

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE &

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-068967- -00004-0000

Fecha: 2012-12-27 17:30:20 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 32

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2012/000027

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: NOVARTIS AG

Dirección: Lichtstrasse 35, CH-4056 Basel

Nacionalidad Domicilio: Suiza

Lugar de Constitución: Suiza

Teléfono: _____

Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ **NIT** ☐

C.E. ☐ **Otro** ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: Carrera 5 No. 34-03

Bogotá, D.C. Colombia

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olartemoure.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ **NIT** ☐

C.E. ☐ **Otro** ☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
12-068.967

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se eliminan las
Reivindicaciones 39, 41-51.
Las demás reivindicaciones así como sus relaciones de dependencia, se renumeraron en
función de los cambios realizados. Para tal efecto, adjunto los comprobantes de pago
correspondientes a: (i) modificación voluntaria, y (ii) 65 reivindicaciones adicionales.

6

Comprobante de pago No. 12-

Fecha Diciembre de 2012

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa de modificaciones en trámite \$120.000

☒

Comprobante de pago de la tasa de 96 reivindicaciones adicionales \$1'950.000

Capítulo 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

2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
-/-



RECIBO DE CAJA

No. 12 - 140208

Bogotá D.C., Diciembre 19 de 2012 - 10:29:28

RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS NI 830.122.870

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	532448464	14/12/2012	10.090.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	120.000.00	120.000.00
				\$120.000.00

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

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-068967- -00004-0000

Fecha: 2012-12-27 17:30:20 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 32

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 12 - 140214

Bogotá D.C., Diciembre 19 de 2012 - 10:29:28

RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS NI 830.122.870

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	532448464	14/12/2012	10.090.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
65	50005-01-01	SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	30.000.00
				1.950.000.00
				\$1.950.000.00

SON: **UN MILL&OACUTE;N NOVECIENTOS CINCUENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-068967- -00004-0000

Fecha: 2012-12-27 17:30:20 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 608 MODIFICASOLICIT Folios: 32

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

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

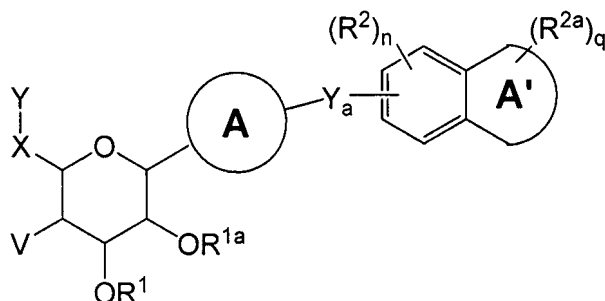
Diciembre 19 de 2012 - 10:29:31

4

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Modificaciones Voluntarias)

1. Un compuesto representado por la Fórmula (I):



(I)

en donde:

el anillo A es un arilo de 6 a 10 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)OR³, -C(O)R³, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -CH₂NR⁴R⁵, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, -S(O)_pR³, -S(O)₂NR⁴R⁵, -OS(O)₂R³, -CH₂C(O)OR³, -CH₂C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)OR³, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, y heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, -S(O)_pR³, -C(O)OR³, -C(O)R³, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -CH₂NR⁴R⁵ y alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono;

el anillo A' es un heterociclo de 5, 6, o 7 miembros, en el entendido de que el anillo A' no es 1,3-dioxol;

Y_a es un enlace o un alquilenos (de 1 a 6 átomos de carbono) que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de

carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

V es hidrógeno, halógeno u $-OR^{1b}$;

n es 0, 1, 2, o 3;

q es 0, 1, 2, o 3;

R^1 , R^{1a} , R^{1b} y R^{1c} se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)$ -arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y $-C(O)$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R^2 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-OS(O)_2R^3$, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde, cuando cualquier porción de R^2 es un alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo, para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-OS(O)_2R^3$, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde, cuando cualquier porción de R^{2a} es un alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o heteroarilo, para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan

X

independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$ y alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre átomos adyacentes, tomados junto con los átomos con los que están unidos, pueden formar un cicloalquilo fusionado de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 átomos de carbono, heterociclilo de 3 a 7 miembros, o heteroarilo de 5 o 6 miembros, en donde el cicloalquilo fusionado, arilo, heterociclilo, y heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-heterociclilo de 3 a 7 miembros o un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R^3 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono;

X es $[C(R^6)-(R^7)]_t$;

Y es H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, OR^{1c} o NR^4R^5 ;

t es 1, 2, o 3;

R^6 y R^7 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, OR^{1c} , y NR^4R^5 ;

o cuando t es 1, R^6 y R^7 pueden formar juntos un grupo oxo,

o cuando R^6 y R^7 están sobre el mismo átomo de carbono, se pueden tomar juntos para formar un cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono o un heterociclo de 3 a 7 miembros;

R^{1c} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)$ -arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y $-C(O)$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

