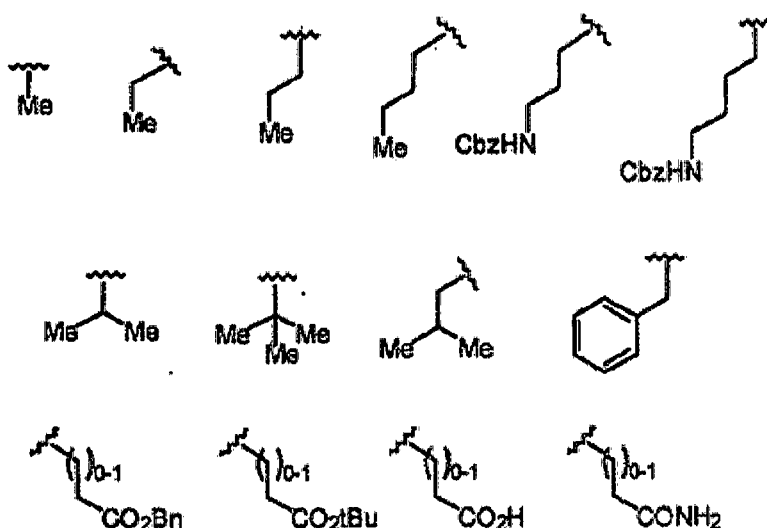


donde

Y^{11} se selecciona de H, COOH, COOEt, OMe, Ph, OPh, NHMe, MHAc, NHPh, CH(Me)₂, 1-triazolilo, 1-imidazolilo, y NHCH₂COOH;

Y^{12} se selecciona de H, COOH, COOMe, OMe, F, Cl, o Br;

Y^{13} se selecciona de las siguientes fracciones:



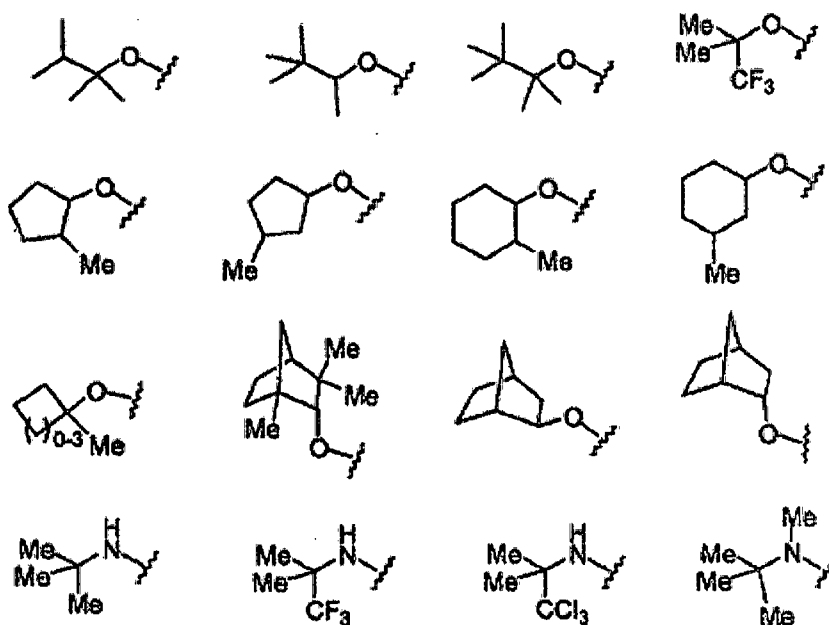
Y¹⁴ se selecciona de MeSO₂, Ac, Coc, iBoc, Cbz o Alloc;

Y¹⁵ e Y¹⁶ se seleccionan de forma independiente de alquilo, arilo, heteroalquilo, y heteroarilo;

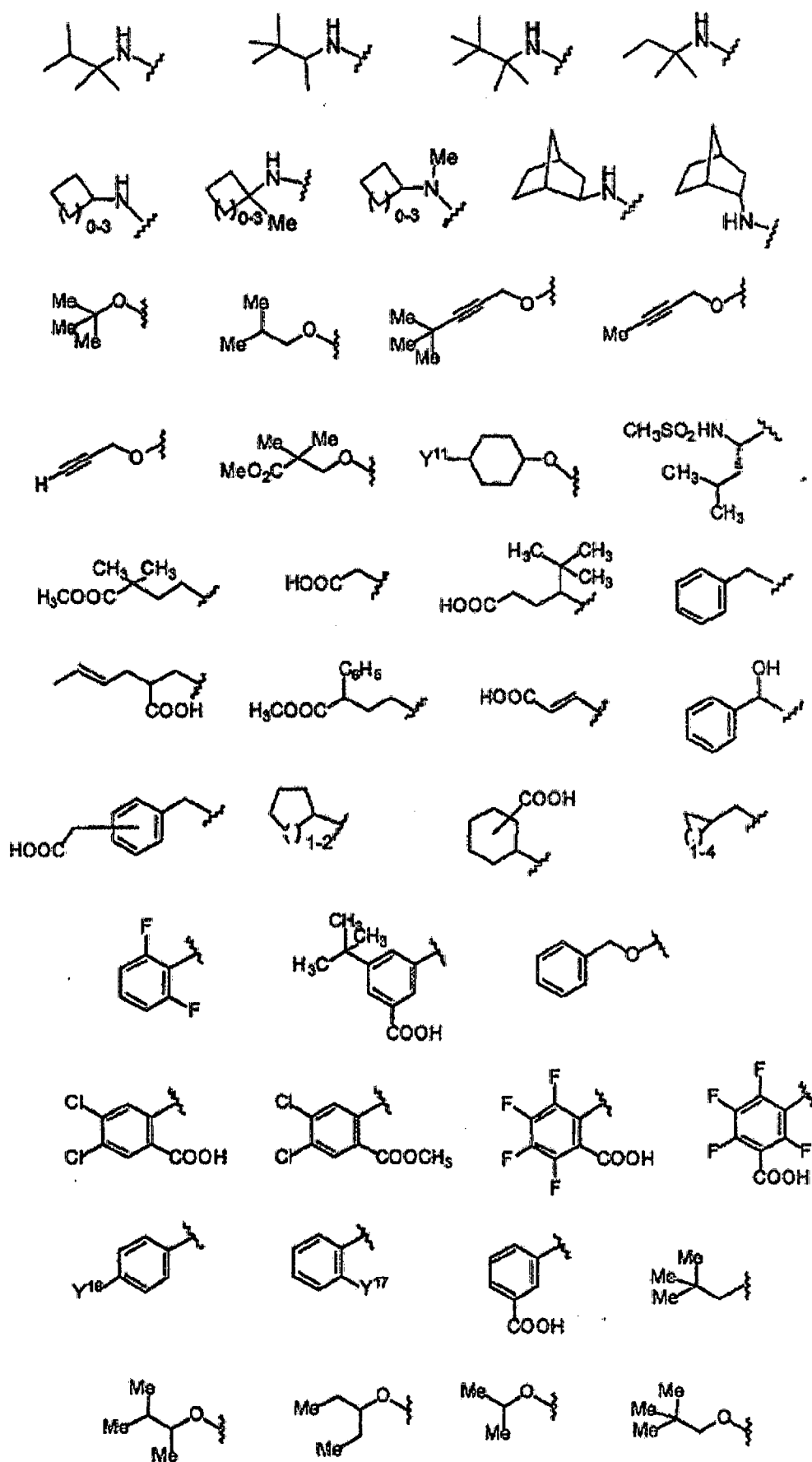
Y¹⁷ es CF₃, NO₂, CONH₂, OH, COOCH₃, OCH₃, OC₆H₅, C₆H₅, COC₆H₅, NH₂,
o COOH, y

Y¹⁸ es COOCH₃, NO₂, N(CH₃)₂, F, OCH₃, CH₂COOH, COOH, SO₂NH₂, o NHCOCH₃.

11. El compuesto de la Reivindicación 10, en el cual Y se selecciona del grupo que consiste de:



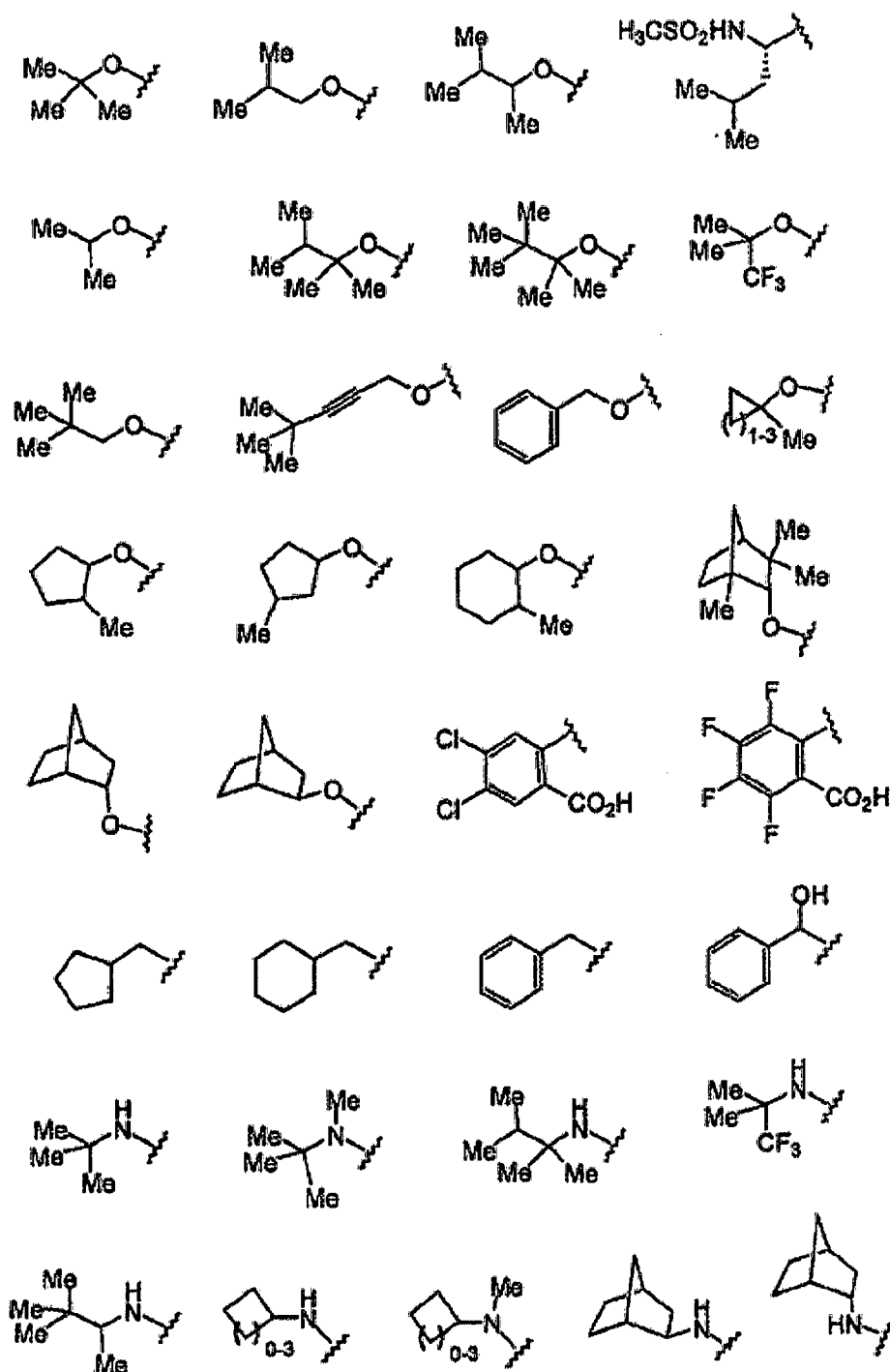
[Handwritten signature]



donde

$Y^{17} = CF_3, NO_2, CONH_2, OH, NH_2, \text{ o } COOH;$
 $Y^{18} = F, COOH.$

12. El compuesto de la Reivindicación 11, en el cual Y se selecciona de las siguientes fracciones:

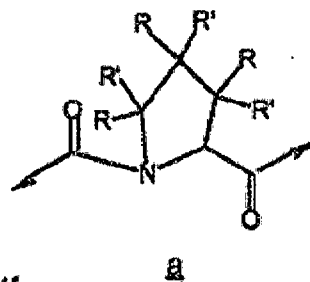
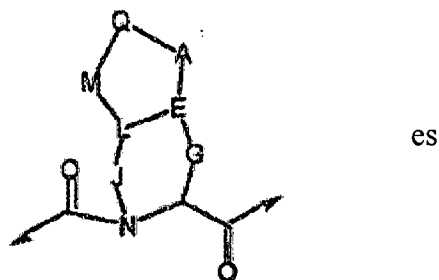


13. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual L y M están ausentes, y J está enlazado directamente a E.

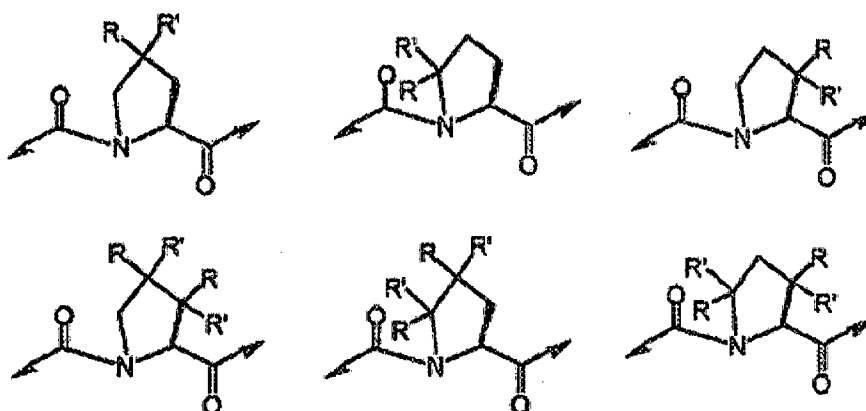
14. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual L, J y M están ausentes, y E está enlazado directamente a N.

15. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual G y M están ausentes.

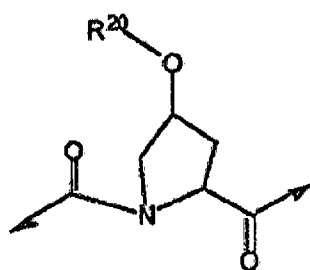
16. El compuesto de la Reivindicación 12 en el cual la fracción



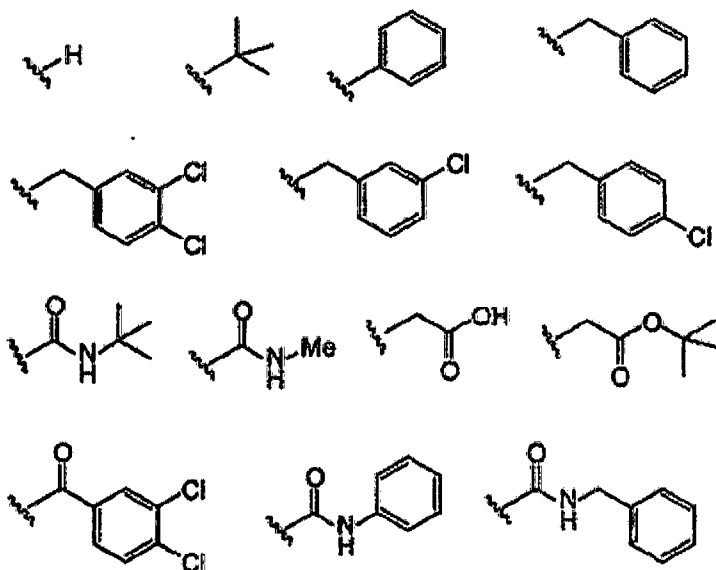
17. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a se selecciona de las siguientes estructuras:



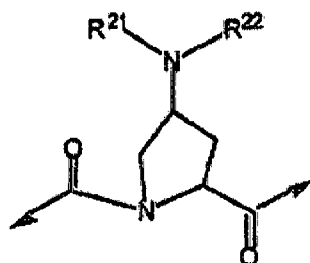
18. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a es:



en el cual R^{20} se selecciona de las siguientes estructuras:

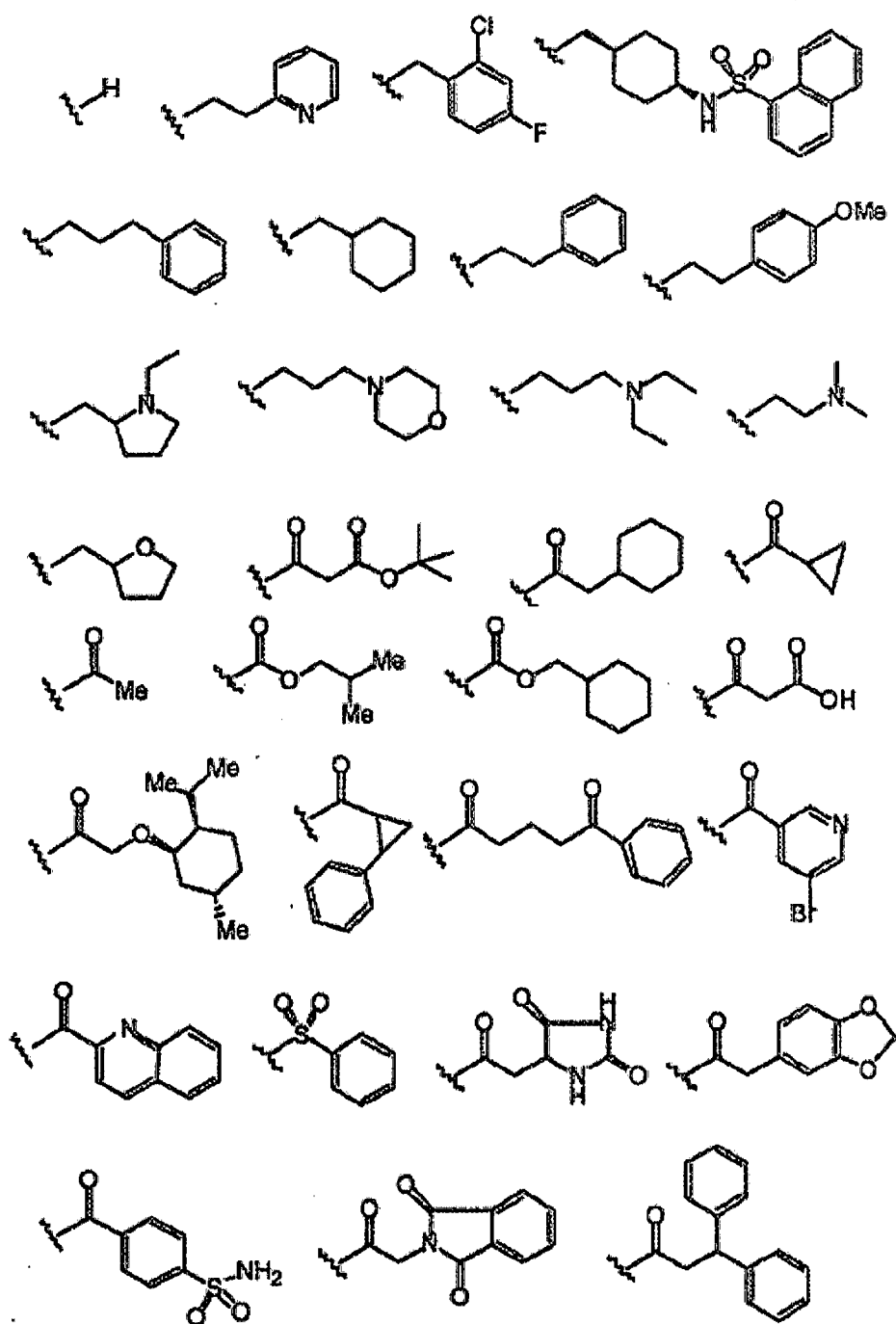


19. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a es:



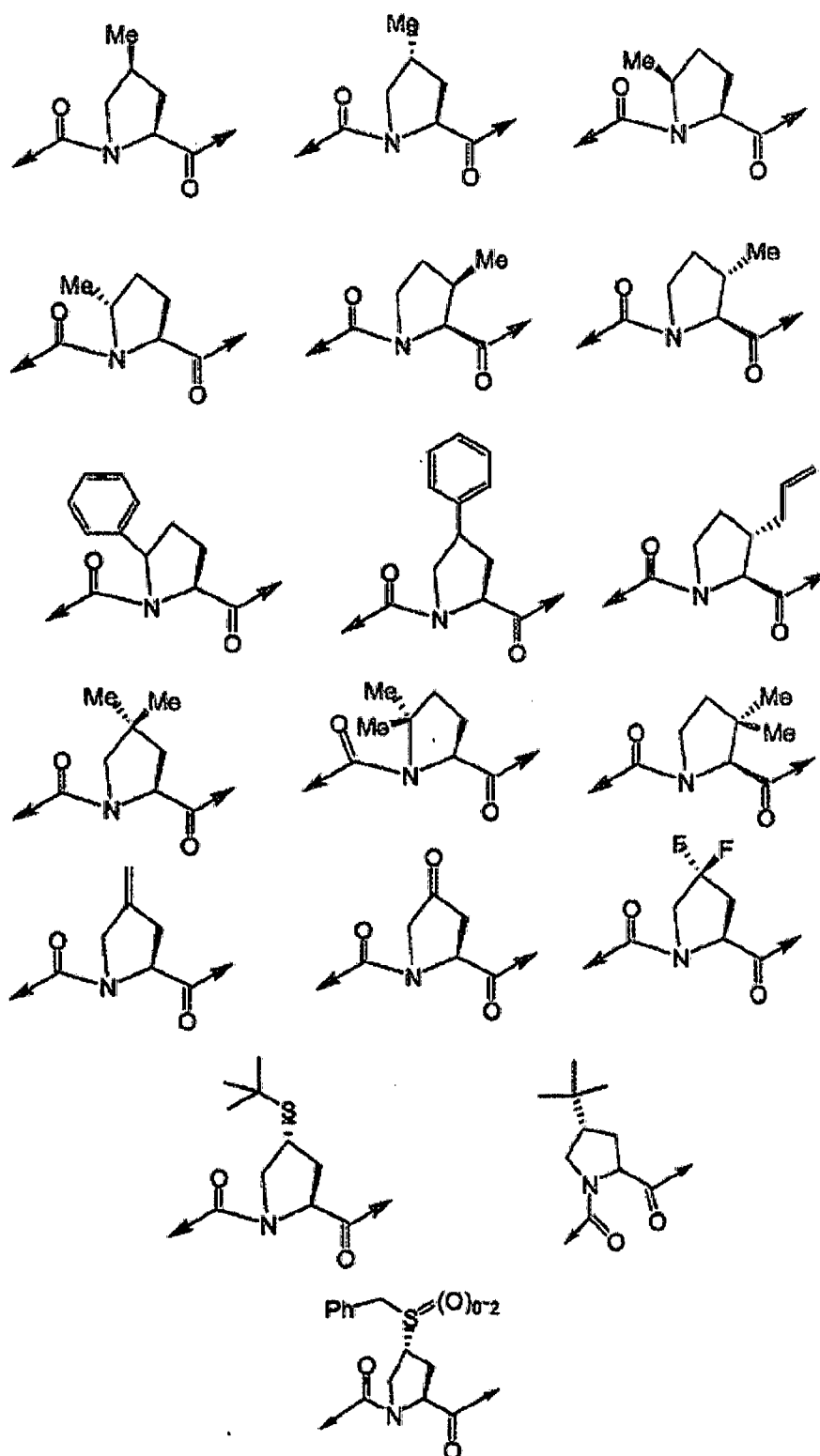
donde R^{21} y R^{22} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan en forma independiente de las siguientes estructuras:

2375

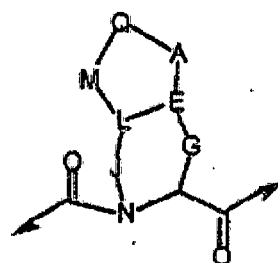


20. El compuesto de la Reivindicación 16, en el cual la estructura a se selecciona de las siguientes estructuras:

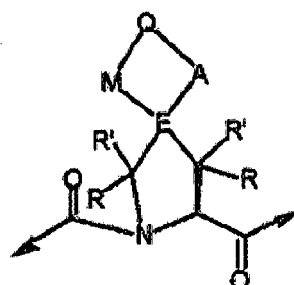
81



21. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:

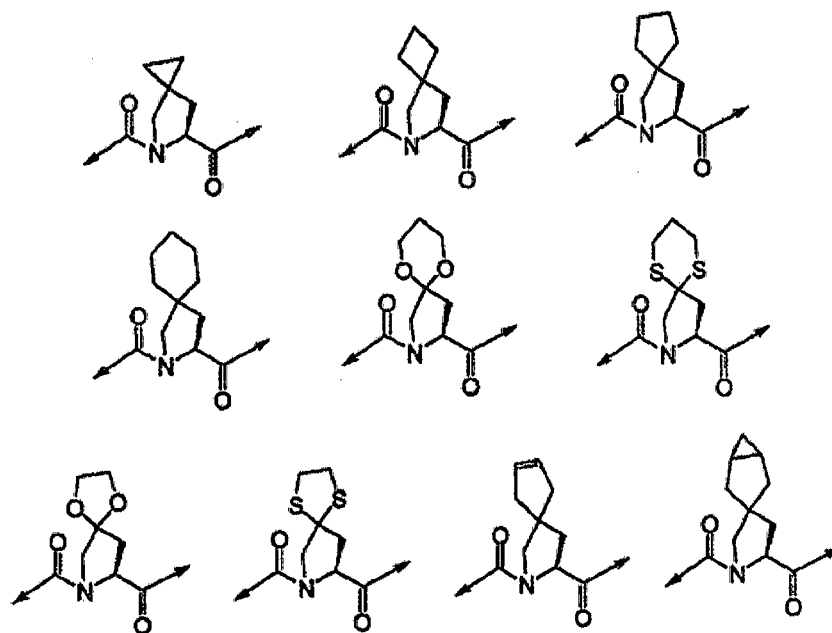


es

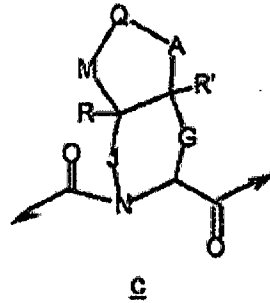
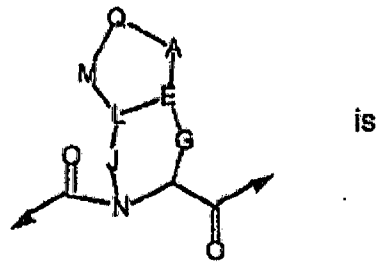
b

en el cual Q puede estar presente o ausente, y su Q está ausente, M está enlazado directamente a A.

22. El compuesto de la Reivindicación 21, en el cual la estructura b se selecciona de las siguientes estructuras:

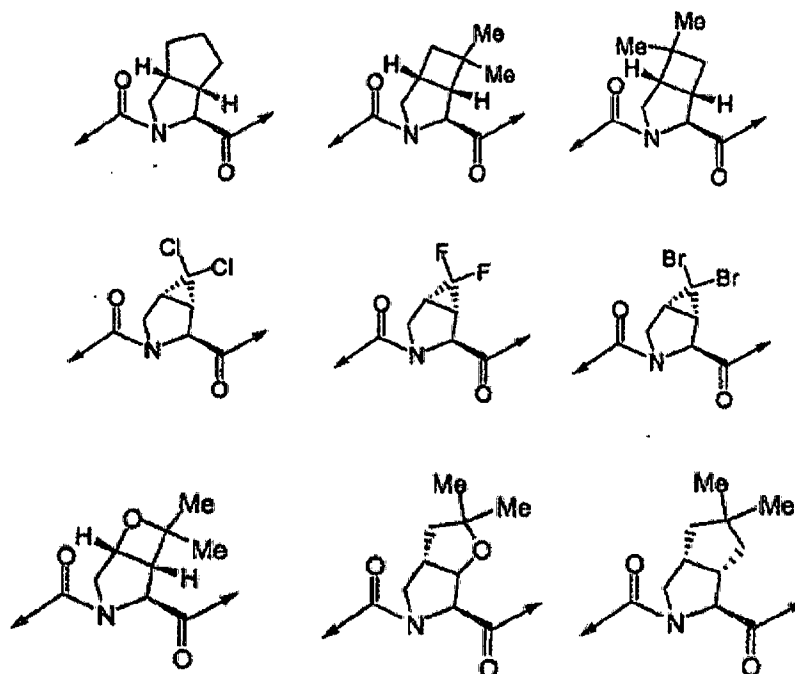


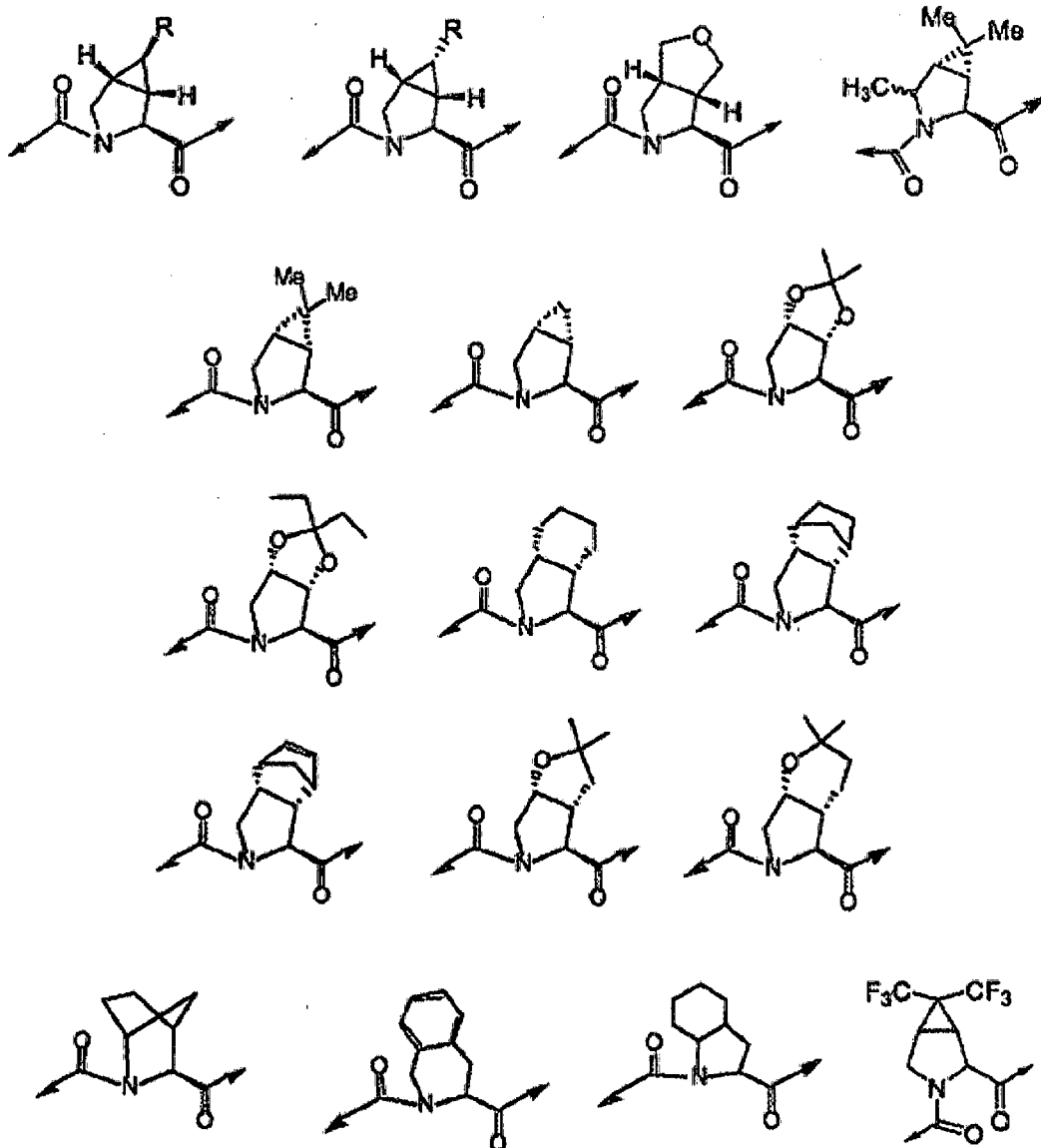
23. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:



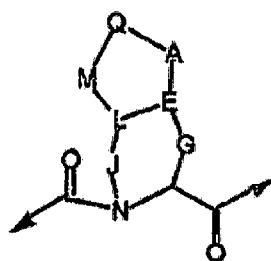
donde G y J se seleccionan en forma independiente del grupo que consiste de $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, $(CHR-CHR)_p$ y $(CRR')_p$, A y M se seleccionan en forma independiente del grupo que consiste de O, S, SO_2 , NR, $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, $(CHR-CHR)_p$ y $(CRR')_p$ y Q es CH_2 , CHR, CRR', NH, NR, O, S, SO_2 , NR; $(CH_2)_p$, $(CHR)_p$, y $(CRR')_p$.

24. El compuesto de la Reivindicación 23, en el cual la estructura c se selecciona de las siguientes estructuras:

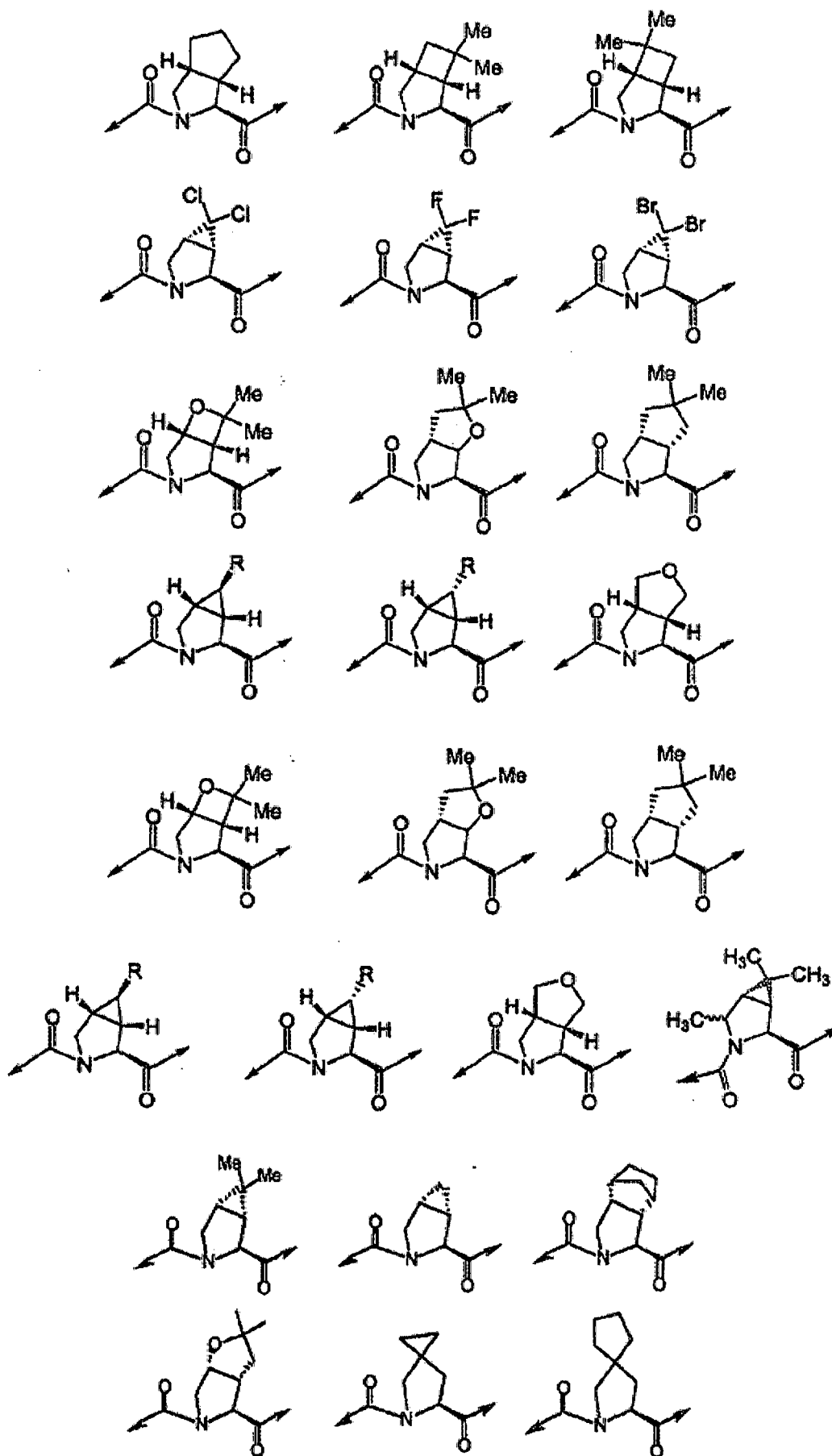


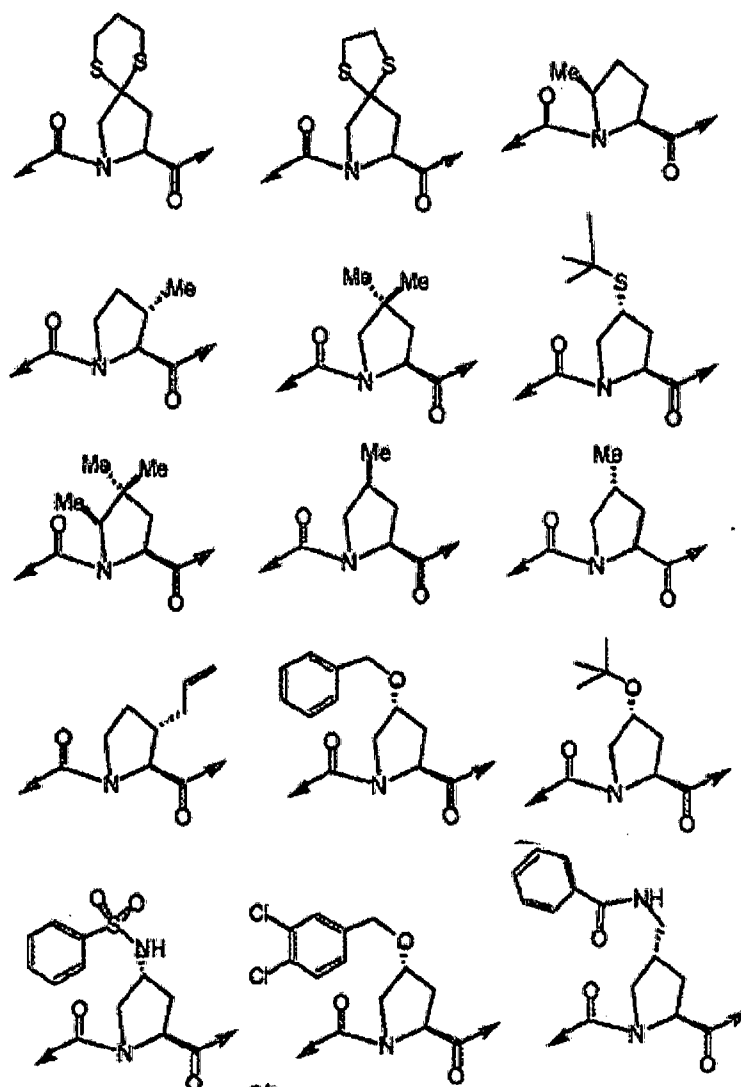


25. El compuesto de la Reivindicación 12, en el cual:

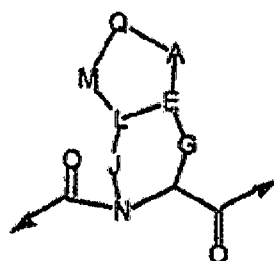


se seleccionan las siguientes estructuras:

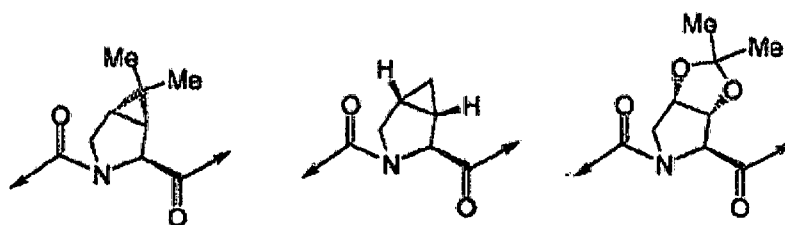


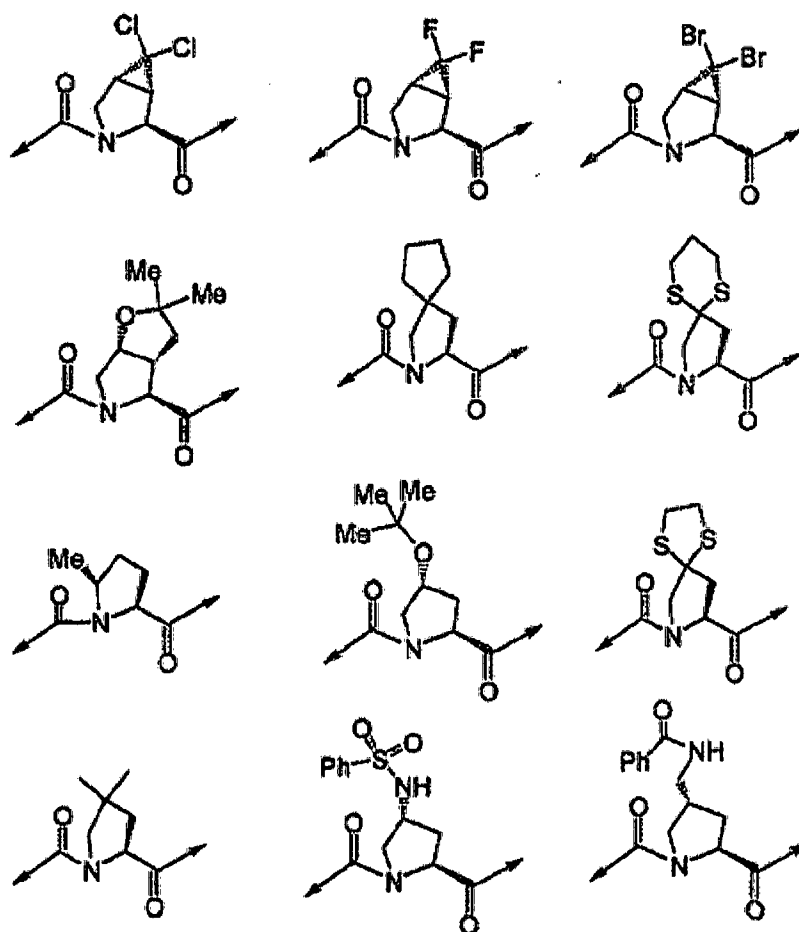


26. El compuesto de la Reivindicación 25, en el cual

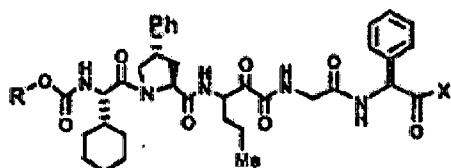


se selecciona de las siguientes estructuras:

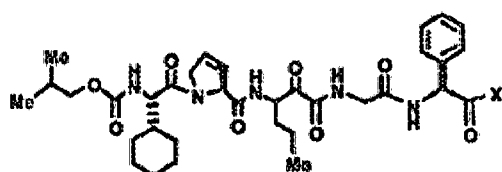
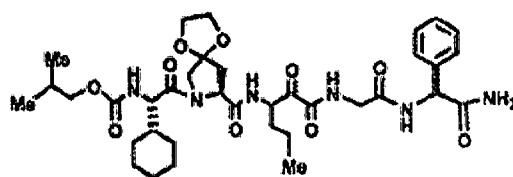




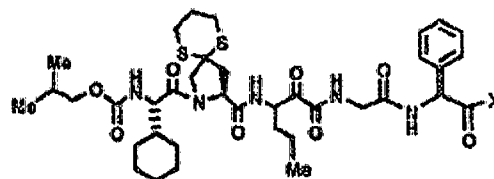
27. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1-26.
28. La composición farmacéutica de la Reivindicación 27, que contienen adicionalmente (a) un agente antiviral o (b) un interferón, o ambos (a) y (b).
29. La composición de la Reivindicación 28, en donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón o interferón pegilado.
30. Un compuesto que exhibe actividad de inhibición de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros, rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y las sales farmacéuticamente aceptables o solvatos de dicho compuesto, dicho compuesto se selecciona de los compuestos o estructuras que aparecen a continuación:



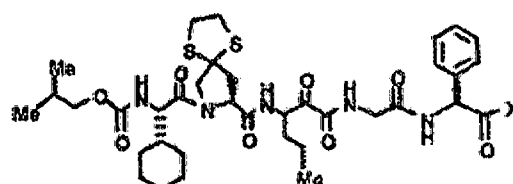
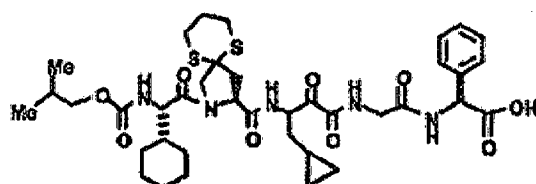
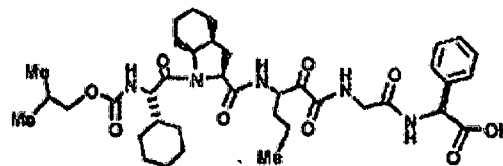
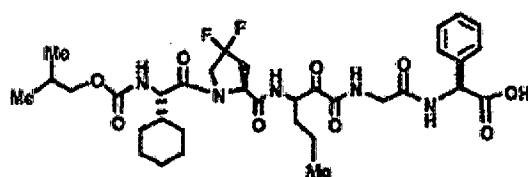
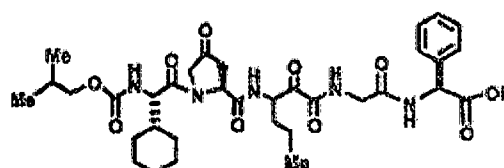
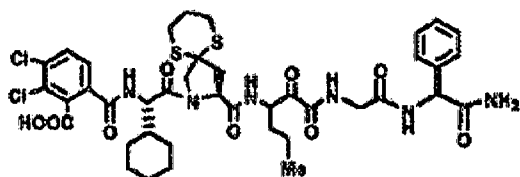
(R = t-butil, X=NH₂)
(R = isobutil, X=NH₂)
(R = t-butil, X=OH)
(R=triclouroetil, X=OH)



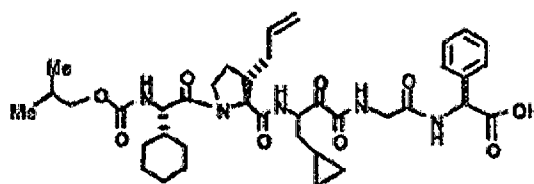
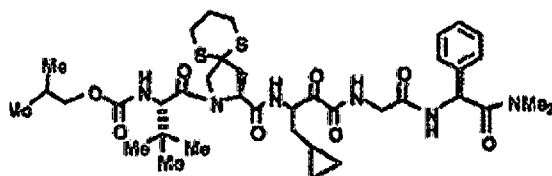
(X = O^tBu)
(X = OH)

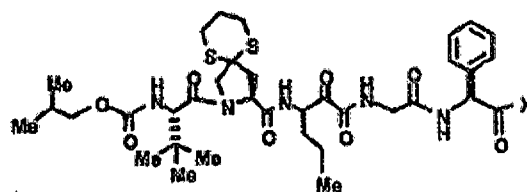
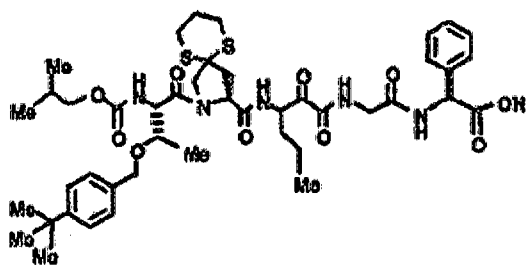


(X = OH)
(X = O^tBu)
(X = NH₂)
(X = NHMe)
(X = NMe₂)

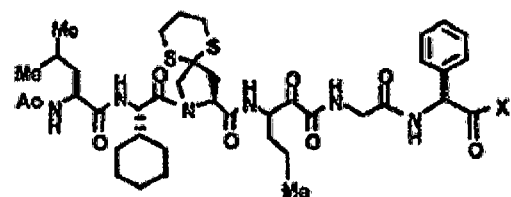


(X = NH₂)
(X = NMe₂)
(X = NHMe)
(X = OH)

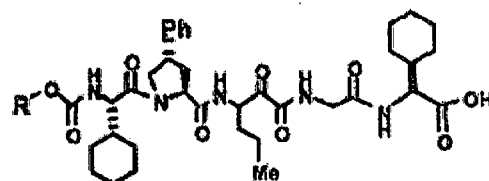




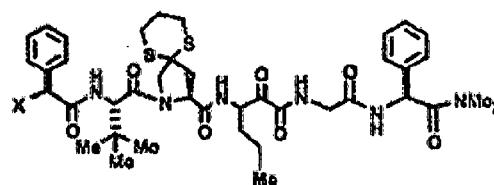
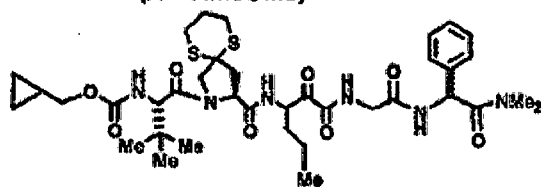
(X = O^tBu)
(X = OH)
(X = NH₂)
(X = NMe₂)



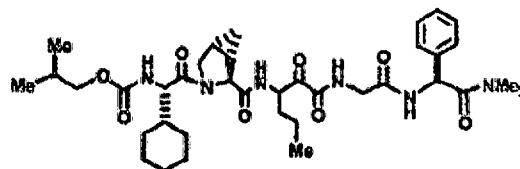
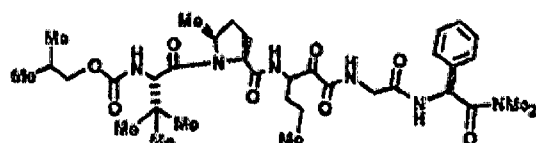
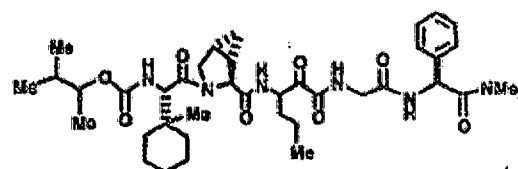
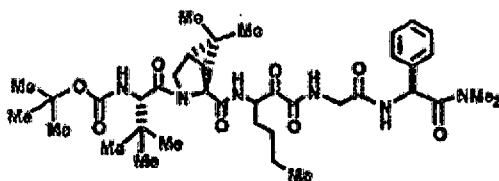
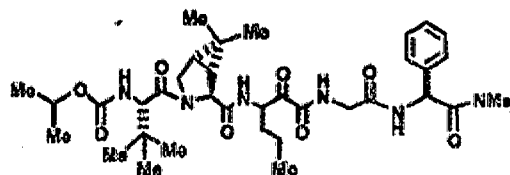
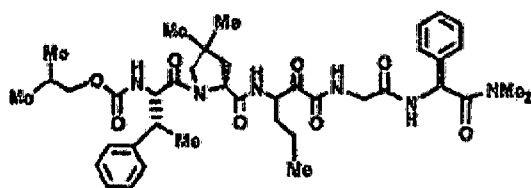
(X = O^tBu)
(X = OH)
(X = NH₂)
(X = NMe₂)
(X = NMeOMe)



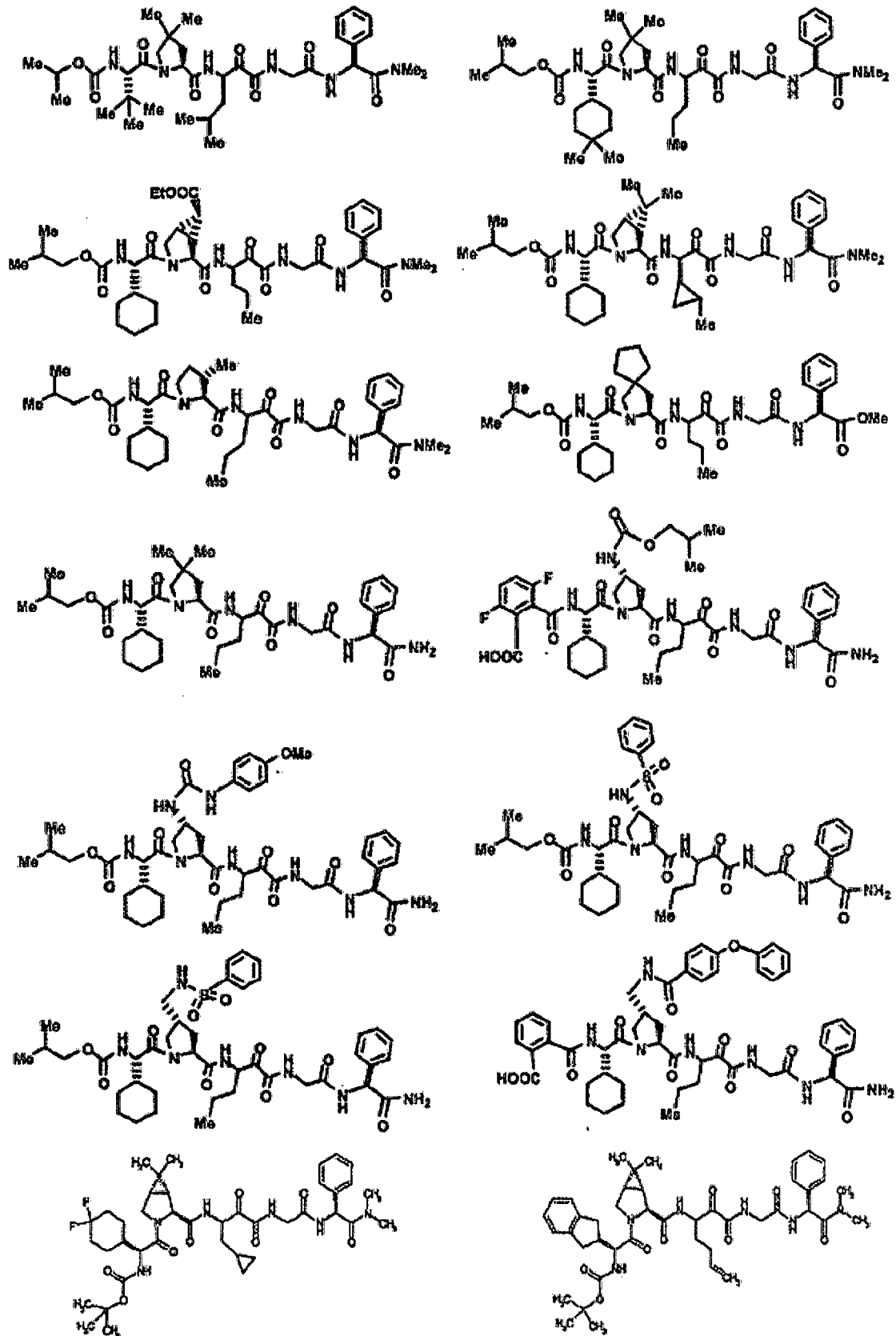
(R = t-butyl)
(R = isobutyl)



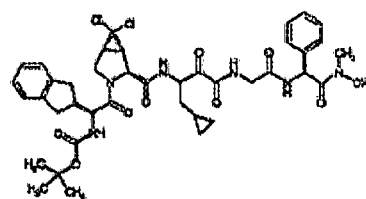
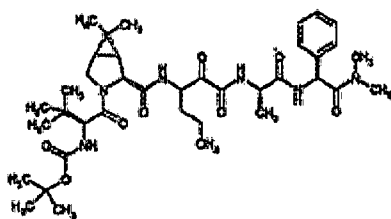
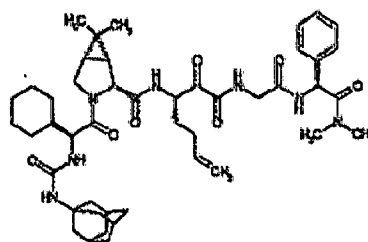
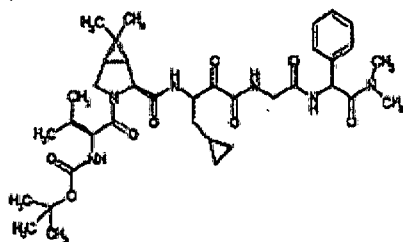
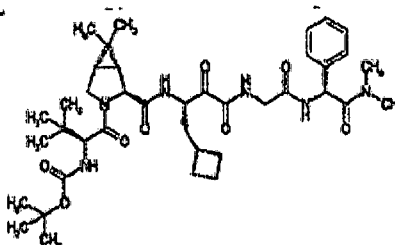
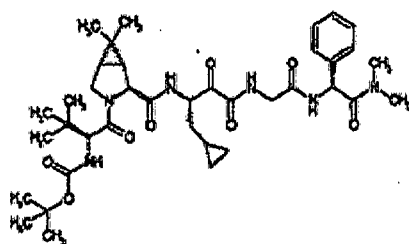
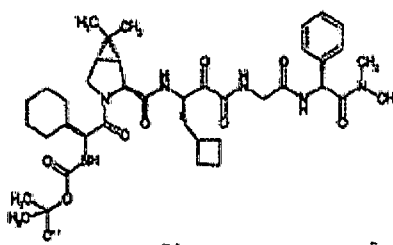
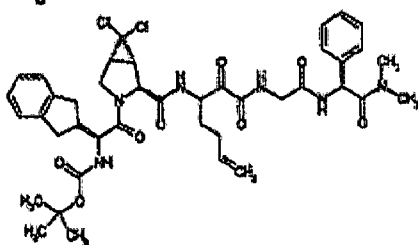
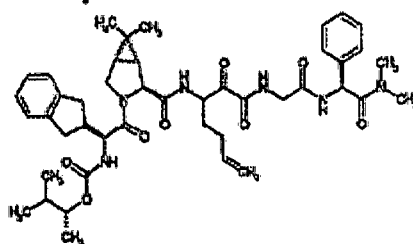
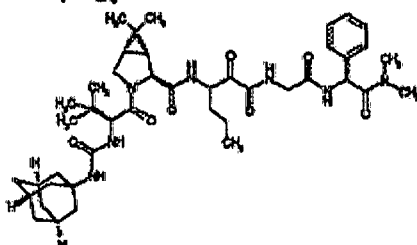
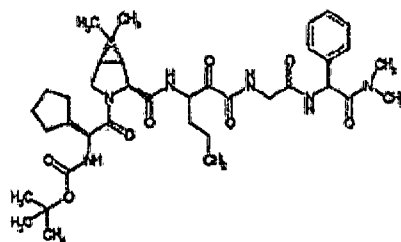
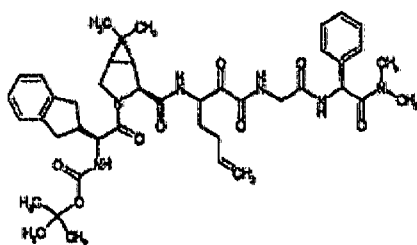
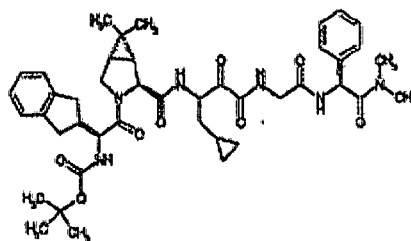
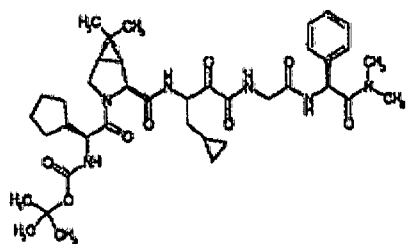
(X = Me, Y = CH₂Me)
(X = OAc, Y = Me)



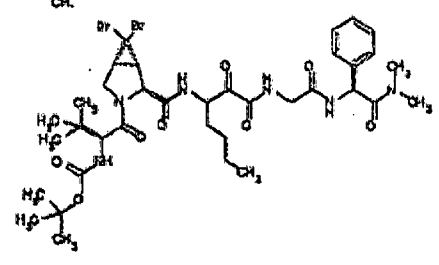
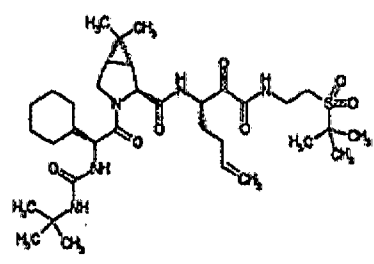
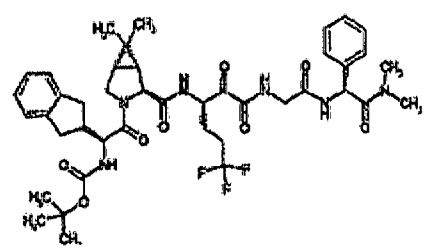
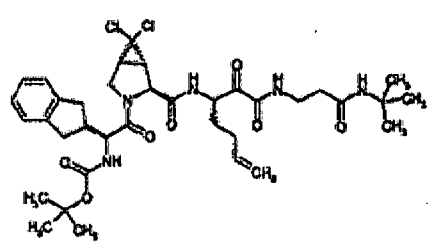
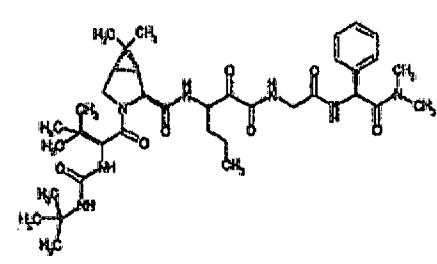
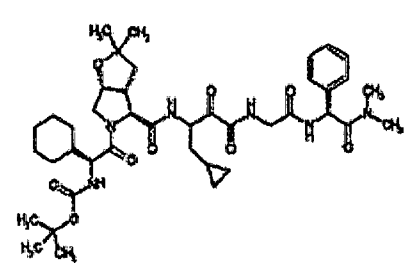
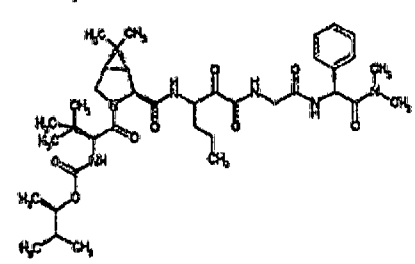
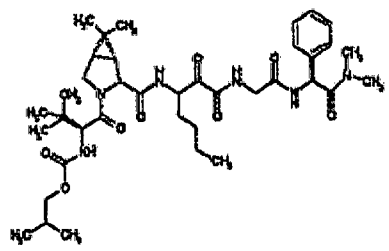
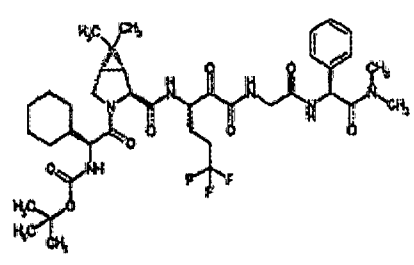
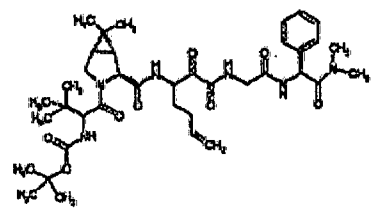
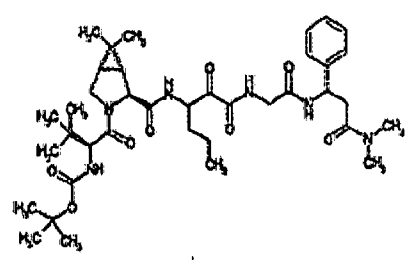
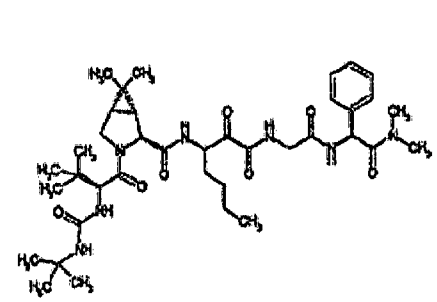
2385

