

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

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

127
128

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Radicación : 05076004 00000002

Folios 14

Fecha (PNU): 2005-08-24 17:25:09

Trámite : 011 PCI-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLETEN

Dependencia: 2806 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: **P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "TIENOPIRIMIDINDIONAS Y SU USO EN LA MODULACION DE LA ENFERMEDAD AUTOINMUNE".-Clase C07D 513/04.-Expediente número 05-070.084.-**

1. Me refiero a mi memorial de 12 de Agosto de 2005.
2. Debidamente autorizado por mí representado me permito manifestar a ese Despacho que es deseo del solicitante presentar un nuevo juego de reivindicaciones en el que se cancelan las reivindicaciones 14 y 15 del capítulo reivindicatorio originalmente presentado.

En relación con la anterior modificación, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que la misma **no amplía** de manera alguna el alcance de la presente Invención.

3. Anexos me permito presentar:

- (a) Recibo No. 05-51.055, expedido por la SuperIntendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa de modificación;
- (b) Formulario único de modificaciones y correcciones; y
- (c) Copia de las páginas 77 a 86 del capítulo reivindicatorio que reemplaza aquel presentado originalmente, en el cual se ha



[Handwritten signature or mark]

128
#29

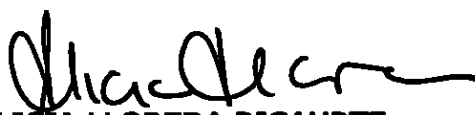
JOSE LLORED CAMACHO & CO.

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

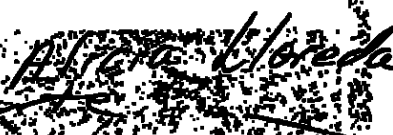
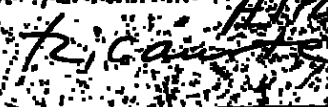
realizado la cancelación de las relvindicaciones expuesta anteriormente.

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

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACIÓN PERSONAL.
Bogotá, D.C. **24 AGO 2005**
Ante mí **JUAN MANUEL BOTERO MEDINA**
NOTARIO SEXTO DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ

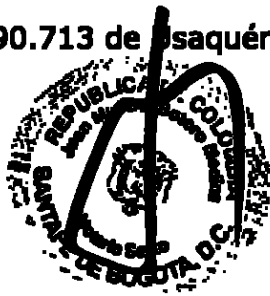
Comparecieron: 


quien (as) exhibió(eron) la(s) C.C.

y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparece(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya (s) y
que el contenido del mismo es cierto. En constan-
cia se firma esta diligencia.


ALICIA LLORED RICAURTE

C.C. No. 39.690.713 de Ibaquén



129

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: **ASTRAZENECA AB**, sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes de Suecia.

Dirección: **S-151 85 Södertälje, Suecia.**

Teléfono: **3 264270**

Fax: **6 069701**

E-mail: **jllcco@lloredacamacho.com**

Domicilio: **Södertälje, Suecia.**

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número _____

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

Dirección: **Calle 72 No.5-83 5º Piso**

Teléfono: **3 264270**

Fax: **2 126426**

E-mail: **jllcco@lloredacamacho.com**

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número **39.690.713** TP **53.215**

④

Número de expediente:

05-070.084

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada modificación al capítulo reivindicatorio

⑥

Comprobante de pago No. **05-51.055**

Fecha **11-07-2005**

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Podemos, si fuere el caso.

☐

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

⑧

NOMBRE **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

FIRMA



C.C. **39.690.713**

T.P. **53.215**

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

27
130

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacon : 05070004 00000002 Folios: 14
Fecha (VNB): 2005-08-24 17:25:09
Tramite : 011 (CI-PROVEN) 379 FASE NUL1 329 COMPLETEN
Dependencia: 8000 DIVISION DE MARCAS COMERCIALES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 51,033
FECHA : JULIO 11 DE 2005

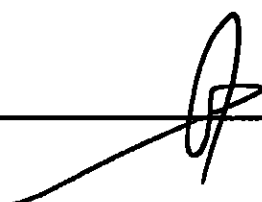
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREBA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	030-00110-6	28102061	11/07/2005	2,500,000.00

***** CONCEPTO *****

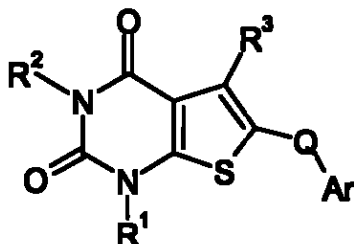
CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	91,000.
	TOTAL :	91,000.00

SON: NOVENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE : 
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Reivindicaciones

1. Un compuesto de fórmula (I):



(1)

en donde:

R¹ y R² independientemente representan un alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono-alquilo de 1 a 3 átomos de carbono o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; cada uno de los cuales pueden ser opcionalmente sustituidos por de 1 a 3 átomos de halógeno;

15

R³ es un grupo CO-G or SO₂-G donde G es un anillo de 5- o 6- miembros que contiene un átomo de nitrógeno y un segundo heteroátomo seleccionado de oxígeno y azufre adyacente al nitrógeno; el anillo esta sustituido por al menos un grupo seleccionado entre un halógeno o un alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, (el cual puede ser opcionalmente sustituido hasta por cinco átomos de halógeno), y opcionalmente sustituido hasta por 4 grupos adicionales independientemente seleccionados entre un halógeno, un hidroxilo y un alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, (el cual puede ser opcionalmente sustituido hasta por cinco átomos de halógeno);

25

Q es CR⁴R⁵ donde R⁴ es hidrógeno, flúor o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono y R⁵ es hidrógeno, flúor o hidroxil;

30

Ar es un sistema de anillo aromático de 5- a 10- miembros en donde hasta 4 átomos del anillo pueden ser heteroátomos independientemente seleccionados entre nitrógeno, oxígeno y azufre, el sistema de anillo puede estar opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre alquilo de 1 a 4 átomos de carbono

132/133

- (opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 grupos hidroxí), alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, haloalquilo, dihaloalquilo, trihaloalquilo, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanóilo de 2 a 4 átomos de carbono, oxo, tioxo, nítro, ciano, $-N(R^6)R^7$ y $-(CH_2)_pN(R^6)R^9$, hidroxí, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfínilo de 1 a 4 átomos de carbono, carbamoilo, alquilcarbamoilo de 1 a 4 átomos de carbono, di-(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)carbamoilo, carboxi, $SO_2N(R^6)R^7$,
- 10 adicionalmente Ar puede estar opcionalmente sustituido por un anillo aromático de 5 o 6 miembros que contiene hasta 4 heteroátomos independientemente seleccionados entre nitrógeno, oxígeno y azufre, y el cual es opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre alquilo de 1 a 4 átomos de
- 15 carbono (opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 grupos hidroxí), alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, haloalquilo, dihaloalquilo, trihaloalquilo, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanóilo de 2 a 4 átomos de carbono, oxo, tioxo, nítro, ciano, -
- 20 $N(R^6)R^7$ y $-(CH_2)_pN(R^6)R^9$, hidroxí, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfínilo de 1 a 4 átomos de carbono, carbamoilo, alquilcarbamoilo de 1 a 4 átomos de carbono, di-(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)carbamoilo, carboxi, $SO_2N(R^6)R^7$,

25 p es 1, 2, 3 o 4;

R^6 y R^7 independientemente representan un átomo de hidrógeno, alcanóilo de 1 a 4 átomos de carbono o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo heterocíclico

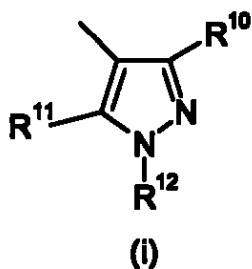
30 saturado de 5- a 7- miembros; y

R^6 y R^9 independientemente representan un átomo de hidrógeno, alcanóilo de 1 a 4 átomos de carbono o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo heterocíclico

35 saturado de 5- a 7- miembros;

y sales y solvatos farmacéuticamente aceptables de estos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el cual R^1 es etilo, propilo, butilo o ciclopropilo.
- 5 3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 en el cual R^2 es metilo.
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en el cual R^3 es un grupo CO-G.
- 10 5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el cual Q es CH_2 .
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en el cual Ar es un anillo aromático de 5- miembros que contiene dos heteroátomos opcionalmente sustituido como se definió en la reivindicación 1 o Ar es un anillo bicclico de 9- o 10- miembros que contiene de uno, dos o tres heteroátomos y opcionalmente sustituido como se definió en la reivindicación 1, o fenilo, opcionalmente sustituido como se definió en la reivindicación 1.
- 15 20 7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6 en el cual Ar es un anillo tienilo, pirazol o tiazol cada uno sustituido por dos o tres sustituyentes alquilo, halógeno, trifluorometilo y/o también sustituido por un grupo 2-pirimidinilo o 2-pirídilo.
- 25 8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6 en donde Ar es un grupo de sub-fórmula (i)



donde R^{10} y R^{11} son independientemente seleccionados entre H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono y R^{12} es seleccionado entre H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono o un sistema de anillo aromático de 5- a 6- miembros en donde hasta 3 átomos del anillo pueden ser heteroátomos independientemente seleccionados entre oxígeno, azufre y nitrógeno, cuyo anillo puede ser opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes independientemente seleccionados entre alquilo de 1 a 4 átomos de carbono (opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 grupos hidroxí), alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, haloalquilo, dihaloalquilo, trihaloalquilo, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquitio de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcanilo de 2 a 4 átomos de carbono, oxo, tioxo, nitro, ciano, - $N(R^6)R^7$ y $-(CH_2)_pN(R^8)R^9$, hidroxí, alquisulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquisulfínilo de 1 a 4 átomos de carbono, carbamoilo, alquicarbamoilo de 1 a 4 átomos de carbono, di-(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)carbamoilo, carboxi, o $SO_2 N(R^6)R^7$, en donde R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y p son como se definió en la reivindicación 1.