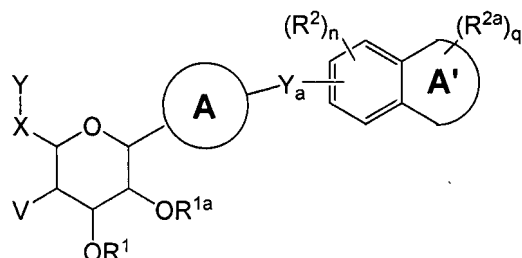
R^4 y R^5 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2

8

a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

R^4 y R^5 tomados junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, pueden formar un heteroarilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más de halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. El compuesto de la Reivindicación 1 representado por la Fórmula (I):



(I)

el anillo A es un arilo de 6 a 10 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, un heteroarilo de 5 miembros, y un heteroarilo de 6 miembros;

el anillo A' es un heterociclo de 5 o 6 miembros, en el entendido de que el anillo A' no es 1,3-dioxol;

Y_a es un enlace o un alquileo (de 1 a 6 átomos de carbono) que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

V es hidrógeno, halógeno u -OR^{1b};

n es 0, 1, 2, o 3;

q es 0, 1, 2, o 3;

R¹, R^{1a}, R^{1b} y R^{1c} se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)-arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y -C(O)-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R², para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)OR³, -C(O)R³, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -CH₂NR⁴R⁵, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, -S(O)_pR³, -S(O)₂NR⁴R⁵, -OS(O)₂R³, -CH₂C(O)OR³, -CH₂C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)NR⁴R⁵,

9

$-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^2 , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{CH}_2\text{NR}^4\text{R}^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5$, $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^{2a} , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre átomos adyacentes, tomados junto con los átomos con los que están unidos, pueden formar un cicloalquilo fusionado de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 átomos de carbono, heterociclilo de 3 a 7 miembros, o heteroarilo de 5 o 6 miembros, en donde el cicloalquilo fusionado, arilo, heterociclilo, y heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-heterociclilo de 3 a 7 miembros o un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R^3 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de

10

carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono;

X es $[C(R^6)-(R^7)]_t$;

Y es H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, OR^{1c} o NR^4R^5 ;

t es 1, 2, o 3;

R^6 y R^7 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, OR^{1e} , y NR^4R^5 ;

o cuando t es 1, R^6 y R^7 pueden formar juntos un grupo oxo,

o cuando R^6 y R^7 están sobre el mismo átomo de carbono, se pueden tomar juntos para formar un cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono o un heterociclo de 3 a 7 miembros;

R^{1e} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)$ -arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y $-C(O)$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R^4 y R^5 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

R^4 y R^5 tomados junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, pueden formar un heteroarilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más de halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. El compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 2, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde V es OH.

4. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^1 es H.

5. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^{1a} es H.

6. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde t es 1.

U

7. El compuesto de la Reivindicación 6, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde X es CH₂.
8. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde Y es H u OH.
9. El compuesto de la Reivindicación 8, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde Y es OH.
10. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A está sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 3 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 3 átomos de carbono, y heteroarilo de 5 miembros.
11. El compuesto de la Reivindicación 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A está sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste en cloro, flúor, hidroxilo, metilo, metoxilo, etoxilo, trifluoro-metoxilo y N-pirazolilo.
12. El compuesto de la Reivindicación 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A está sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste en cloro, etilo, isopropilo, y ciclopropilo.
13. El compuesto de la Reivindicación 12, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A está sustituido con uno o más sustituyentes de cloro.
14. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A es naftilo que está opcionalmente sustituido como en cualquiera de las reivindicaciones anteriores.
15. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A es fenilo que está opcionalmente sustituido como en cualquiera de las reivindicaciones anteriores.
16. El compuesto de la Reivindicación 15, o una sal farmacéuticamente aceptable del

12

mismo, en donde Y_a está situado *meta* en relación con el anillo de tetrahidropirano.

17. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A tiene un sustituyente.

18. El compuesto de la Reivindicación 17, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A es fenilo, Y_a está situado *meta* en relación con el anillo de tetrahidropirano, y el sustituyente está situado *para* en relación con el anillo de tetrahidropirano.

19. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde Y_a es un enlace o un alquileo de 1 a 3 átomos de carbono.

20. El compuesto de la Reivindicación 19, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde Y_A es CH_2 .

21. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^2 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono.

22. El compuesto de la Reivindicación 21, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^2 es halógeno y n es 1.

23. El compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 21, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde n es 0.

24. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A' contiene cuando menos un heteroátomo de O o N.

VB

25. El compuesto de la Reivindicación 24, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A' se selecciona a partir del grupo que consiste en un anillo de morfolina, un anillo de piperidina, un anillo de pirrolidina, un anillo de tetrahidropirano, un anillo de tetrahidrofurano, y un anillo de 1,4-dioxano.

26. El compuesto de la Reivindicación 24, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde el anillo A' se selecciona a partir del grupo que consiste en un anillo de morfolina, un anillo de piperidina, y un anillo de 1,4-dioxano.

27. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, hidroxilo, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$ y $CH_2C(O)OR^3$; en donde R^{2a} , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre átomos adyacentes, tomados junto con los átomos con los que están unidos, pueden formar un cicloalquilo fusionado de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 átomos de carbono, heterociclilo de 3 a 7 miembros, o heteroarilo de 5 miembros, en donde el cicloalquilo fusionado, arilo, heterociclilo, y heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-heterociclilo de 3 a 7 miembros o un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono.

28. El compuesto de la Reivindicación 27, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; en donde R^{2a} , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

19

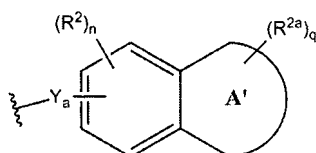
dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono.

29. El compuesto de la Reivindicación 28, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en hidroxilo insustituido y alquilo de 1 a 2 átomos de carbono insustituido.

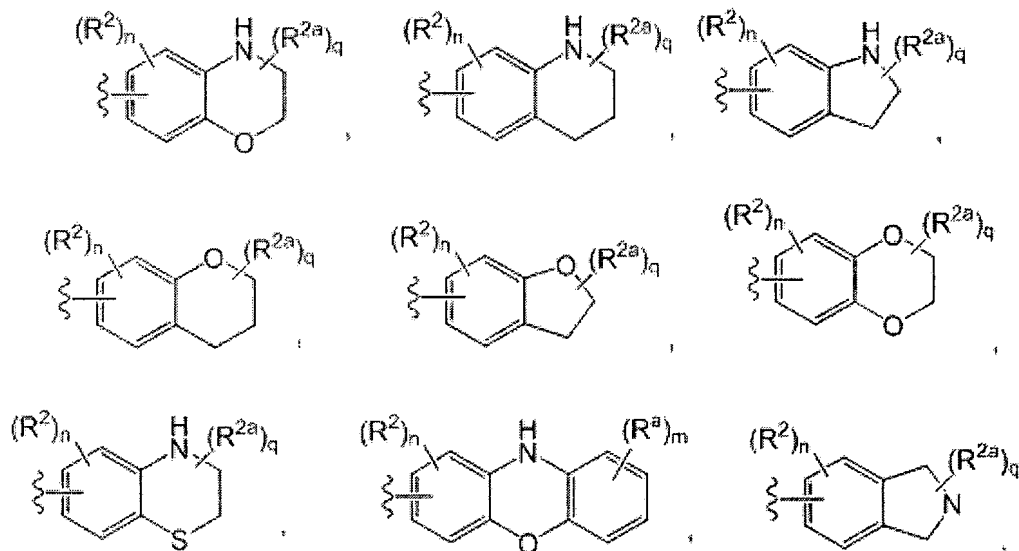
30. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde q es 0 o 1.

31. El compuesto de la Reivindicación 30, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde q es 0.

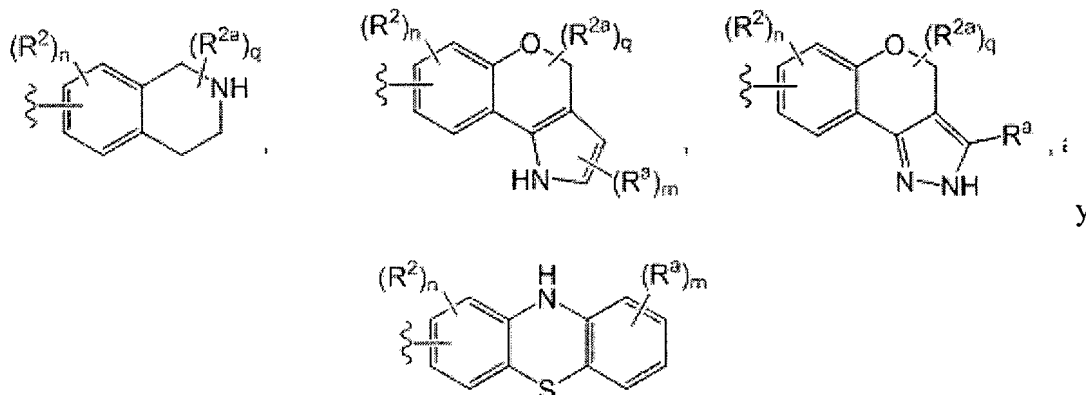
32. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones anteriores, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde la fracción:



se selecciona a partir del grupo que consiste en:

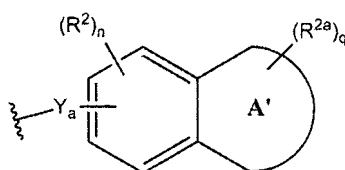


5

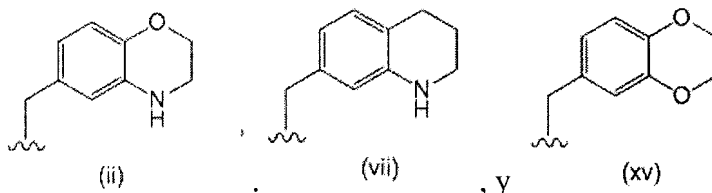


en donde el hidrógeno sobre cada nitrógeno puede ser opcionalmente reemplazado con R^{2a} .