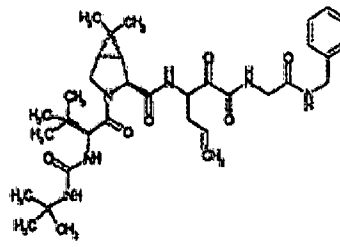
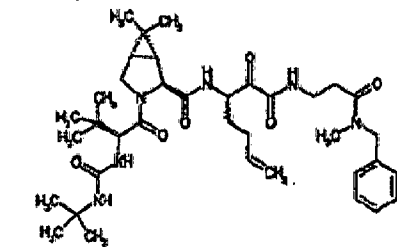
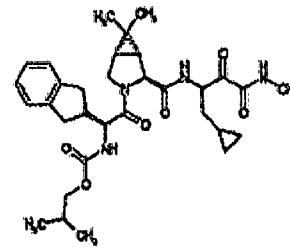
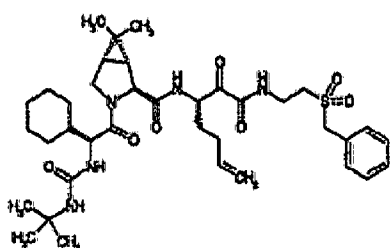
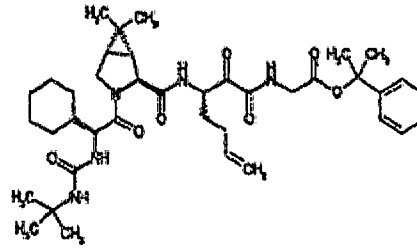
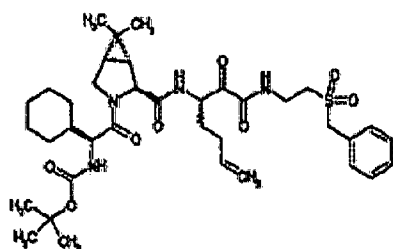
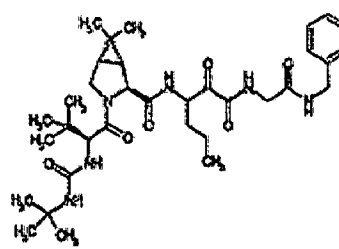
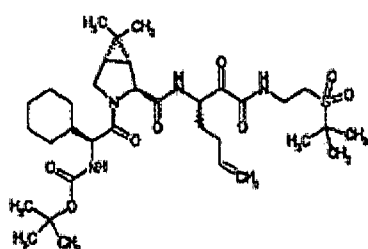
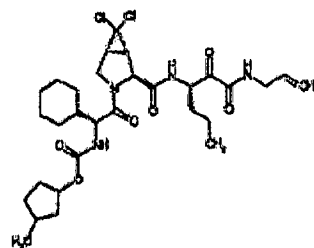
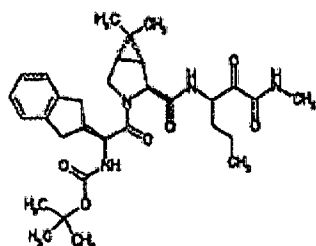
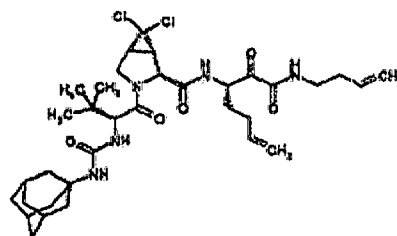
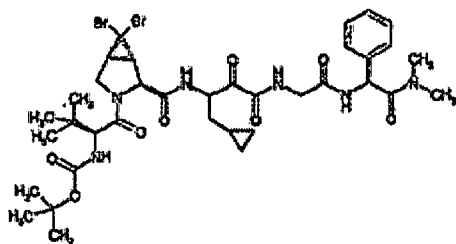
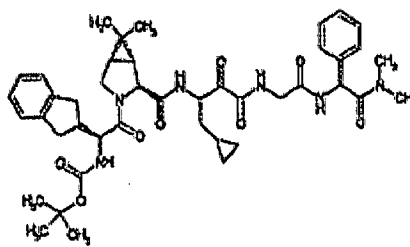
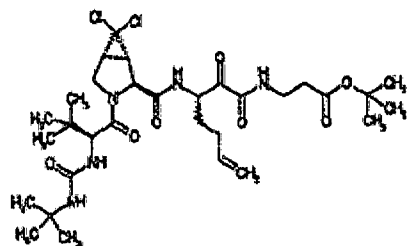
al

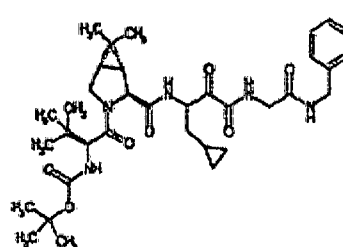
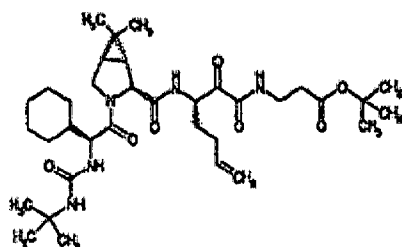
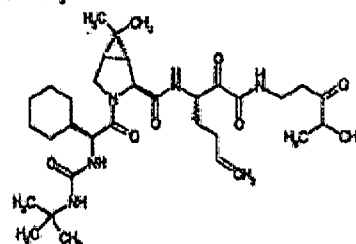
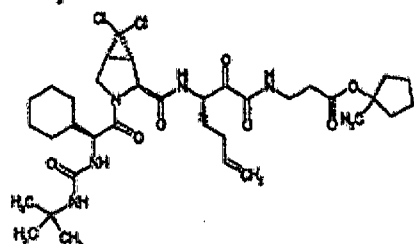
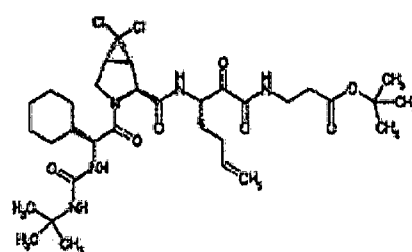
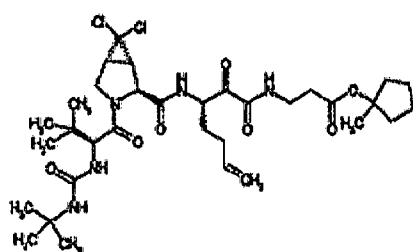
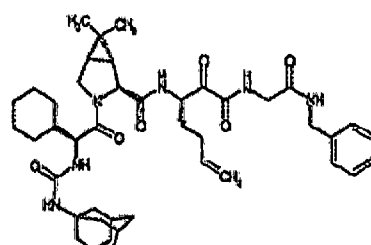
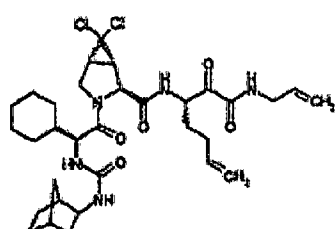
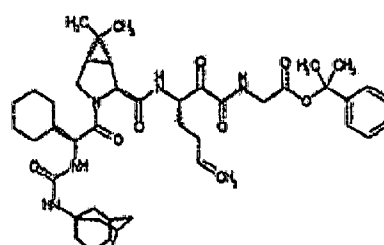
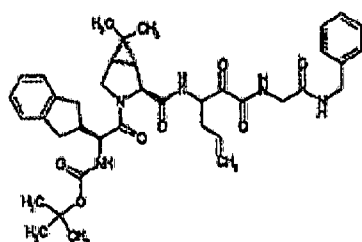
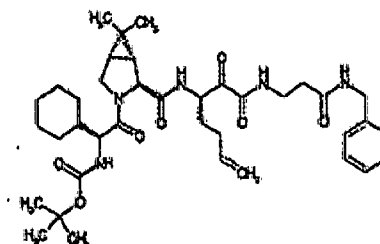
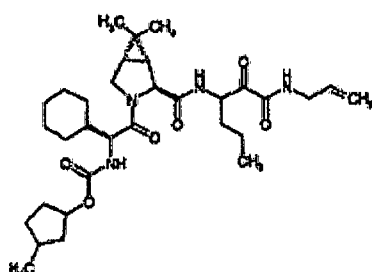
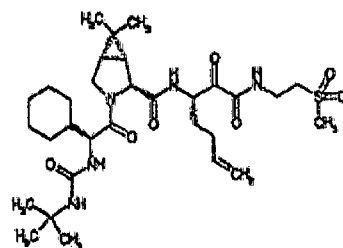
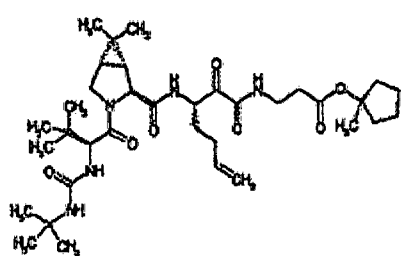


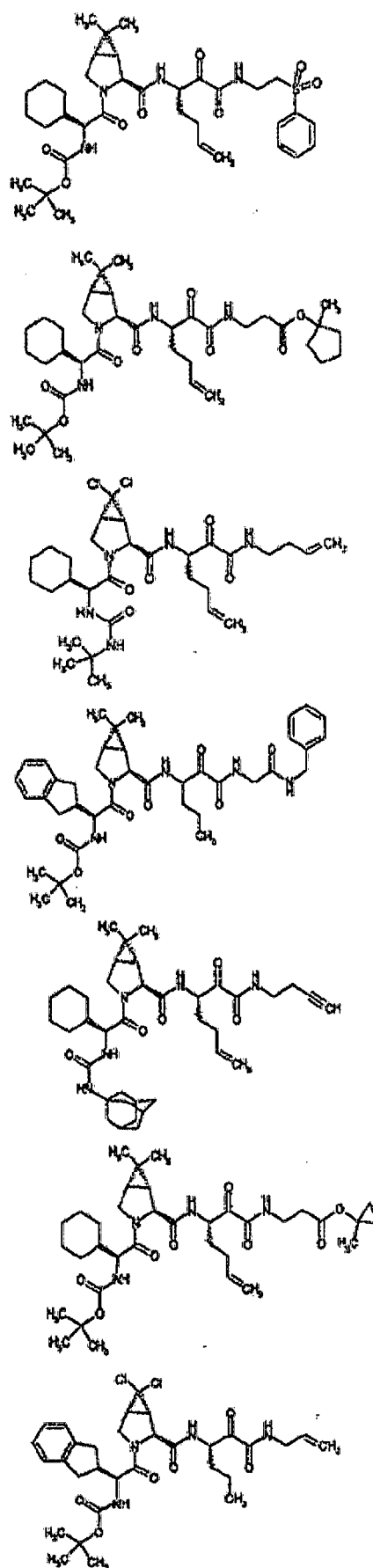
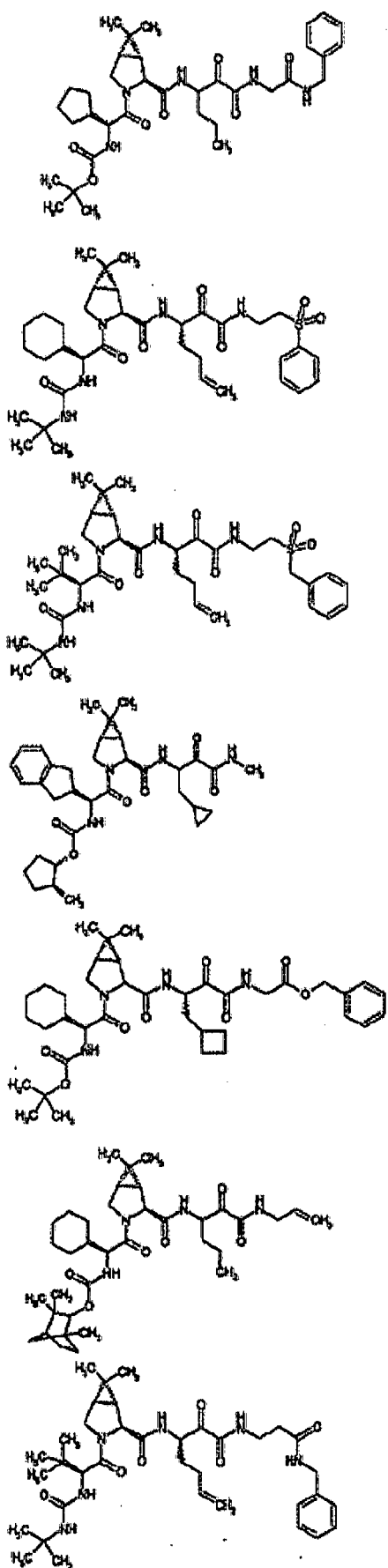
d2

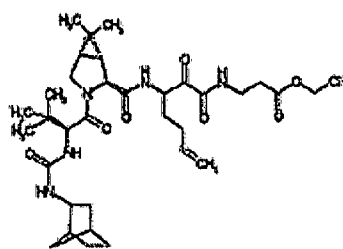
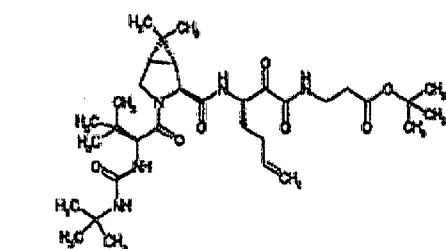
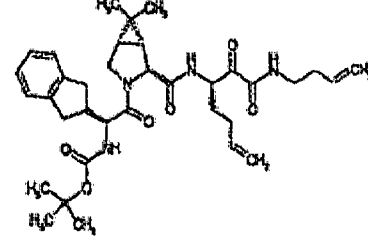
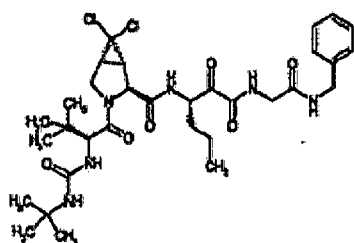
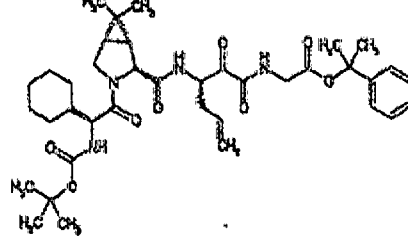
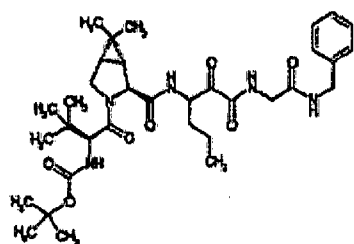
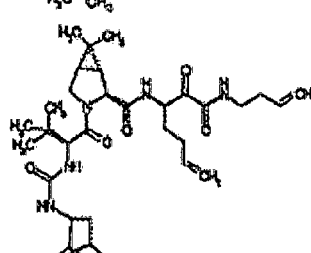
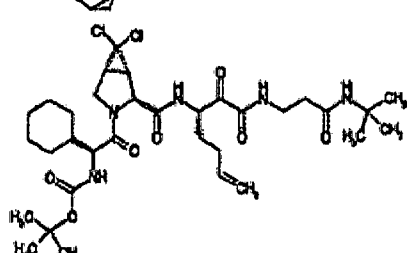
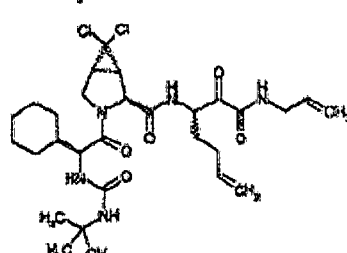
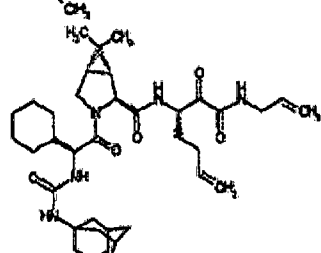
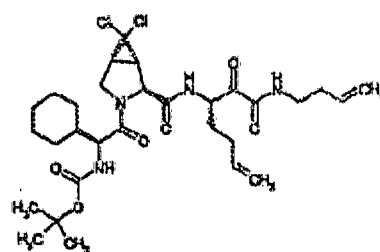
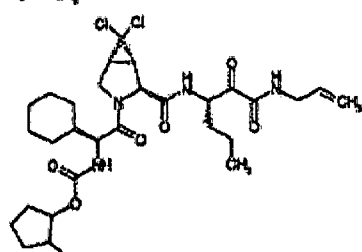
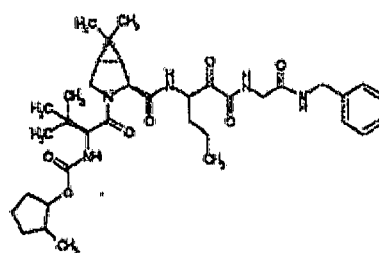
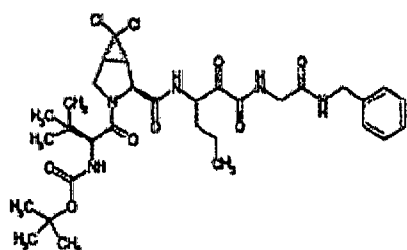