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 9 en donde R^{10} y R^{11} son metilo.

10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 9 o la reivindicación 10 en donde R^{12} es seleccionado entre H, alquilo de 1 a 3 átomos de carbono (tal como metilo) o un sistema de anillo aromático de 5- a 6- miembros en donde hasta 3 átomos del anillo pueden ser heteroátomos independientemente seleccionados entre oxígeno, azufre y nitrógeno, opcionalmente sustituido por oxo.

11. Un compuesto de la fórmula (I) seleccionado entre:

(S)-2-[[6-[(3,5-Dimetil-1H-pirazol-4-il)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(2-metilpropil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-d]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

(S)-2-[[6-[(3,5-Dimetil-1*H*-pirazol-4-il)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(2-metiletil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

5 1-Ciclopropil-6-[(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-4-il)metil]-5-[[4*S*]-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4(1*H*,3*H*)-diona,

10 (S)-2-[[6-[(1*H*-1,2,3-Benzotriazol-1-il)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

15 (S)-2-[[6-[(4,5-Dicloro-2-metil-1*H*-imidazol-1-il)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-1-etil-3-metil-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

20 5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(2-metilpropil)-6-(1*H*-pirrolo[2,3-*b*]piridin-3-ilmetil)tieno[2,3-*d*]pirimidina-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

(4*S*)-4-metil-2-[[1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-2,4-dioxo-1-propil-6-(4-quinolinilmetil)tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-isoxazolidinol,

25 (4*S*)-2-[[6-[(2,4-Dicloro-5-tiazolil)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(2-metilpropil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

30 (4*S*)-2-[[6-[(3-Bromo-2-tienil)metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(2-metilpropil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

35 5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4(1*H*,3*H*)-diona,

6-[[3,5-Dimetil-1-(2-piridinil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-5-[[4*S*]-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

5 5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-(1*H*-pirrolo[2,3-*b*]piridin-3-ilmetil)-tieno[2,3-*d*]pirimidina-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

10 (4*S*)-2-[[6-[[3,5-Dimetil-1-(4-piridinil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

15 (4*S*)-2-[[6-[[3,5-Dimetil-1-(2-pirimidinil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-2,4-dioxo-tieno[2,3-*d*]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[(1-fenil-1*H*-pirazol-4-il)metil]-tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

20 6-[(8-Fluoroquinolin-4-il)metil]-5-[[4*S*]-4-hidroxi-4-metil-isoxazolidin-2-il]carbonil]-1-isopropil-3-metiltieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

25 5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-isoxazolidin-2-il]carbonil]-1-isopropil-3-metil-6-(4-pirimidin-2-ilbenzil)tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

5-[[4*S*]-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[(5-(2-piridinil)-2-tienil)metil]-tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

30 6-[(1,3-Dimetil-1*H*-5-pirazolil)metil]-5-[[4*S*]-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

35 6-[(3,5-Dimetil-4-isotiozolil)metil]-5-[[4*S*]-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)tieno[2,3-*d*]pirimidin-2,4-(1*H*,3*H*)-diona,

137/28

5-[[[(4S)-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[[1-(2-tiazolil)-1H-pirazol-4-il]metil]tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona,

5 6-[(4-Fluorofenil)metil]-5-[[[(4S)-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona,

10 5-[[[(4S)-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-(1H-1,2,3-triazol-1-ilmetil)tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona,

15 6-[(6-Cloroimidazo[1,2-a]piridin-3-il)metil]-5-[[[(4S)-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona,

5-[[[(4S)-4-hidroxi-4-metil-2-isoxazolidin-2-il]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[[4-(2-piridinil)fenil]metil]-tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona,

20 (4S)-4-Metil-2-[[1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[[5-metil-1-(2-pirimidinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil]-2,4-dioxotieno[2,3-d]pirimidin-5-il]carbonil]-4-isoxazolidinol,

25 (4S)-2-[[6-[[3,5-Dimetil-1-(2-pirimidinil)-1H-pirazol-4-il]metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-2,4-dioxotieno[2,3-d]pirimidin-5-il]carbonil]-4-etil-4-isoxazolidinol ,