33. El compuesto de la Reivindicación 32, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde la fracción:



se selecciona a partir de cualquiera de las siguientes estructuras (ii), (vii), y (xv):



34. Un compuesto de la Reivindicación 1, seleccionado a partir de los siguientes compuestos 1 a 72, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos:

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-metil-3,4-dihidro-2H benzo-[1,4]-oxazin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-etil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-ciclopropil-3,4-dihidro-2Hbenzo-[1,4]-oxazin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(4-bencil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-cloro-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-{4-cloro-3-[4-(4-metoxi-bencil)-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil]-fenil}-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(4-bencil-2,2-dimetil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-cloro-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(4-bencil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-

16

cloro-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-etil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-ciclopropil-metil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-metil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

etil-éster del ácido 6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-2,3-dihidro-benzo-[1,4]-oxazin-4-carboxílico;

1-{6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-2,3-dihidro-benzo-[1,4]-oxazin-4-il}-etanona;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-{4-cloro-3-[1-(4-metoxi-bencil)-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-6-il-metil]-fenil}-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(2,3-dihidro-1H-indol-5-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2-bencil-1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolin-7-il-metil)-4-cloro-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(1,2,3,4-tetrahidro-isoquinolin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(2,2-dimetil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-(4-cloro-3-croman-6-il-metil-fenil)-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(2,3-dihidro-benzo-furan-5-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2R,3S,4R,5R,6S)-2-hidroxi-metil-6-[4-metil-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-7-il-metil)-fenil]-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-fluoro-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-metoxi-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2R,3S,4R,5R,6S)-2-hidroxi-metil-6-[4-metoxi-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-6-il-

metil)-fenil]-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2R,3S,4R,5R,6S)-2-hidroxi-metil-6-[4-metoxi-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-7-il-metil)-fenil]-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-7-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4,4-espiro-ciclopropil-croman-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

2S,3R,4R,5S,6R)-2-[5-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-2-etoxi-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-metoxi-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-(3-croman-6-il-metil-4-metoxi-fenil)-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-(3-croman-6-il-metil-4-trifluoro-metoxi-fenil)-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-cromen-4-ona;

6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-croman-4-ona;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(4-hidroxi-croman-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(espiro-[croman-2,1'-ciclopentan]-6-il-metil)-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(espiro-[croman-2,1'-ciclopentan]-6-il-metil)-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

6-[[2-cloro-5-[(2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-(hidroxi-metil)-tetrahidro-piran-2-il]-fenil]-metil]-espiro-[croman-2,4'-piperidin]-4-ona;

6-(2-metoxi-5-((2S,3S,4R,5R,6R)-3,4,5-tris-(benciloxi)-6-(benciloxi-metil)-tetrahidro-2H-piran-2-il)-bencil)-espiro-[croman-2,1'-ciclobutano];

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-metoxi-3-(espiro-[croman-2,1'-ciclobutan]-6-il-metil)-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

7-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-4H-benzo-[1,4]-oxazin-3-ona;

7-[2-metoxi-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-4H-benzo-[1,4]-oxazin-3-ona;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(espiro-[croman-2,1'-ciclobutan]-6-il-metil)-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

acetato de [(2R,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-triacetoxi-6-[4-cloro-3-[(2,2-dimetil-3-oxo-4H-

18

1,4-benzoxazin-6-il)-metil]-fenil]-tetrahydro-piran-2-il]-metilo;
6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-2,2-dimetil-4H-benzo-[1,4]-oxazin-3-ona;
6-(2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-(hidroxi-metil)-tetrahydro-2H-piran-2-il)-bencil)-2H-benzo-[b][1,4]-oxazin-3(4H)-ona;
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-[(4-bencil-espiro-[3H-1,4-benzoxazin-2,1'-ciclopropan]-6-il)-metil]-4-cloro-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahydro-piran-3,4,5-triol;
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(espiro-[3,4-dihidro-1,4-benzoxazin-2,1'-ciclopropan]-6-il-metil)-fenil]-6-(hidroxi-metil)-tetrahydro-piran-3,4,5-triol;
(2R,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-triacetoxi-6-[4-cloro-3-(2-ciano-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-tetrahydro-piran-2-il-metil-éster del ácido acético;
6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-2-carbonitrilo;
metil-éster del ácido 6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S, 6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-2-carboxílico;
ácido 6-[2-cloro-5-((2S,3R,4R,5S,6R)-3,4,5-trihidroxi-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-2-carboxílico;
6-[2-bromo-5-((3S,4R,5R,6R)-3,4,5-tris-benciloxi-6-benciloxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-cromano;
6-[2-ciclopropil-5-((3S,4R,5R,6R)-3,4,5-tris-benciloxi-6-benciloxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-cromano;
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-(3-croman-6-il-metil-4-ciclopropil-fenil)-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-3,4,5-triol;
acetato de [(2R,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-triacetoxi-6-[4-bromo-3-(2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il-metil)-fenil]-tetrahydro-piran-2-il]-metilo;
acetato de [(2R,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-triacetoxi-6-[4-bromo-3-(2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il-metil)-fenil]-tetrahydro-piran-2-il]-metilo;
(2R,3R,4R,5S)-3,4,5-triacetoxi-6-[4-ciclopropil-3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-fenil]-tetrahydro-piran-2-il-metil-éster del ácido acético;
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-ciclopropil-3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-3,4,5-triol;
(2R,3R,4R,5S)-3,4,5-triacetoxi-6-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-tetrahydro-piran-2-il-metil-éster del ácido acético;
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahydro-piran-3,4,5-triol;
4-bencil-6-[2-bromo-5-((2S,3S,4R,5R,6R)-3,4,5-tris-benciloxi-6-benciloxi-metil-tetrahydro-piran-2-il)-bencil]-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazina;
4-bencil-6-[2-ciclopropil-5-((2S,3S,4R,5R,6R)-3,4,5-tris-benciloxi-6-benciloxi-