93

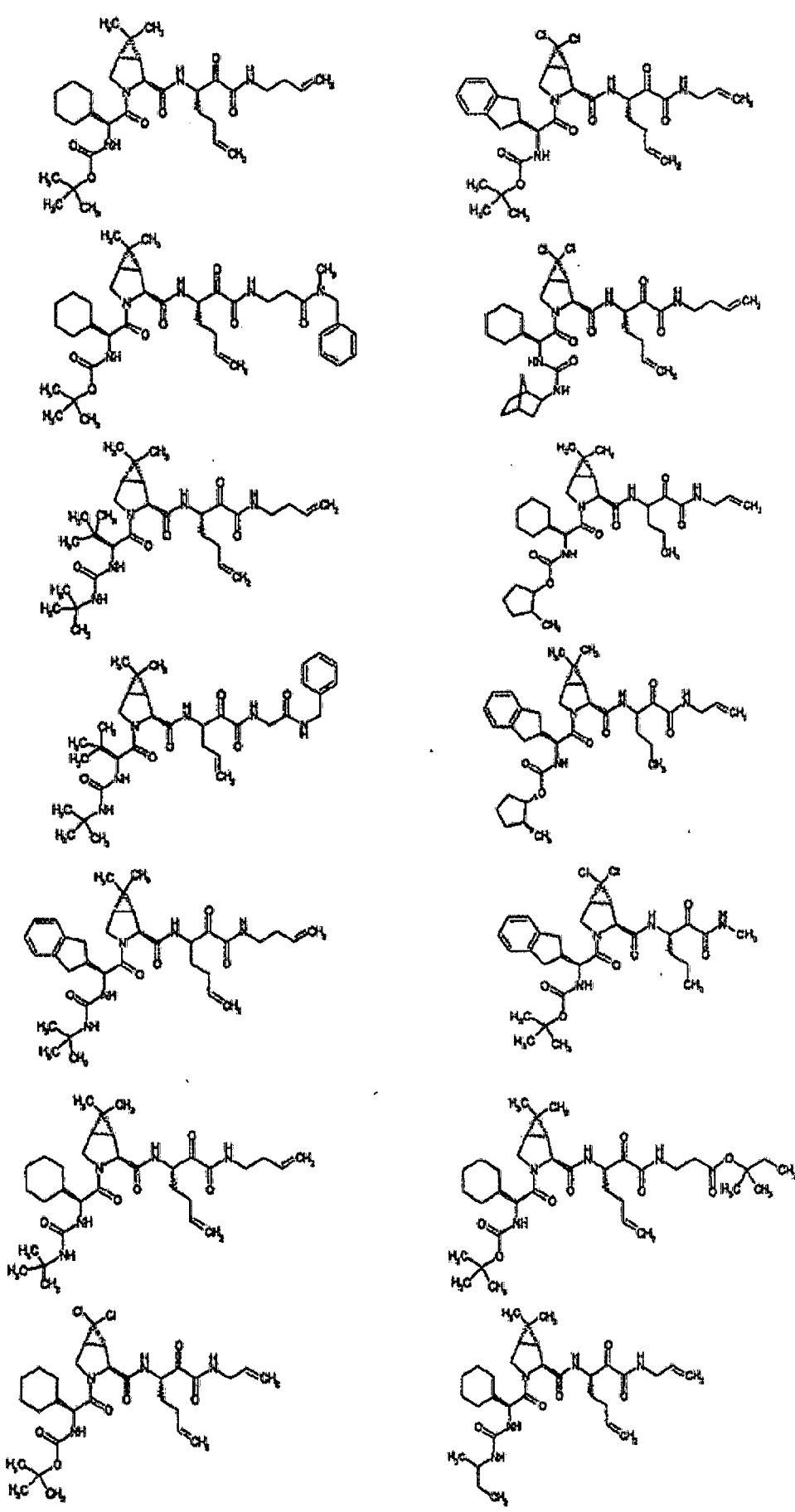




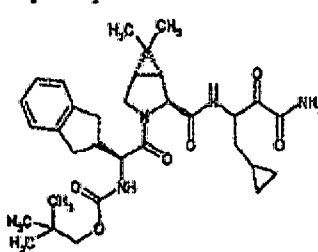
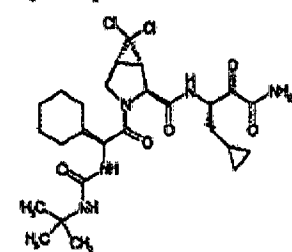
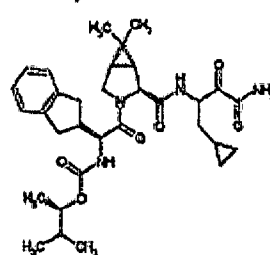
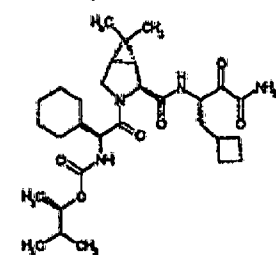
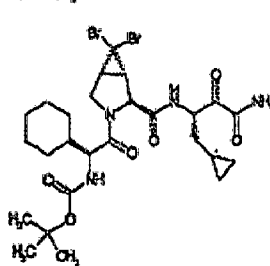
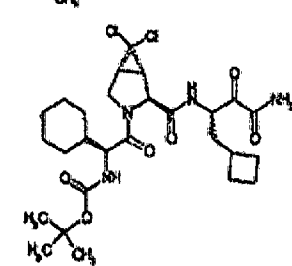
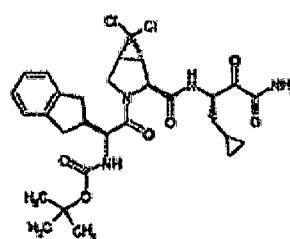
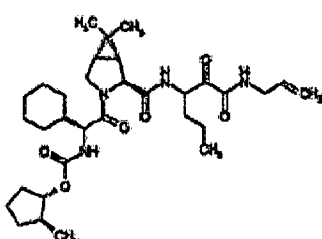
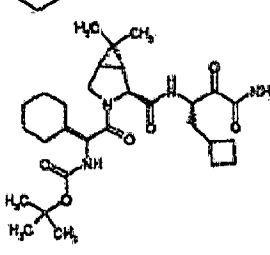
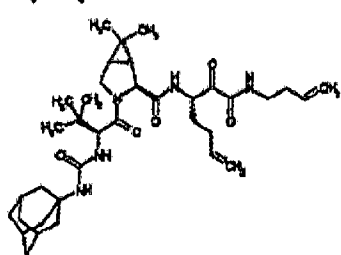
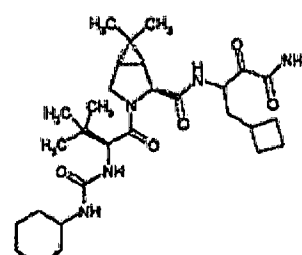
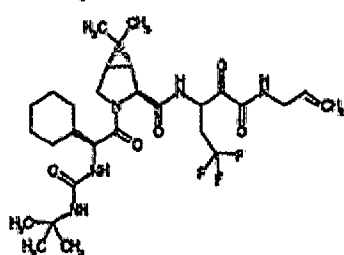
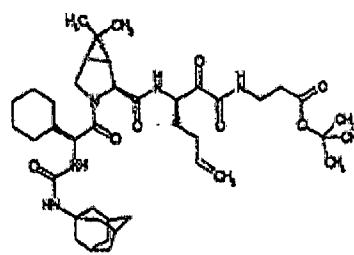
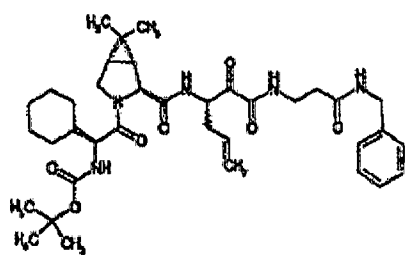




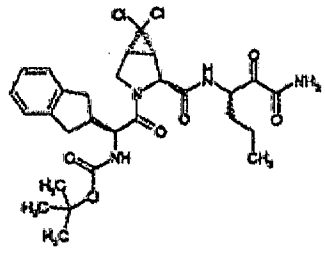
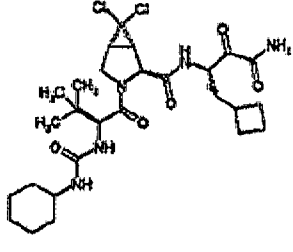
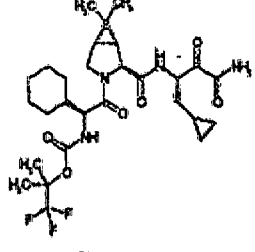
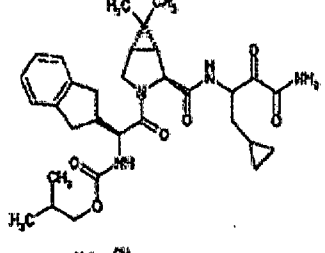
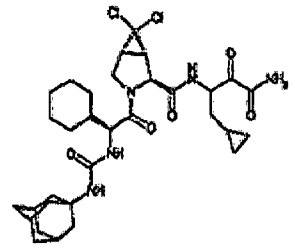
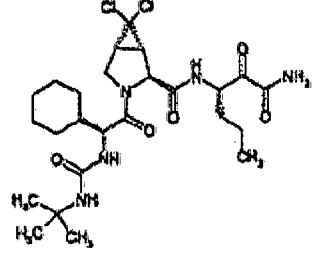
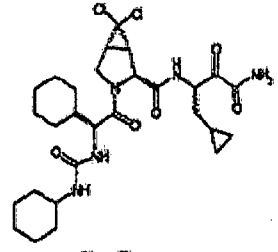
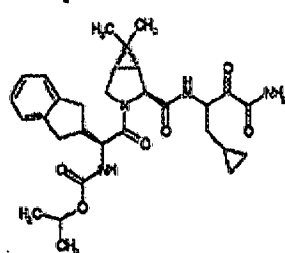
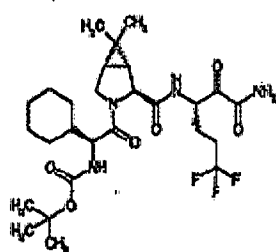
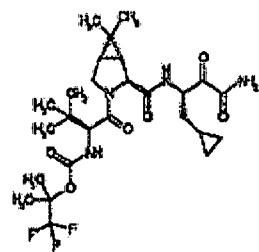
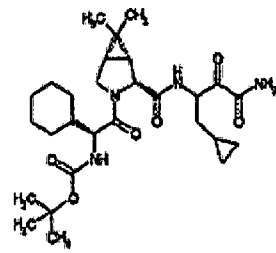
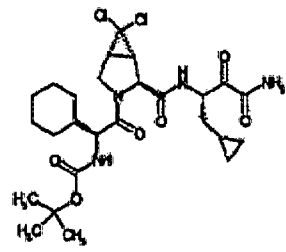
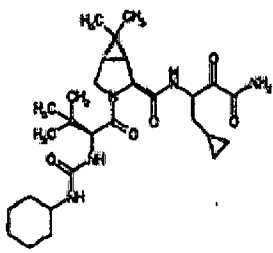
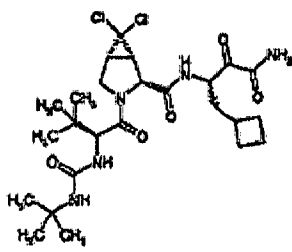
2392



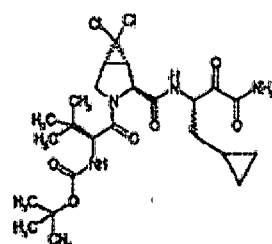
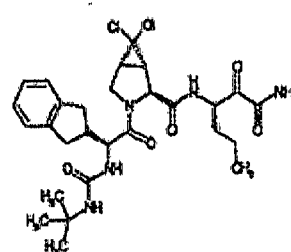
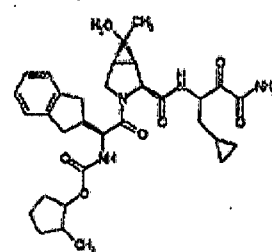
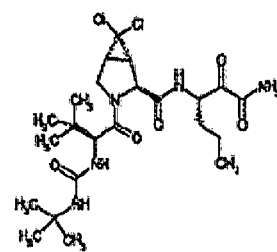
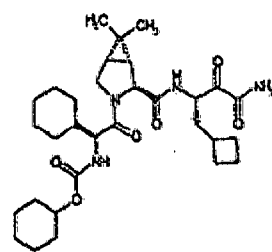
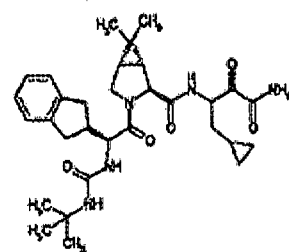
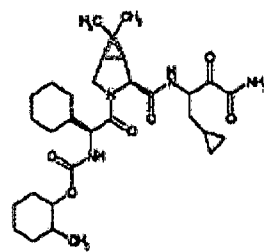
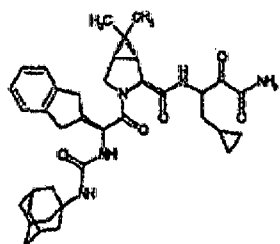
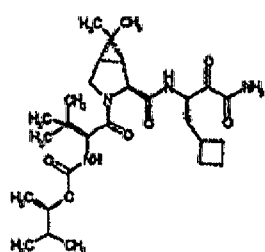
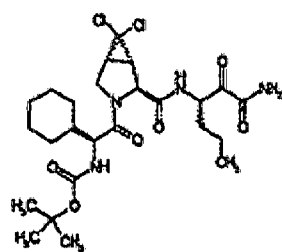
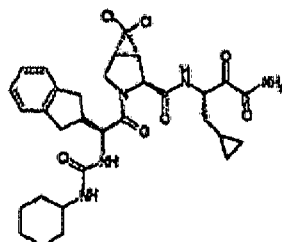
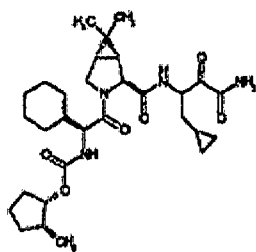
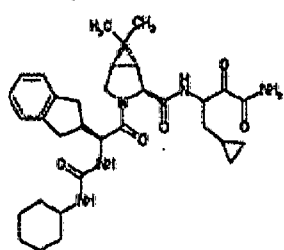
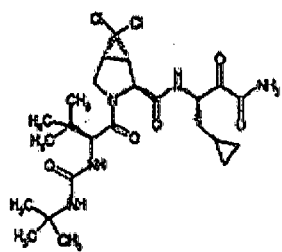
AB



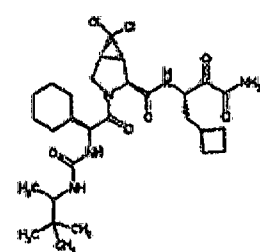
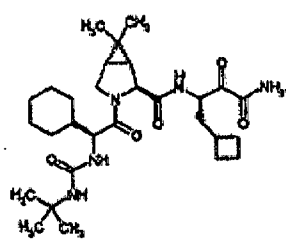
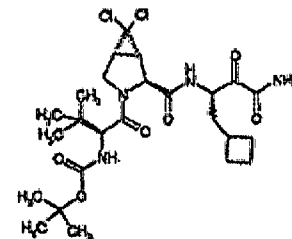
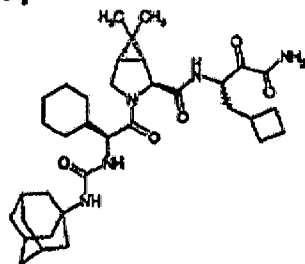
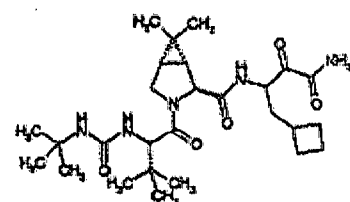
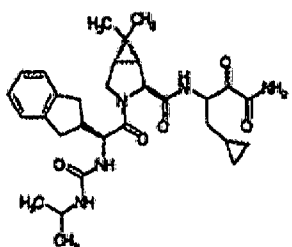
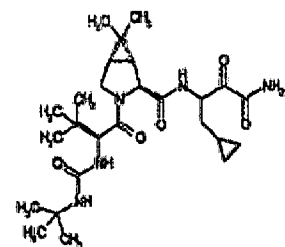
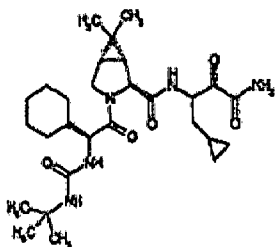
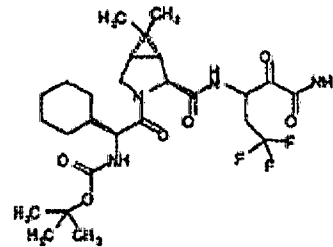
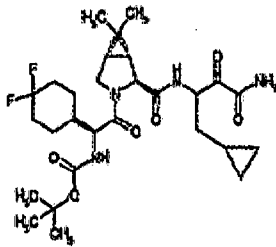
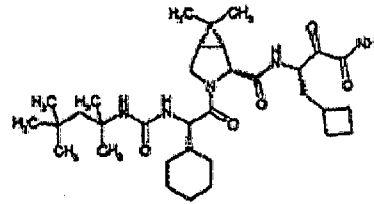
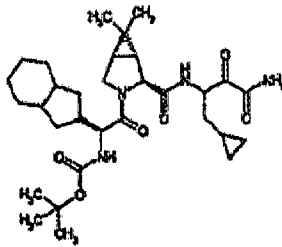
ad



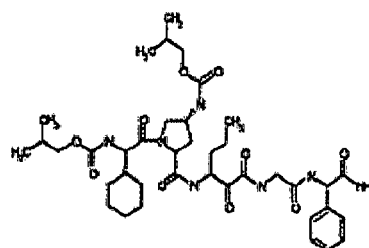
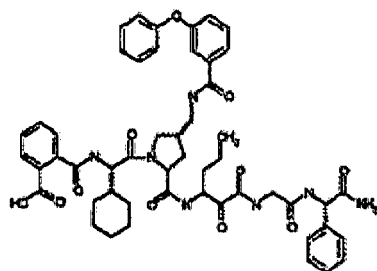
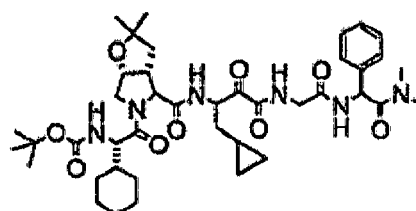
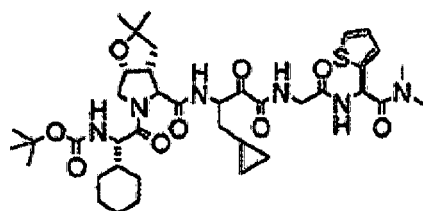
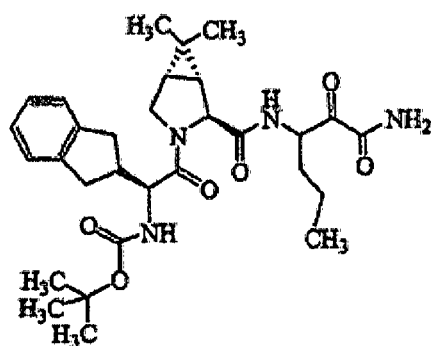
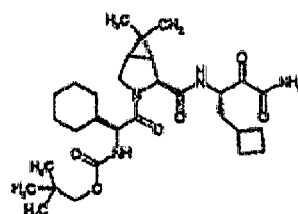
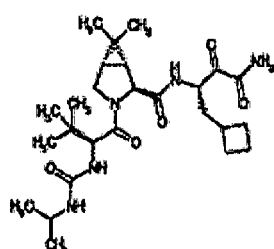
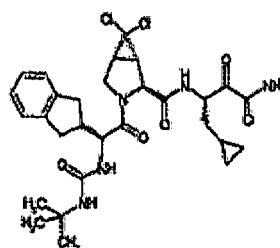
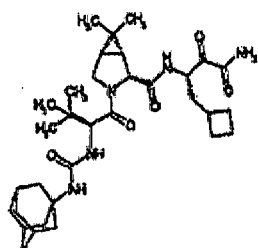
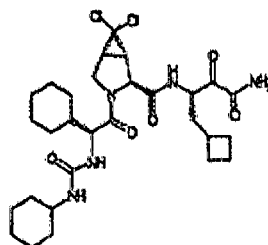
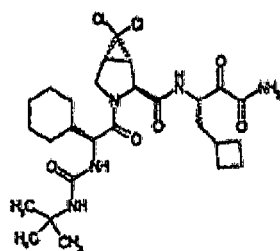
100



101

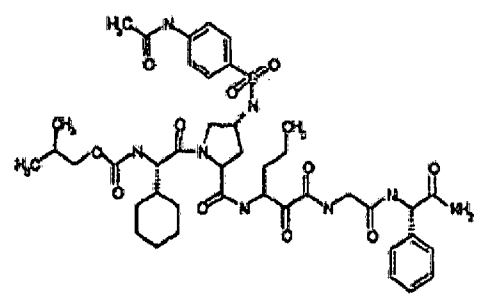
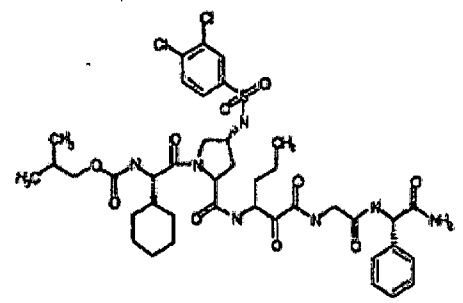
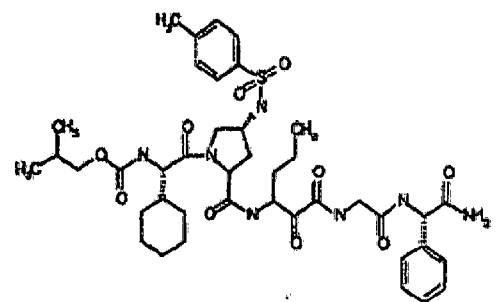
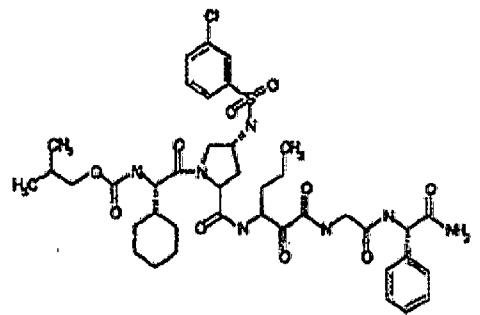
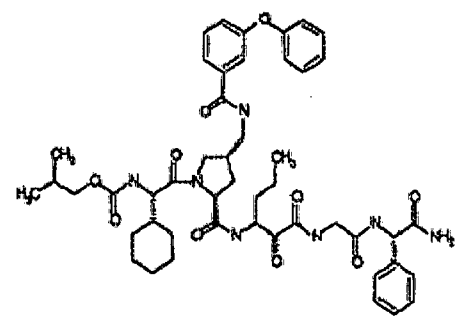
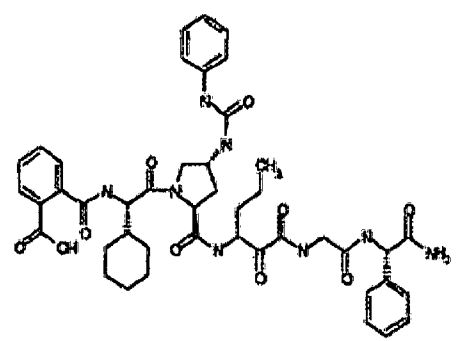
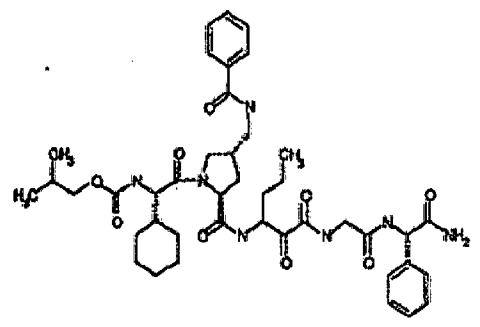
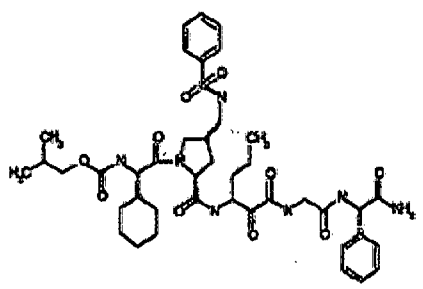
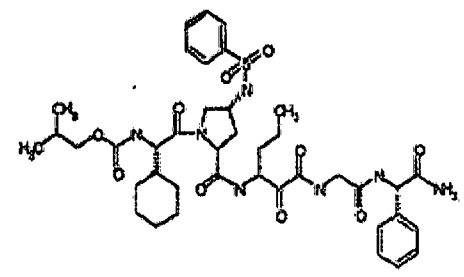
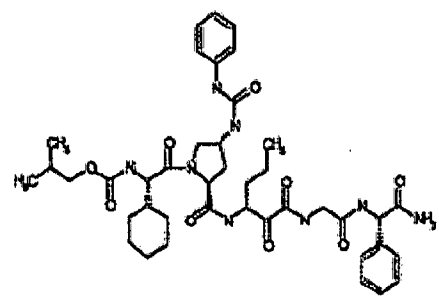