30 (4s)-2-[[6-[[1-(2,3-Dihidro-2-oxo-4-pirimidinil)-3,5-dimetil-1h-pirazol-4-il]metil]-1,2,3,4-tetrahidro-3-metil-1-(1-metiletil)-2,4-dioxotieno[2,3-d]pirimidin-5-il]carbonil]-4-metil-4-isoxazolidinol,

5-[[[(4R)-4-Hidroxi-4-metil-2-isoxazolidinil]carbonil]-3-metil-1-(1-metiletil)-6-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil]-tieno[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-diona

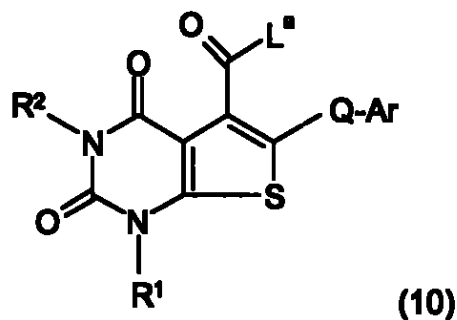
35 y sales farmacéuticamente aceptables de estos.

12. Un compuesto como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 para uso en terapia.

13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de éste como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 en asociación con un portador farmacéutico.

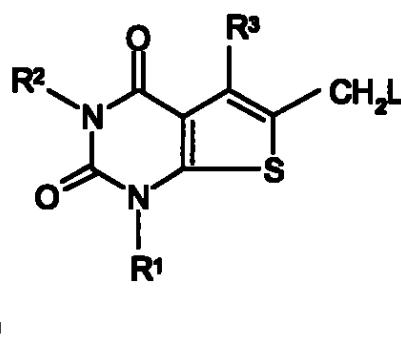
14. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) el cual comprende una de las siguientes reacciones:

a) cuando R^3 es un grupo COG, reacción de un compuesto de la fórmula (10):



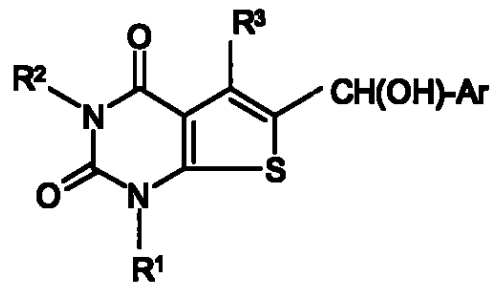
con G-H;

b) cuando Q es metileno, reacción de un compuesto de la fórmula (11):



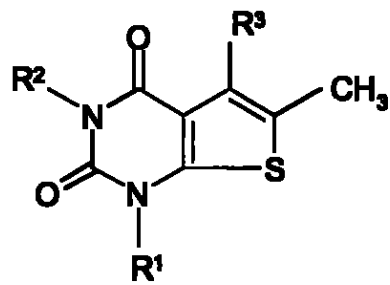
con el compuesto de la fórmula Ar-H;

c) cuando Q es metileno, reducir un compuesto de la fórmula (12):



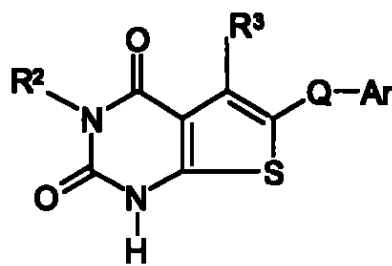
(12)

- 5 d) reacción de un compuesto de la fórmula (11) o (13) para formar Ar por síntesis primaria de anillo:



(13)

- e) reacción de un compuesto de la fórmula (14) con R¹-L²:



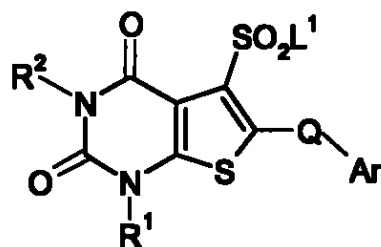
(14)

10

o

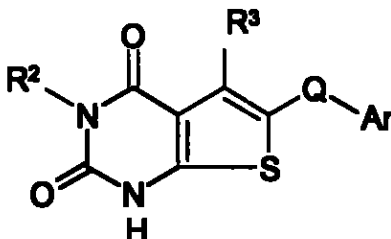
- f) cuando R³ es SO₂G, reacción de un compuesto de la fórmula (15)

15



(15)

con un compuesto G-H



(14)

- 5 en donde L^a , L , L^1 y L^2 son grupos salientes y R^1 , R^2 , R^3 , G , Q y Ar son como se definió arriba o son derivados protegidos de éstos, y opcionalmente después de a), b), c), d), e) o f) convertir el compuesto de la fórmula (1) en un compuesto adicional de la fórmula (1) y/o formar una sal o un solvato farmacéuticamente aceptable de éste.