ca

metil-tetrahidro-piran-2-il)-bencil]-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazina;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-ciclopropil-3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[2-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4'-metil-bifenil-4-il]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(4-bencil-3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-isopropil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

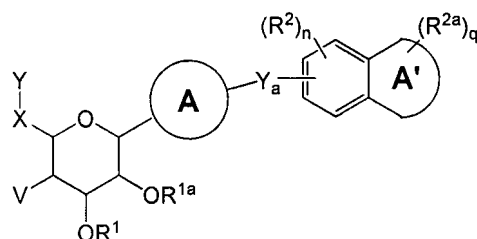
(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-4-isopropil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(1-bencil-1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-7-il-metil)-4-isopropil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2R,3S,4R,5R,6S)-2-hidroxi-metil-6-[4-isopropil-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-7-il-metil)-fenil]-tetrahidro-piran-3,4,5-triol;

(2R,3S,4R,5R,6S)-2-hidroxi-metil-6-[4-isopropil-3-(1,2,3,4-tetrahidro-quinolin-6-il-metil)-fenil]-tetrahidro-piran-3,4,5-triol.

35. El compuesto de la Reivindicación 1, representado por la Fórmula (I-ia):



(I-ia)

en donde:

el anillo A es un arilo de 6 a 10 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)OR³, -C(O)R³, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -CH₂NR⁴R⁵, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, -S(O)ₚR³, -S(O)₂NR⁴R⁵, -OS(O)₂R³, -CH₂C(O)OR³, -CH₂C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)OR³, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-

90

alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde los grupos alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, y heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$ y alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono;

el anillo A' es un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene cuando menos un heteroátomo de O o N, en el entendido de que el anillo A' no es 1,3-dioxol;

Y_a es un enlace o un alqueno de 1 a 3 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

V es hidrógeno, halógeno u $-OR^{1b}$;

n es 0, 1 o 2;

q es 0, 1, 2, o 3;

p es 0, 1 o 2;

R^1 , R^{1a} , R^{1b} y R^{1c} se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)$ -arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y $-C(O)$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R^2 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcóxido de 3 a 7 átomos de carbono, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxido de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxido de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxido de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^2 , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$,

2

-CH₂ NR⁴R⁵, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, -S(O)_pR³, -S(O)₂NR⁴R⁵, -OS(O)₂R³, -CH₂C(O)OR³, -CH₂C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)OR³, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^{2a}, para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre átomos adyacentes, tomados junto con los átomos con los que están unidos, pueden formar un cicloalquilo fusionado de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 átomos de carbono, heterociclilo de 3 a 7 miembros, o heteroarilo de 5 miembros, en donde el cicloalquilo fusionado, arilo, heterociclilo, y heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-heterociclilo de 3 a 7 miembros o un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R³, para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono;

X es [C(R⁶)-(R⁷)]_t;

Y es H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, OR^{1c} o NR⁴R⁵;

t es 1, 2, o 3;

R⁶ y R⁷, para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, OR^{1c}, y NR⁴R⁵;

o cuando t es 1, R⁶ y R⁷ pueden formar juntos un grupo oxo,

o cuando R⁶ y R⁷ están sobre el mismo átomo de carbono, se pueden tomar juntos para formar un cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono o un heterociclo de 3 a 7 miembros;

R^{1c}, para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)-arilo de 6 a 10 átomos de carbono, y -C(O)-alquilo de 1 a 6

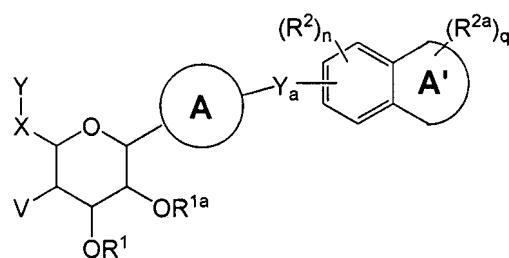
22

átomos de carbono;