102

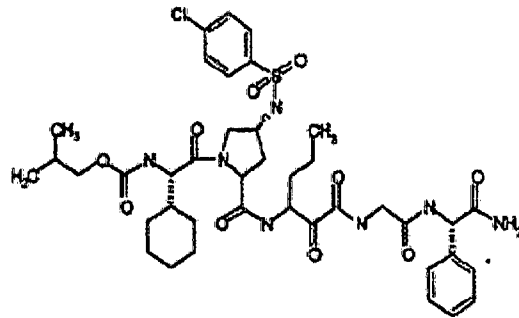
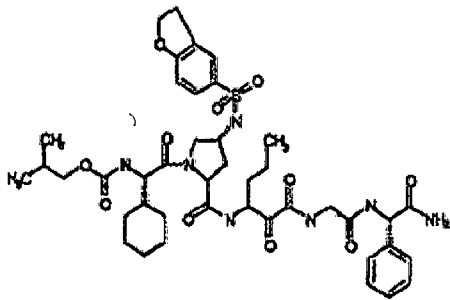
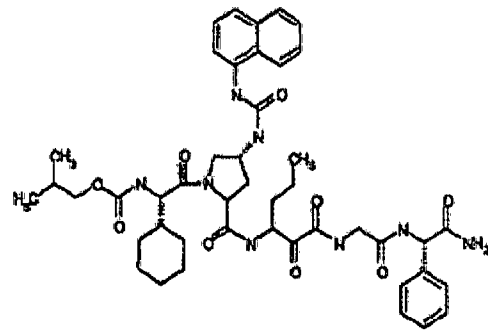
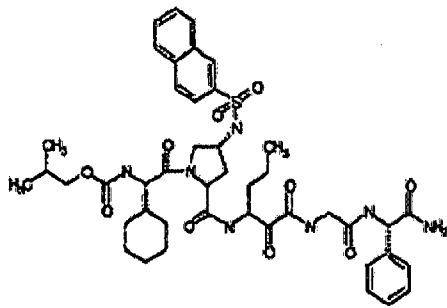


2398

103

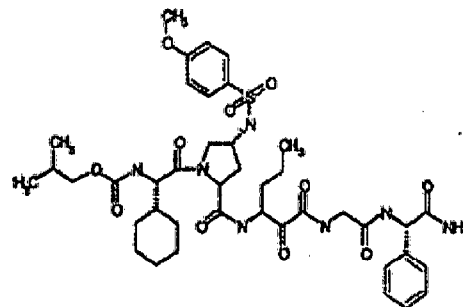
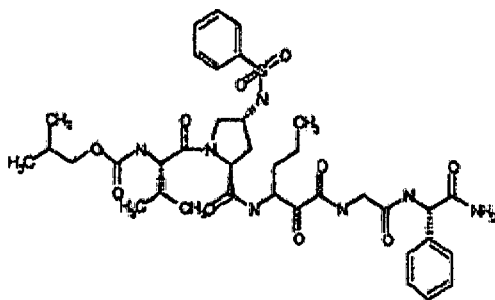
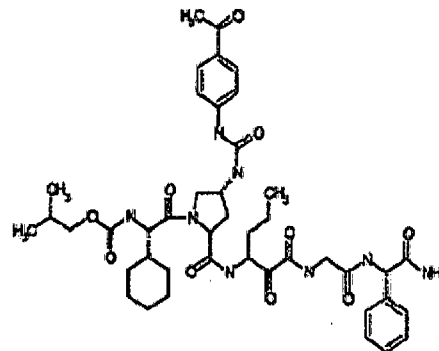
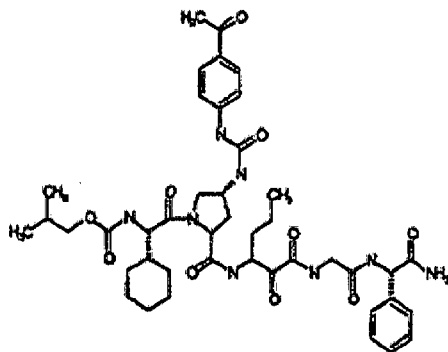
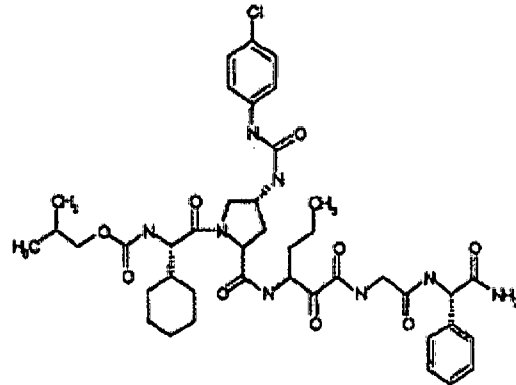
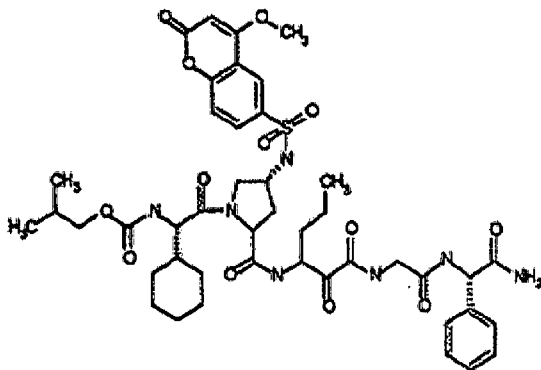
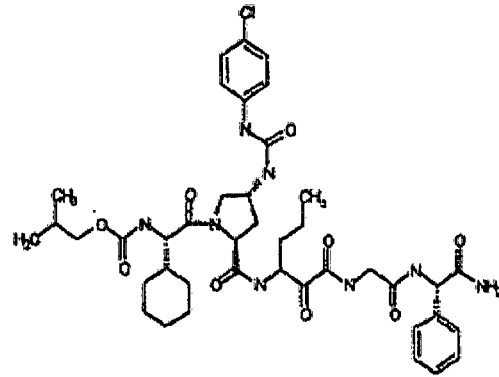
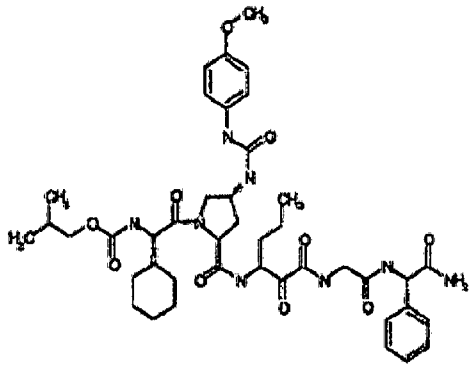


2399
340
rias
062

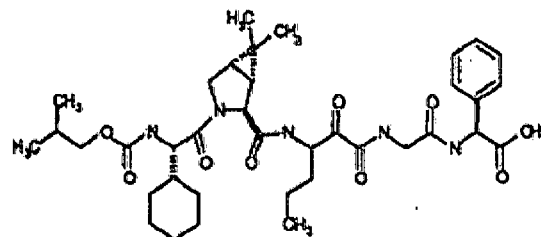
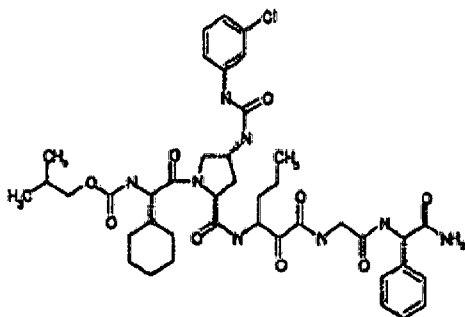
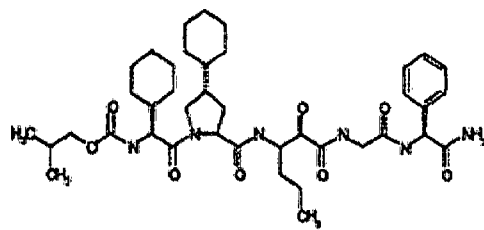
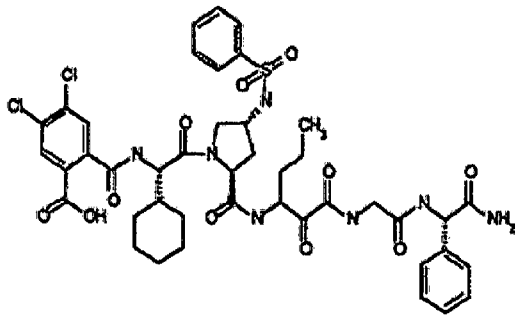
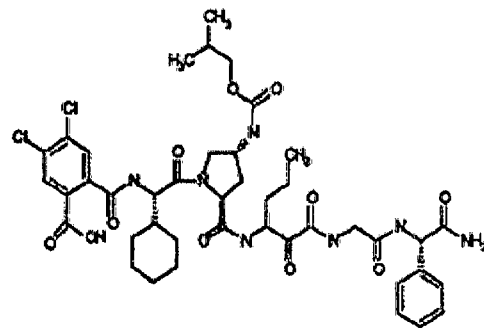
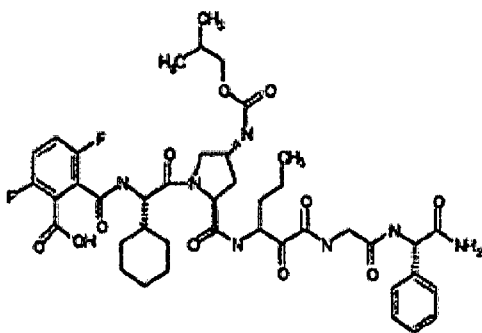
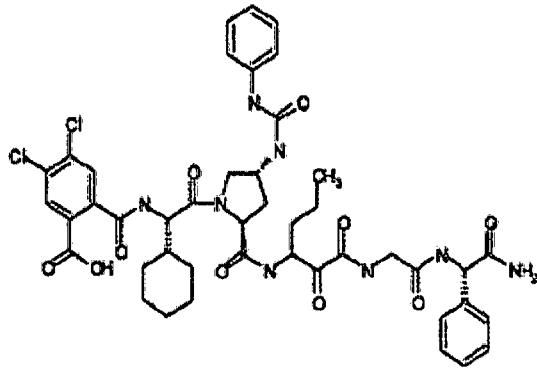
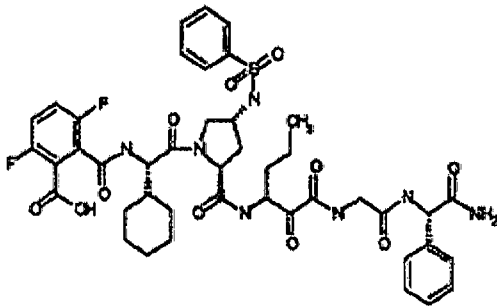
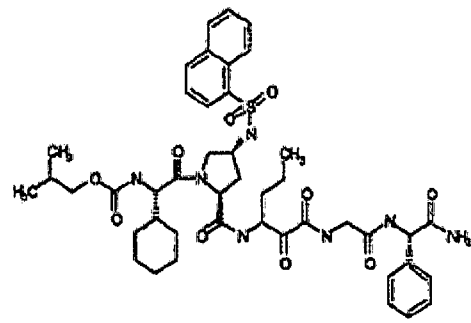
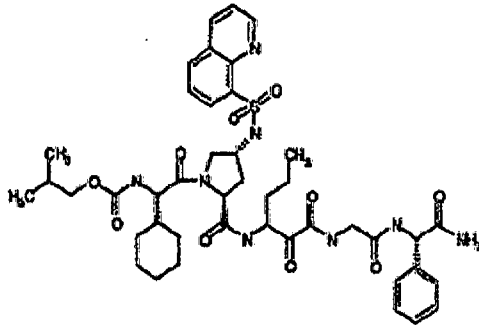


2400

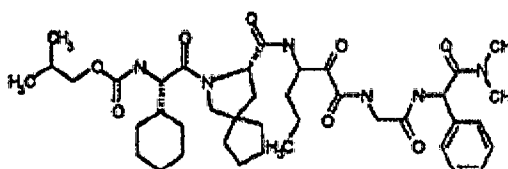
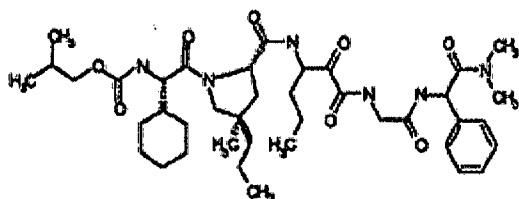
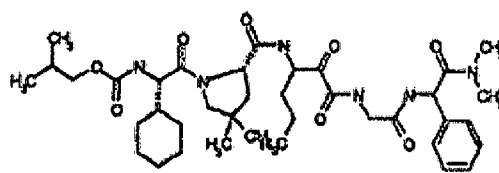
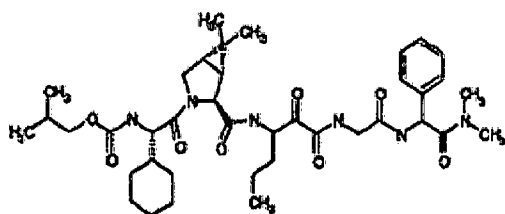
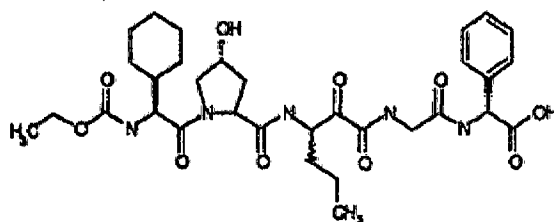
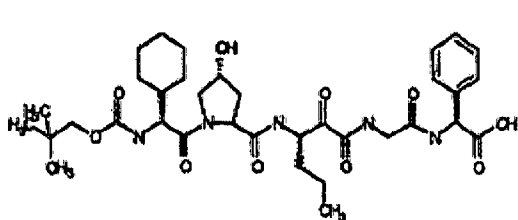
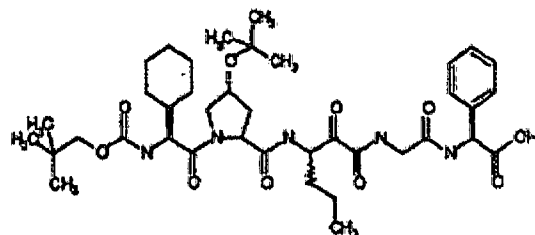
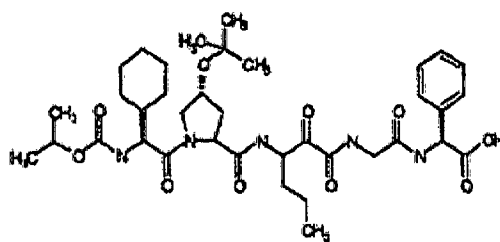
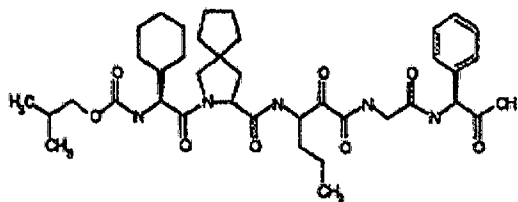
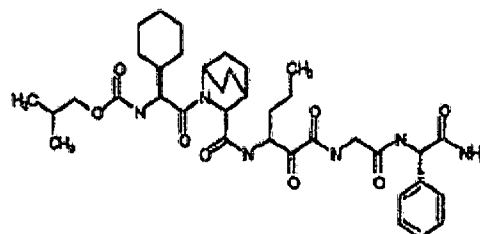
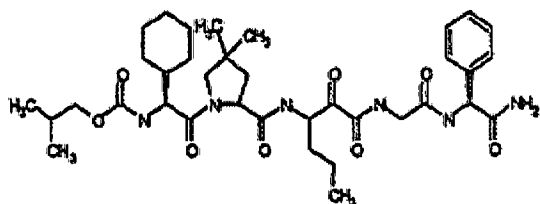
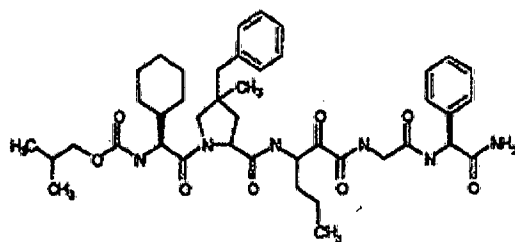
105



