



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-121222- -00001-0000

Fecha: 2012-07-24 16:43:40 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 26

radicación

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

- ☐ Error material ☒ Modificación a una Solicitud en trámite
- ☒ Patente de Invención
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad
- ☐ Registro de Diseño Industrial
- ☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐

Persona Jurídica ☒

DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Japón	3-5-1, Nihonbashi Honcho, Chuo-ku,	Tokyo 1038426
Dirección electrónica		No. Fax
clientes@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre
De Páez Luz Clemencia

Documento de identificación
C.C. 35.456.344

Tarjeta profesional
T.P.A. 23.555

Dirección y domicilio		Ciudad
Carrera 4ª No. 72 -35		Bogotá
Dirección electrónica		No. Fax
clientes@cavelier.com		2 11 86 50
		Número telefónico
		3 47 36 11

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

4. Datos del trámite**Corrección:****Expediente No 12.121.222****Aparece****Debe ser****Modificación:****Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 73 reivindicaciones y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.

Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y además se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

**Modificación al capítulo descriptivo.****Modificación al resumen.****Modificación a los dibujos.****Modificación al solicitante.****5. Anexos**

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación.



Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma	
Nombre y apellidos	Firma
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	<i>LUZ CLEMENCIA DE PAEZ</i>
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555 <i>TPA 23555055</i>

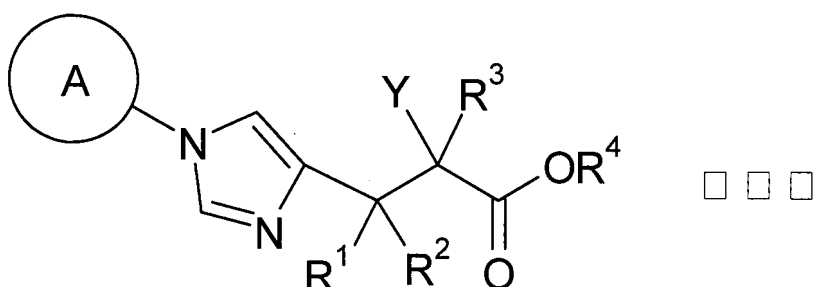
001

SCT\SDC\AF222106\WPC15869

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

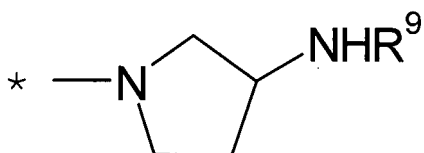
1.- Un compuesto representado por la fórmula general (I) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 1]



en donde A representa un grupo cicloalquilo de C3 a C12 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; R^1 , R^2 y R^3 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo fluoro o un grupo alquilo de C1 a C6; R^4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco; y Y representa un grupo: $-\text{CH}_2-\text{CHR}^5-\text{CH}_2-\text{NHR}^6$ (en donde R^5 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6, y R^6 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco), $-\text{O}-\text{CHR}^7-\text{CH}_2-\text{NHR}^8$ (en donde R^7 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6, y R^8 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco), o

[Fórmula 2]



(en donde R⁹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco, y * representa la posición para sustitución).

2.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxí, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo ariloxi y un grupo heterocicliloxi.

3.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxí, un grupo metilo y un grupo etilo.

4.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxí, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo ariloxi y un grupo heterocicliloxi.

5.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo cicloalquilo de C3 a C12 sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes.

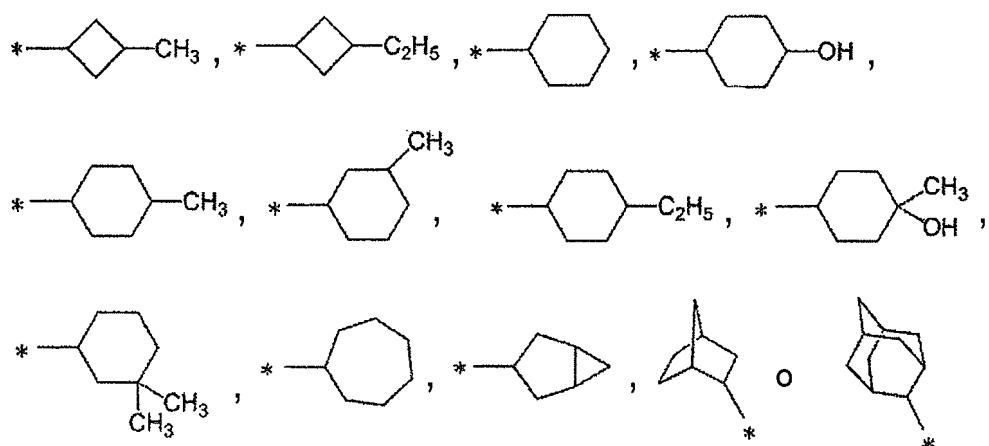
6.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo cicloalquilo de C3 a C12 sustituido por un grupo metilo o un grupo etilo.