R^4 y R^5 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

R^4 y R^5 tomados junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, pueden formar un heteroarilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más de halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

36. El compuesto de la Reivindicación 1 representado por la Fórmula (I-iiia):



(I-iiia)

en donde:

el anillo A es un arilo de 6 a 10 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, alquino de 2 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, -C(O)OR³, -C(O)R³, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴R⁵, -CH₂NR⁴R⁵, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, -S(O)_pR³, -S(O)₂NR⁴R⁵, -OS(O)₂R³, -CH₂C(O)OR³, -CH₂C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)NR⁴R⁵, -NR³C(O)OR³, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde los grupos alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, y heteroarilo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados a partir del grupo que

consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$ y alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono;

el anillo A' es un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene cuando menos un heteroátomo de O o N, en el entendido de que el anillo A' no es 1,3-dioxol;

Y_a es un enlace o un alquileo de 1 a 3 átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

V es OH;

n es 0, 1 o 2;

q es 0, 1, 2, o 3;

R^1 y R^{1a} son cada uno hidrógeno;

R^2 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^2 , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-OS(O)_2R^3$, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^{2a} , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y

29

alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre átomos adyacentes, tomados junto con los átomos con los que están unidos, pueden formar un cicloalquilo fusionado de 3 a 7 átomos de carbono, arilo de 6 átomos de carbono, heterociclilo de 3 a 7 miembros, o heteroarilo de 5 miembros, en donde el cicloalquilo fusionado, arilo, heterociclilo, y heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-heterociclilo de 3 a 7 miembros o un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

R^3 , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono;

p es 0, 1 o 2;

X es $[C(R^6)-(R^7)]_t$;

Y es H u OH;

t es 1;

R^6 y R^7 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno y alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;

o cuando t es 1, R^6 y R^7 pueden formar juntos un grupo oxo;

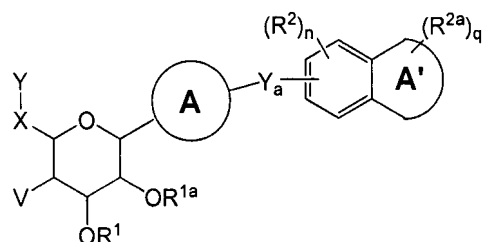
R^4 y R^5 , para cada presentación, se seleccionan independientemente a partir de hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, y heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

R^4 y R^5 tomados junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, pueden formar un heteroarilo o heterociclilo monocíclico o bicíclico, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más de halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

37. El compuesto de la Reivindicación 1 representado por la Fórmula (I-iiia):

[Handwritten signature]

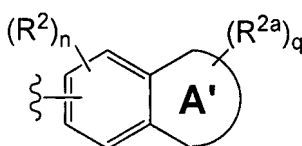


(I-iiiia)

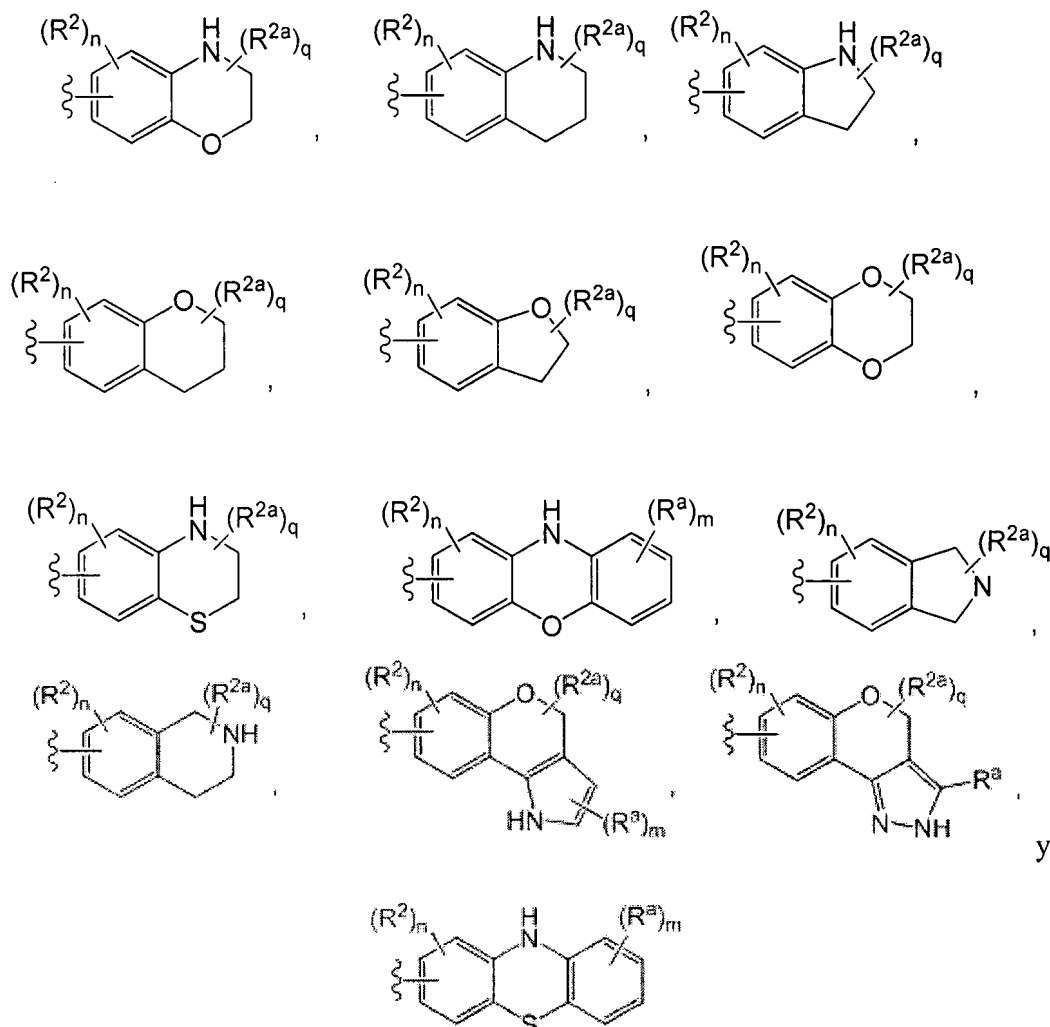
en donde:

el anillo A es un anillo de fenilo que está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste en cloro, flúor, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, isopropilo, etinilo, metoxilo, etoxilo, trifluorometoxilo, amino, dimetil-amino, metil-sulfanilo, metil-sulfonilo, carbamoilo, ciclopropilo, ciclobutilo, fenilo, toluilo, fenoxilo, oxazoliloxilo, y N-pirazolilo;

la estructura representada por la siguiente Fórmula:



se selecciona a partir del grupo que consiste en:



en donde el hidrógeno sobre cada nitrógeno puede ser opcionalmente reemplazado

26

con R^{2a} ; R^a , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$ y alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono; y m es 0 o un entero de 1 a 4;

Y_A es CH_2 ;

V es OH;

n es 0 o 1;

q es 0 o 1;

R^1 y R^{1a} son cada uno hidrógeno;

R^2 es halógeno; en donde R^2 , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R^{2a} , para cada presentación, se selecciona independientemente a partir del grupo que consiste en oxo, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono, arilo de 6 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, $-C(O)OR^3$, $-C(O)R^3$, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4R^5$, $-CH_2NR^4R^5$, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 7 átomos de carbono, $-S(O)_pR^3$, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-OS(O)_2R^3$, $-CH_2C(O)OR^3$, $-CH_2C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)NR^4R^5$, $-NR^3C(O)OR^3$, ariloxilo de 6 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono, heterociclilo de 2 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, heteroarilo de 1 a 10 átomos de carbono, heteroariloxilo de 1 a 10 átomos de carbono, y heterocicloxilo de 1 a 10 átomos de carbono; en donde R^{2a} , para cada presentación, puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

dos R^{2a} sobre el mismo átomo de carbono, tomados juntos, pueden formar un espiro-cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir de halógeno, hidroxilo, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

p es 0, 1 o 2;

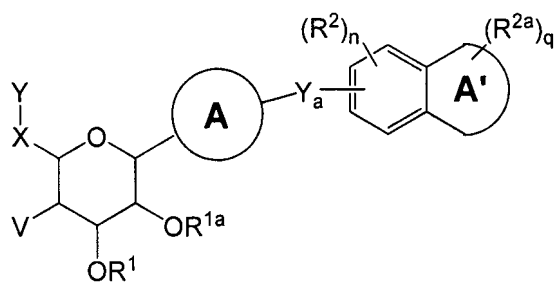
X es CH_2 ;

Y es OH;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

28

38. El compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 2, representado por la Fórmula (V):

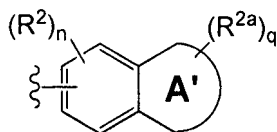


(V)

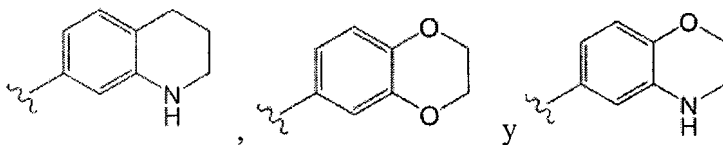
en donde:

el anillo A es fenilo que está sustituido con un sustituyente seleccionado a partir de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono; en donde Y_a está situado *meta* en relación con el anillo de tetrahidropirano, y el sustituyente está situado *para* en relación con el anillo de tetrahidropirano;

la estructura representada por la siguiente Fórmula:



se selecciona a partir del grupo que consiste en:



Y_a es CH_2 ;

n es 0;

q es 0;

V es $-OR^{1b}$;

X es CH_2 ;

Y es OR^{1c} ;

R^1 , R^{1a} , R^{1b} y R^{1c} son hidrógeno;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

39. Una composición farmacéutica, la cual comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 38, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

40. Una composición farmacéutica, la cual comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 38, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en combinación con una cantidad terapéuticamente efectiva de insulina, derivado o mimético de insulina; secretagogo de

insulina; ligando de receptor insulínico de sulfonil-urea; ligando de PPAR; sensibilizante a la insulina; biguanida; inhibidores de alfa-glucosidasa; GLP-1, análogo o mimético de GLP-1; inhibidor de DPPIV; inhibidor de HMG-CoA-reductasa; inhibidor de sintasa de escualeno; ligando FXR o LXR; colestiramina; fibratos; ácido nicotínico; o aspirina.