2401

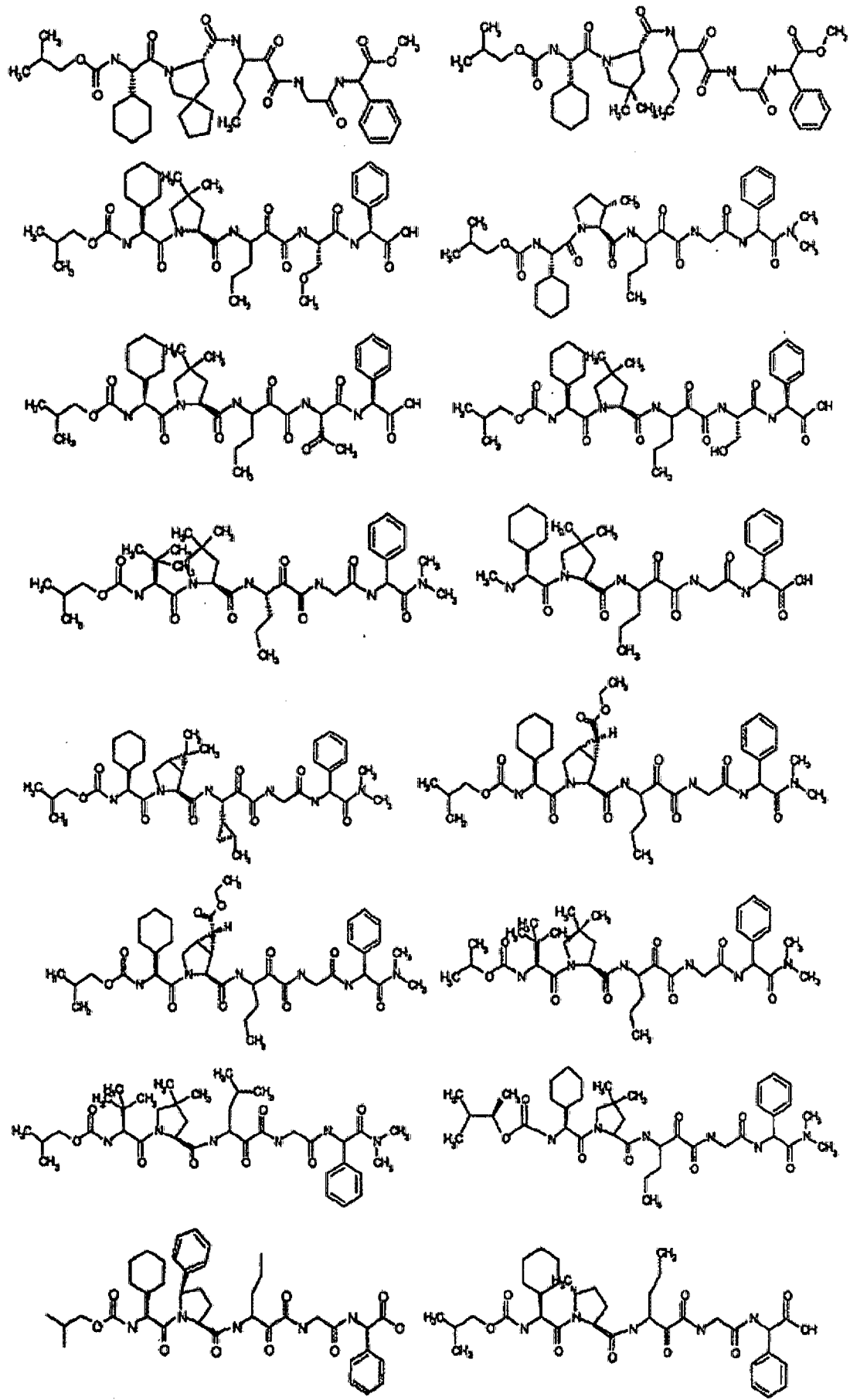


102



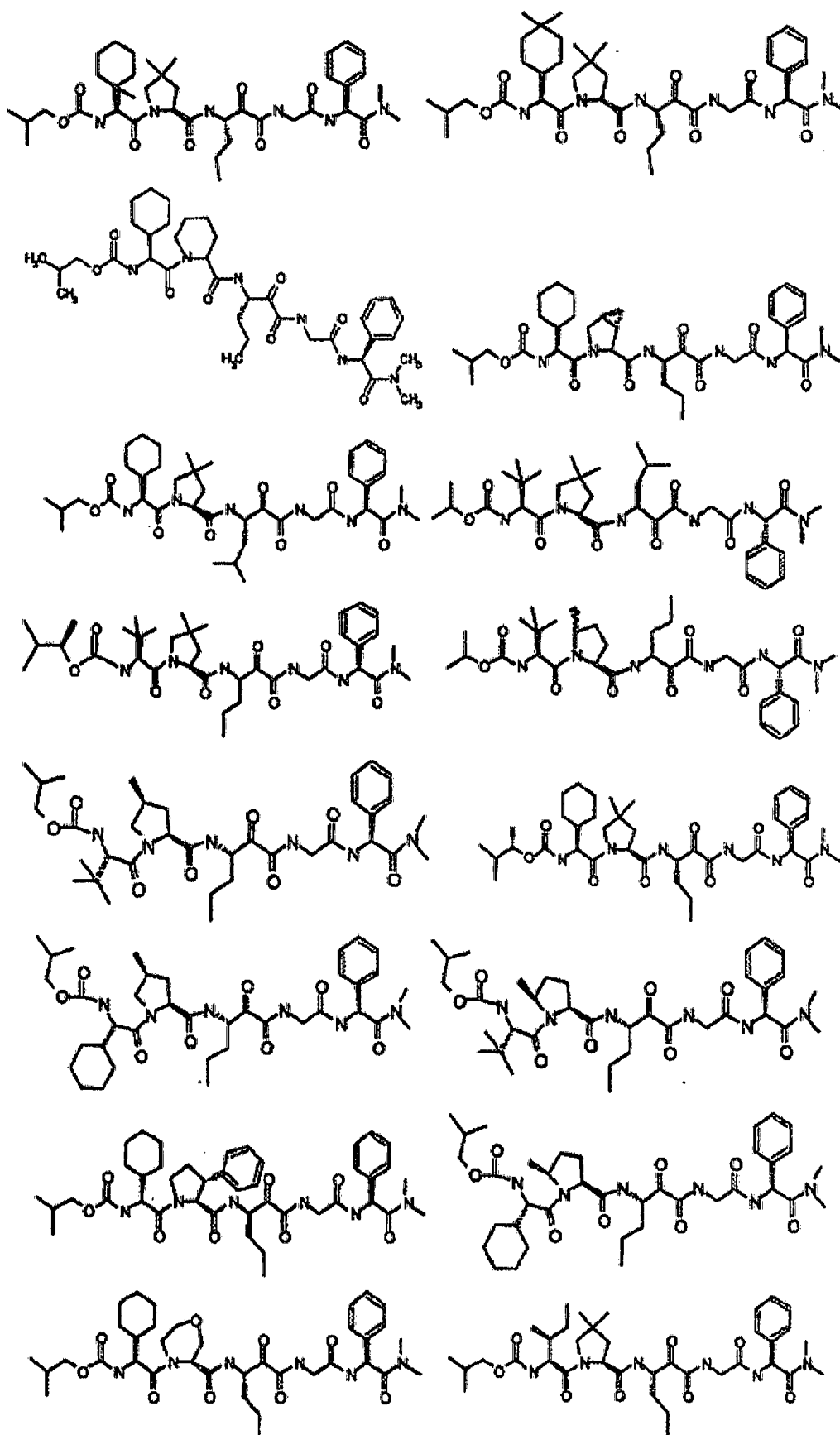
2403

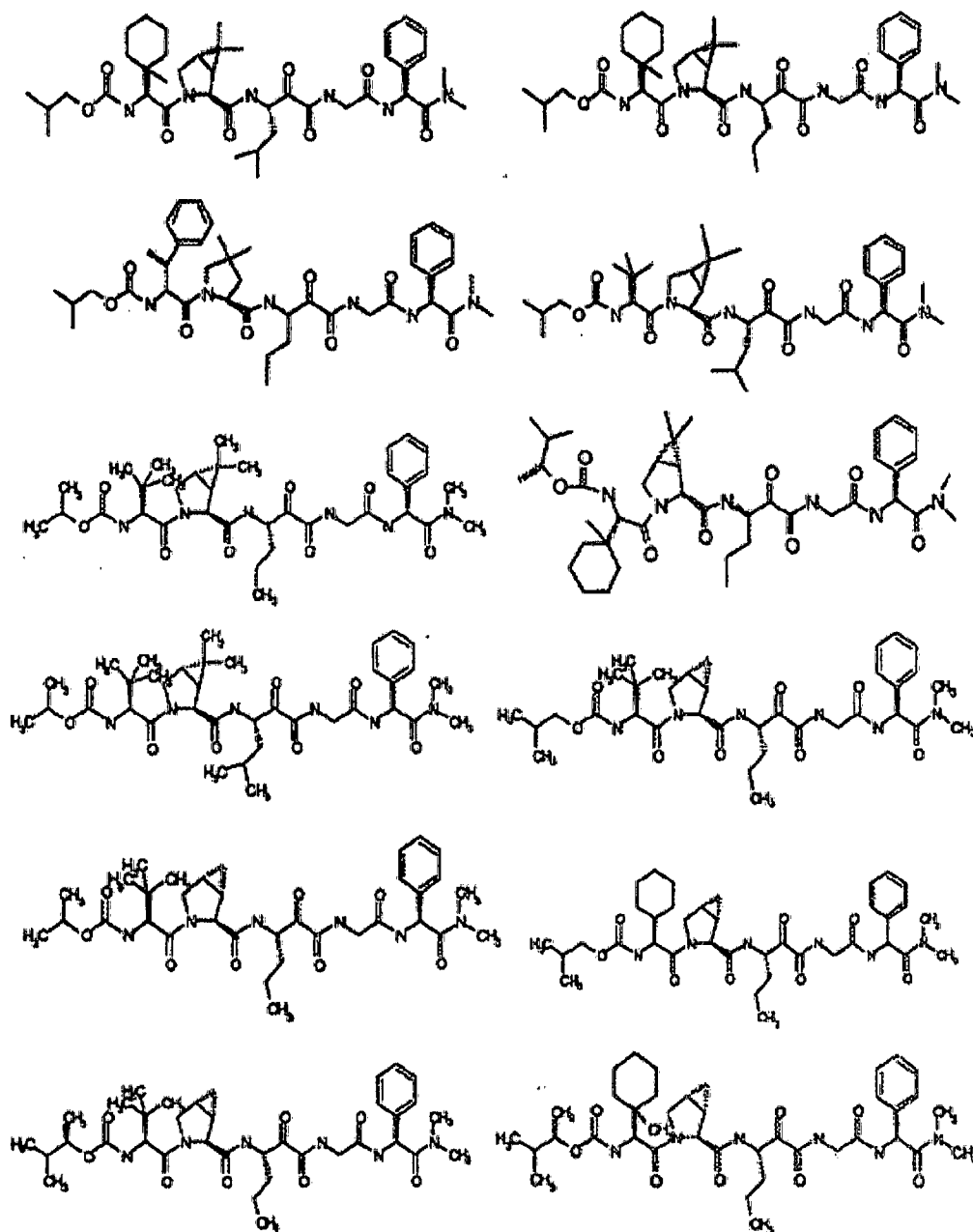
108



2404

109



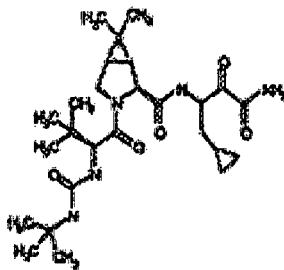


31. Una composición farmacéutica para el tratamiento de trastornos asociados con el HCV dicha composición comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de uno o más compuestos de la Reivindicación 30 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

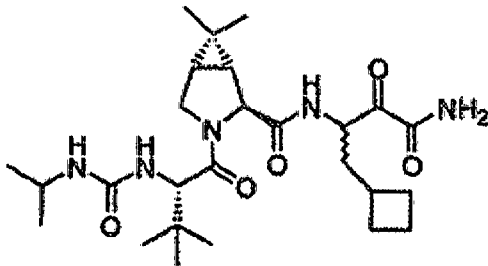
32. La composición farmacéutica de la Reivindicación 31, que contiene adicionalmente un (a) agente antiviral o (b) un interferón o un conjugado alfa del PEG-interferon, o ambos (a) y (b).

33. La composición farmacéutica de la Reivindicación 32, donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón.

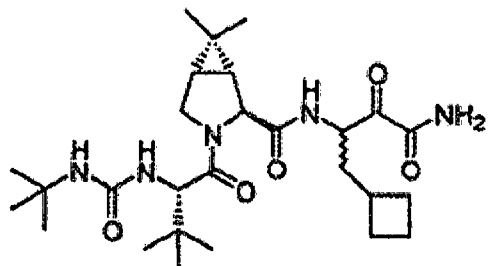
34. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



35. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

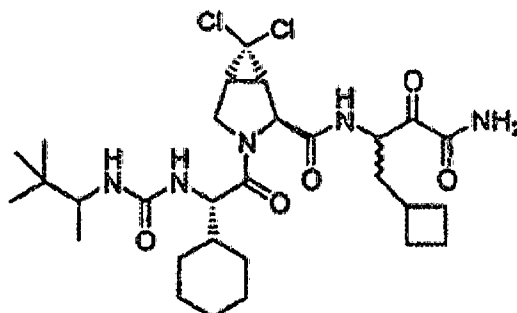


36. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

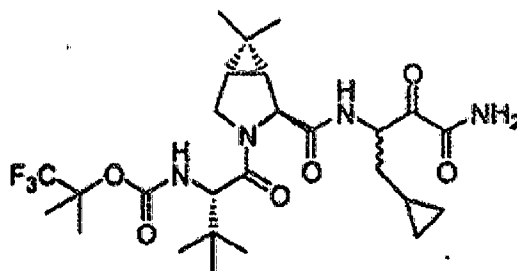


2407
112

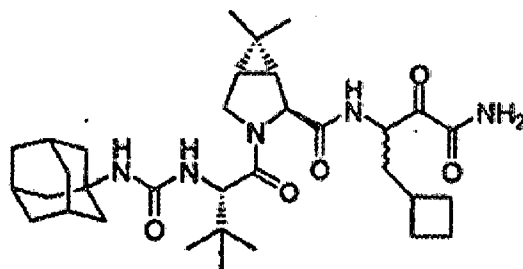
37. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



38. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

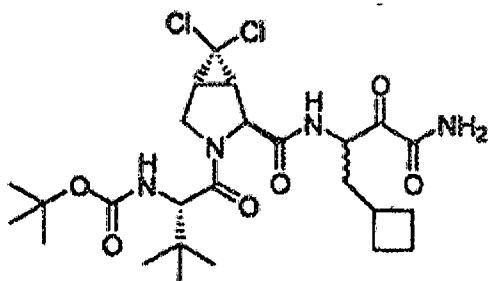


39. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

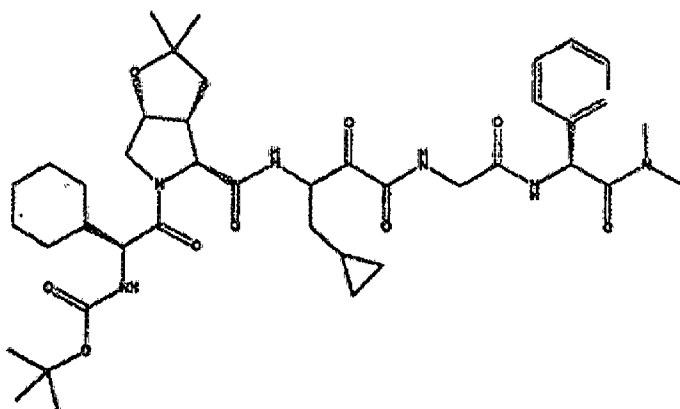


13

40. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

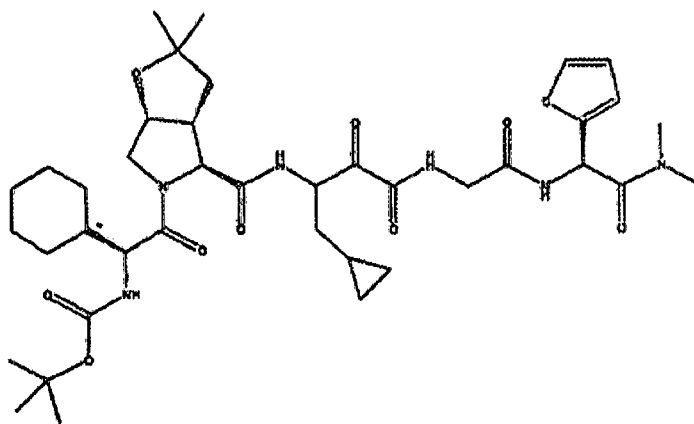


41. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

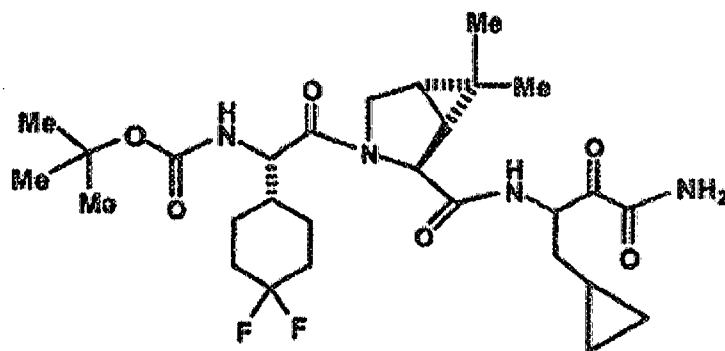


42. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:

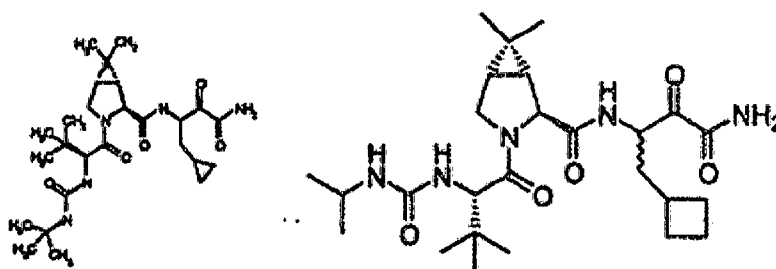
2409
11/12



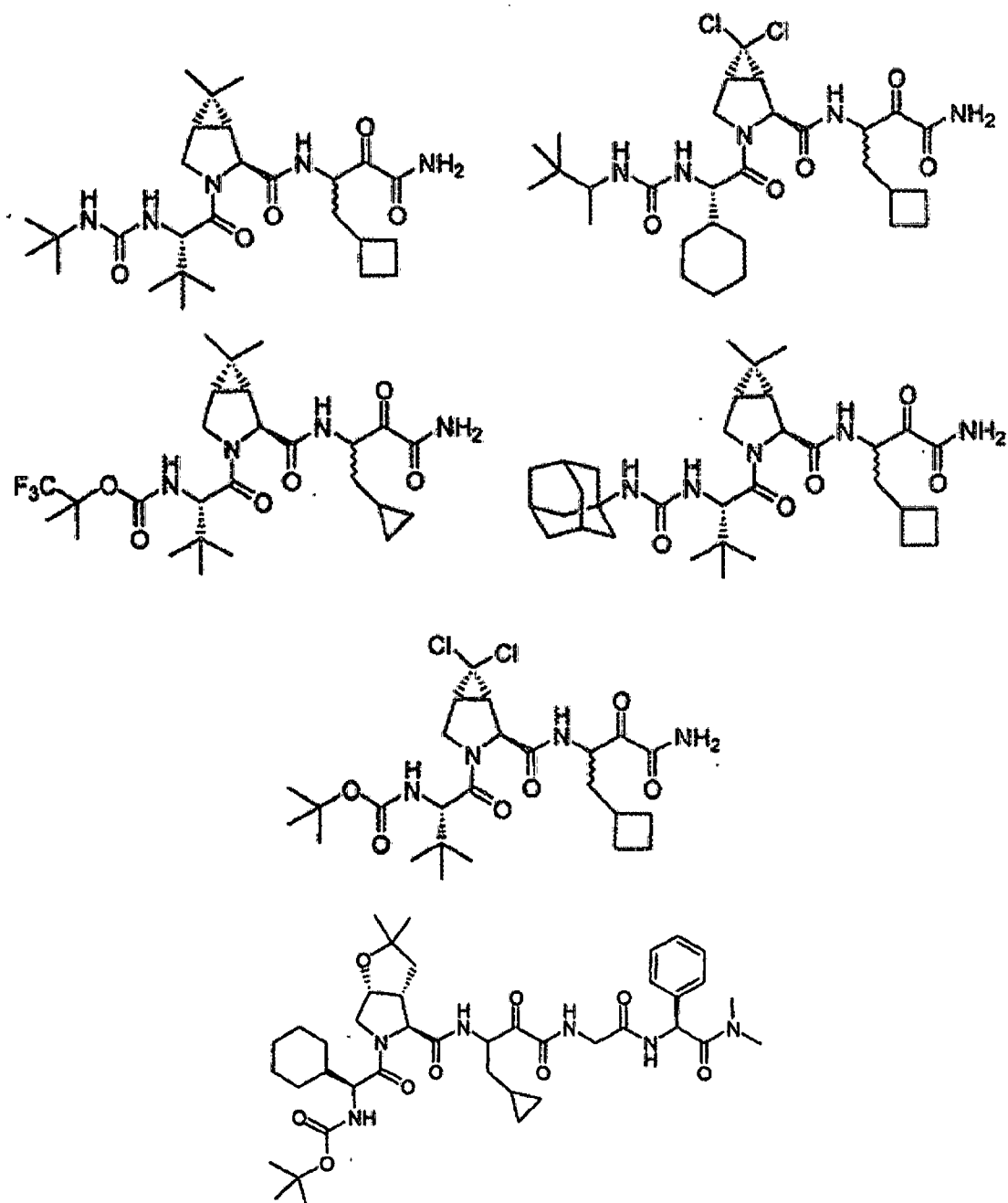
43. Un compuesto que exhibe actividad inhibitoria de la proteasa HCV, que incluye enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, dicho compuesto siendo el compuesto de la estructura mostrada abajo:



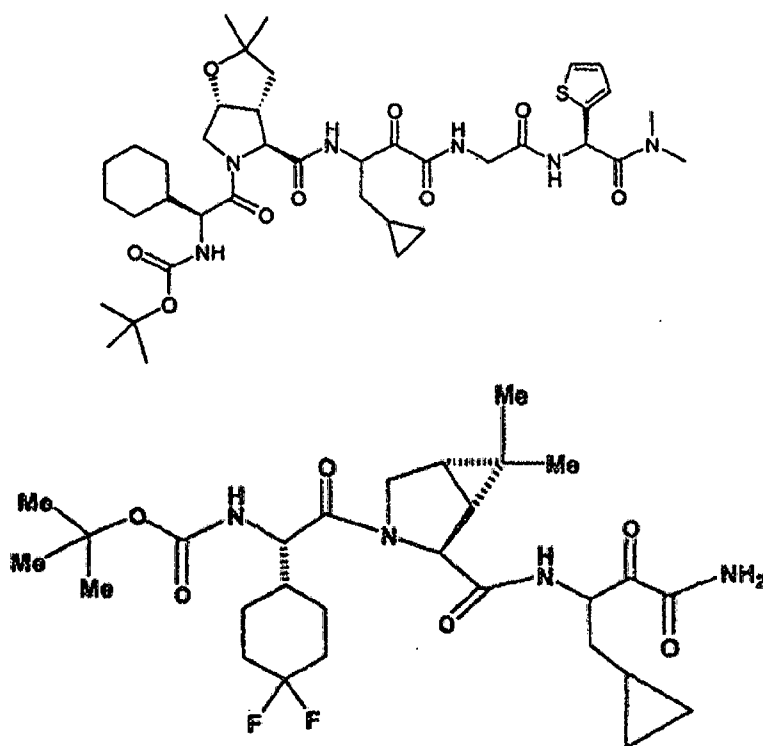
44. Una composición farmacéutica que comprende como ingrediente activo un compuesto, incluyendo enantiómeros, esteroisómeros rotámeros, tautómeros y racematos de dicho compuesto, y sales o solvatos farmacéuticamente aceptables de dicho compuesto, donde dicho compuesto es seleccionado de los siguientes:



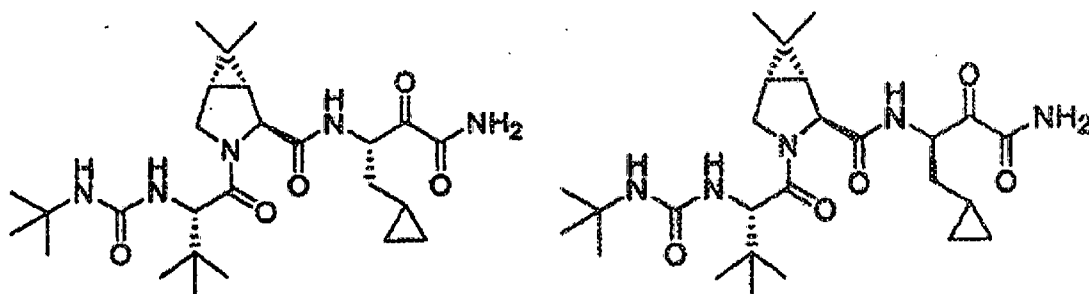
24/10
CS



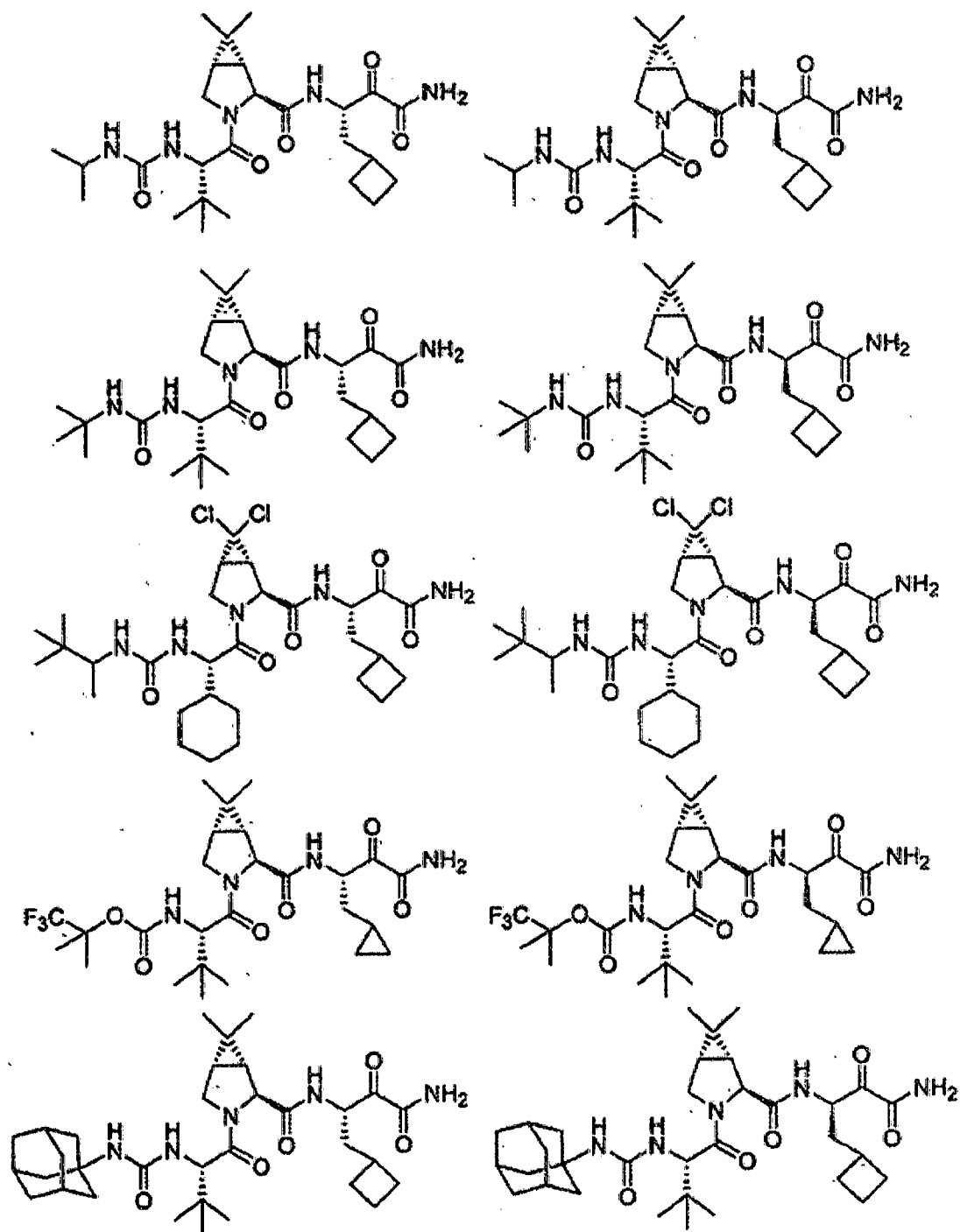
2411
116



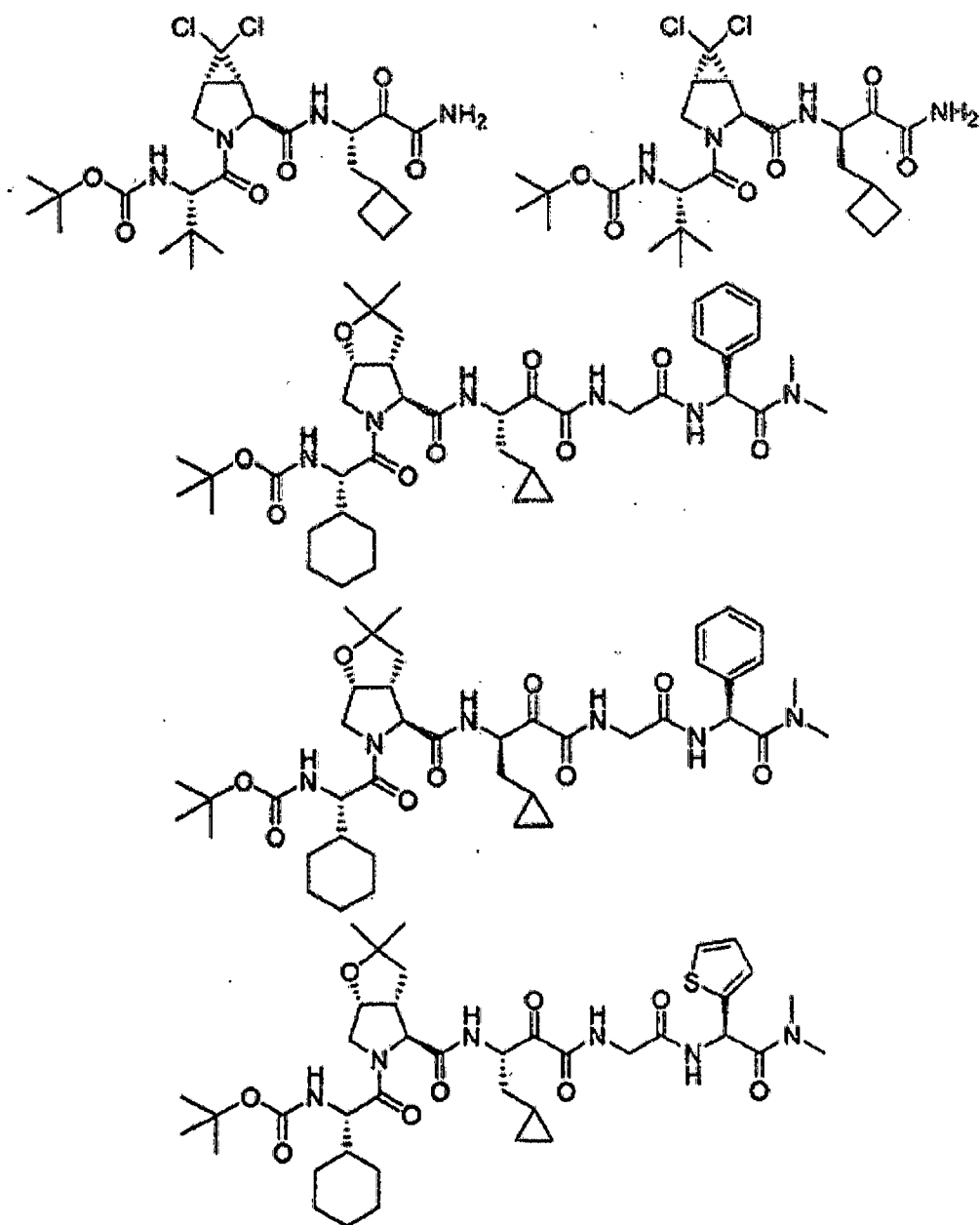
45. La composición farmacéutica de la Reivindicación 44 que contiene (a) un agente antiviral o (b) un interferón o un conjugado de PEG-interferón alfa, o ambos (a) y (b).
46. La composición farmacéutica de la Reivindicación 45, en donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es α -interferón.
47. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de la Reivindicaciones 34 a 46, dicho compuesto se selecciona de los siguientes:

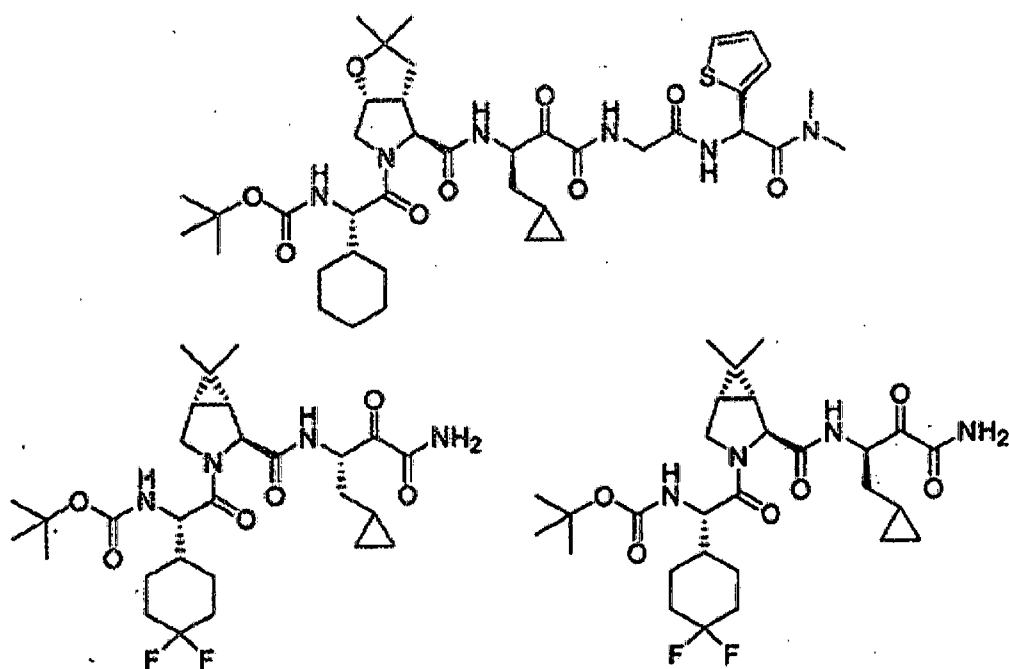


24/12
117

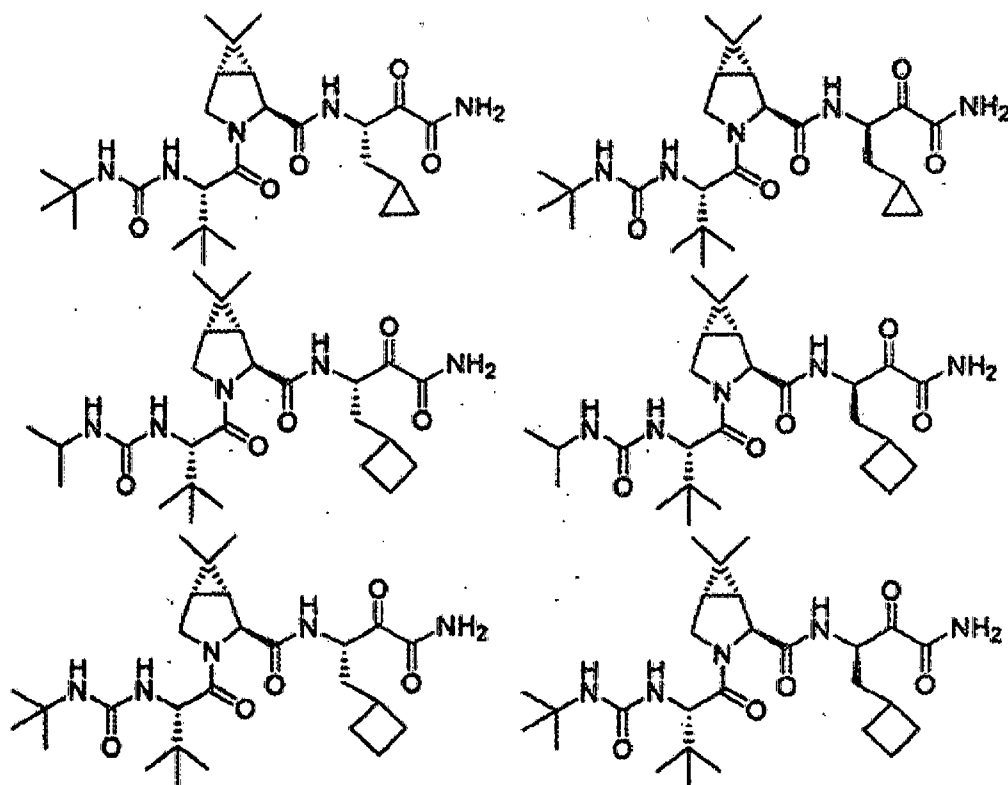


2413

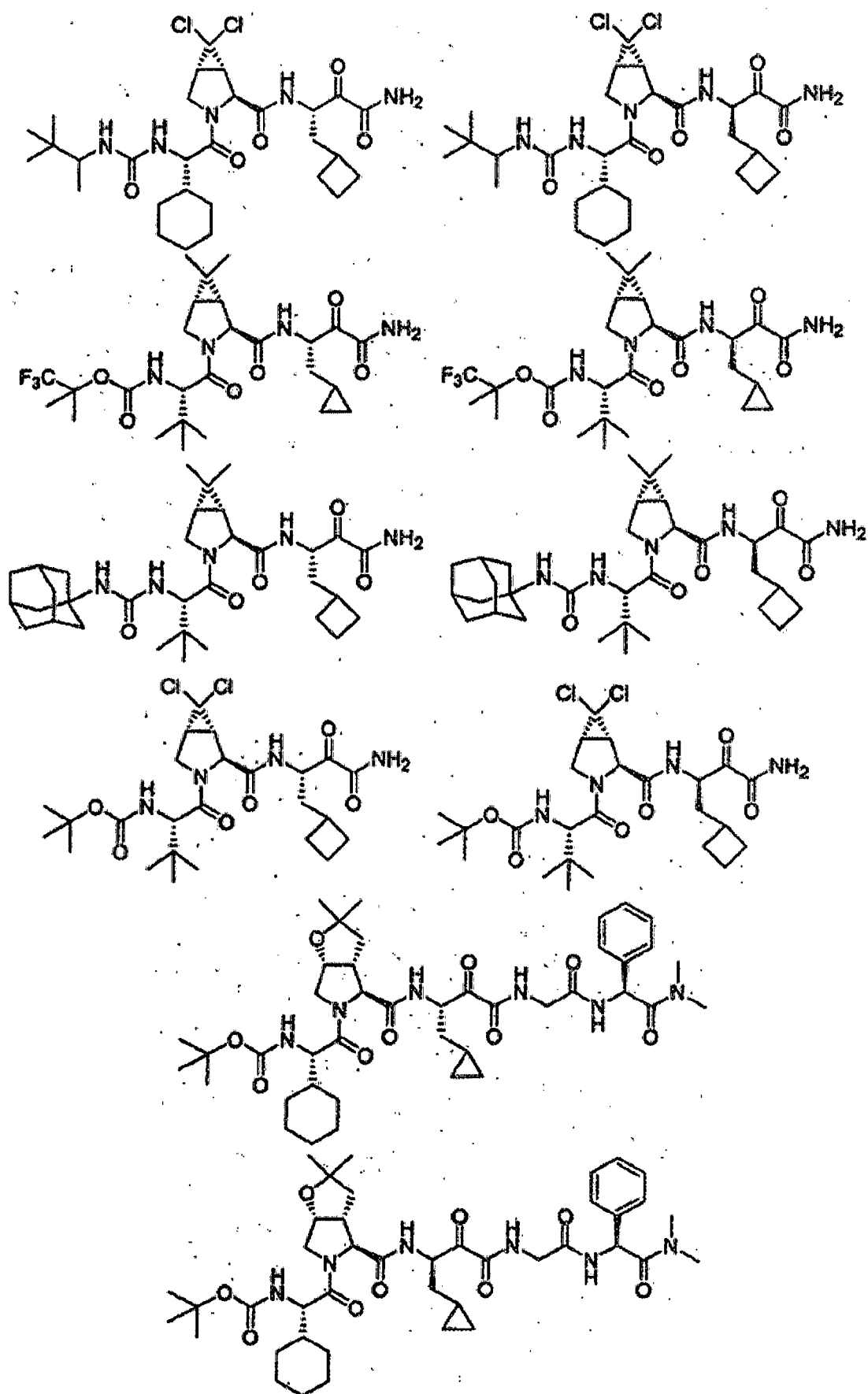




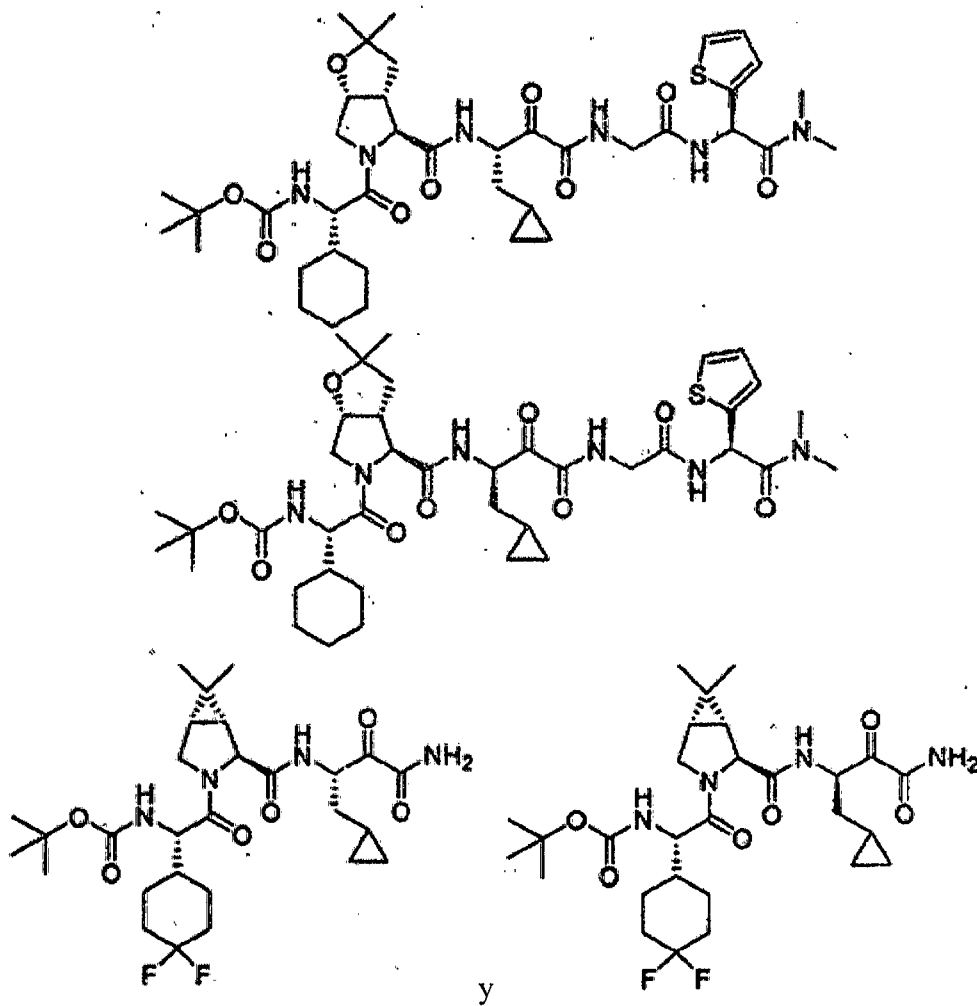
48. La composición farmacéutica de la Reivindicación 44, donde dicho compuesto se selecciona de los siguientes:



24/15
120



121



49. La composición farmacéutica de la Reivindicación 48, que contiene adicionalmente (a) un agente antiviral, o (b) un interferón o un conjugado interferón-alfa, o ambos (a) y (b).

50. La composición farmacéutica de la Reivindicación 49, donde dicho agente antiviral es ribavarina y dicho interferón es interferón-alfa.

24/17
122

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

- Se eliminaron las Reivindicaciones 2, 3, 30, 31, 33, 35-38, 42, 44-50, 63, 65-85, 88, 90-103.
- Se adicionó la Reivindicación 47, compuesta por las estructuras de las antiguas Reivindicaciones 66 a 85.
- Se eliminó el término prófármaco.