41. Un producto que comprende un compuesto de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 38, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un agente seleccionado a partir del grupo que consiste en insulina, derivado o mimético de insulina; secretagogo de insulina; ligando de receptor insulínico de sulfonil-urea; ligando de PPAR; sensibilizante a la insulina; biguanida; inhibidores de alfa-glucosidasa; GLP-1, análogo o mimético de GLP-1; inhibidor de DPPIV; inhibidor de HMG-CoA-reductasa; inhibidor de sintasa de escualeno; ligando FXR o LXR; colestiramina; fibratos; ácido nicotínico, y aspirina, para su uso simultáneo, separado, o en secuencia, en terapia.

42. Una forma cristalina del co-cristal de L-prolina de (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol.

43. El cristal de acuerdo con la Reivindicación 42, en donde la proporción molar de la L-prolina al (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-cloro-3-(3,4-dihidro-2H-benzo-[1,4]-oxazin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol es de aproximadamente 1:1.

44. La forma cristalina de acuerdo con la Reivindicación 43, en donde la forma cristalina tiene una endotermia de calorimetría de exploración diferencial a aproximadamente 64°C, a aproximadamente 104°C, y/o a aproximadamente 157°C.

45. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 42 a 44, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 19.3 grados 2θ.

46. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 42 a 45, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 23.2 grados 2θ.

47. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 42 a 46, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 17.0 grados 2θ.

48. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 42 a 47, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 5.7 grados 2θ.

49. Una forma cristalina del co-cristal de L-prolina de (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-ciclopropil-3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol.
50. El cristal de acuerdo con la Reivindicación 49, en donde la proporción molar de la L-prolina al (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-ciclopropil-3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol es de aproximadamente 1:1.
51. La forma cristalina de acuerdo con la Reivindicación 49 o 50, en donde la forma cristalina tiene una endotermia de calorimetría de exploración diferencial a aproximadamente 151°C.
52. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 49 a 51, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 16.7 grados 2θ.
53. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 49 a 52, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 19.9 grados 2θ.
54. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 49 a 53, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 17.6 grados 2θ.
55. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 49 a 54, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 21.9 grados 2θ.
56. Una forma cristalina del co-cristal de L-prolina de (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol.
57. El cristal de acuerdo con la Reivindicación 56, en donde la proporción molar de la L-prolina al (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol es de aproximadamente 1:1.
58. La forma cristalina de acuerdo con la Reivindicación 56 o 57, en donde la forma cristalina tiene una endotermia de calorimetría de exploración diferencial a aproximadamente 136°C.
59. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 56 a 58, la

cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 17.3 grados 2 θ .

60. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 56 a 59, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 20.4 grados 2 θ .

61. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 56 a 60, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 18.0 grados 2 θ .

62. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 56 a 61, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 18.9 grados 2 θ .

63. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 56 a 62, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 23.8 grados 2 θ .

64. El cristal de acuerdo con la Reivindicación 56, en donde la proporción molar de la L-prolina al (2S,3R,4R,5S,6R)-2-[3-(2,3-dihidro-benzo-[1,4]-dioxin-6-il-metil)-4-etil-fenil]-6-hidroxi-metil-tetrahidro-piran-3,4,5-triol es de aproximadamente 2:1.

65. El cristal de acuerdo con la Reivindicación 64, en donde la forma cristalina tiene una endoterminia de calorimetría de exploración diferencial a aproximadamente 176°C.

66. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 64 a 65, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 17.8 grados 2 θ .

67. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 64 a 66, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 9.1 grados 2 θ .

68. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 67, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 20.9 grados 2 θ .

69. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 68, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 18.9 grados 2 θ .

70. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 70, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 15.2 grados 2 θ .

71. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 70, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 16.5 grados 2 θ .

31

72. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 71, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 6.1 grados 2θ .

73. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 72, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 12.8 grados 2θ .

74. La forma cristalina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 64 a 73, la cual tiene un pico de difracción en polvo de rayos-X a aproximadamente 28.4 grados 2θ .

75. La forma cristalina de acuerdo con la Reivindicación 64 o 65, la cual tiene un patrón de difracción en polvo de rayos-X que es sustancialmente igual al patrón de difracción en polvo de rayos-X mostrado en la Figura 4.

32

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

- Se eliminaron las Reivindicaciones 39, 41-51.
- Las reivindicaciones restantes, así como sus relaciones de dependencia fueron reenumeradas de acuerdo con los cambios realizados.