7.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes.

8.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por un grupo metilo o un grupo etilo.

9.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo:

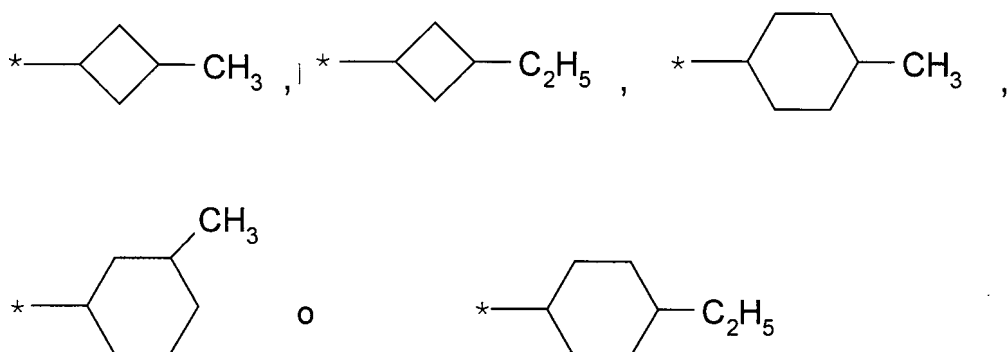
[Fórmula 3]



(en donde * representa la posición para sustitución).

10.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo:

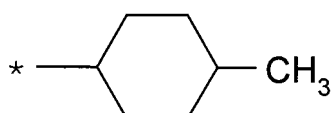
[Fórmula 4]



(en donde * representa la posición para sustitución).

11.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es el grupo:

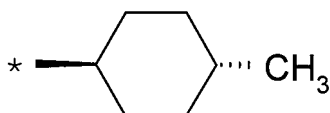
[Fórmula 5]



(en donde * representa la posición para sustitución).

12.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es el grupo:

[Fórmula 6]



(en donde * representa la posición para sustitución).

13.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque Y es el grupo: -CH₂-CHR⁵-CH₂-NHR⁶ (en donde R⁵ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6, y R⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco).

14.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 13 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R⁵ es un átomo de hidrógeno.

15.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 13 o 14 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^6 es un átomo de hidrógeno.

16.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 13 o 14 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^6 es un grupo de profármaco.

17.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 16 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el grupo de profármaco representado por R^6 es un grupo alcanilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxi, un grupo carbamilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcoxycarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcaniloxi de C2 a C6, un grupo cicloalquylcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquyloxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

18.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 16 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el grupo de profármaco representado por R^6 es un grupo fenilalanilo, un grupo L-norleucilo, un grupo [(5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metoxi]carbonilo, un grupo [1-(isobutiriloxi)etoxi]carbonilo, un grupo [1-(2,2-dimetilpropanoiloxi)etoxi]carbonilo, un grupo ({1-[(ciclohexilcarbonil)oxi]etoxi}carbonilo) o un grupo (1-acetoxietoxi)carbonilo.

19.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo,

caracterizado además porque Y es el grupo: $-O-CH(R^7)-CH_2-NHR^8$ (en donde R^7 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6, y R^8 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco).

20.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 19 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^7 es un átomo de hidrógeno.

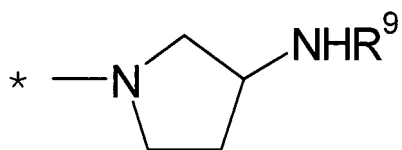
21.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 19 o 20 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^8 es un átomo de hidrógeno.

22.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 19 o 20 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^8 es un grupo de profármaco.

23.- El compuesto de conformidad con 22 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el grupo de profármaco representado por R^8 es un grupo alcanilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcoxycarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcaniloxi de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarboniloxi de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquiloxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

24.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque Y es el grupo:

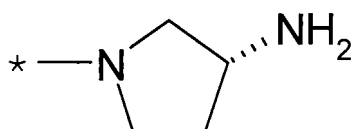
[Fórmula 7]



(en donde R^9 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco, y * representa la posición para sustitución).

25.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque Y es el grupo:

[Fórmula 8]



(en donde * representa la posición para sustitución).

26.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque Y es el grupo:

[Fórmula 9]



(en donde * representa la posición para sustitución).

27.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 26 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^1 , R^2 y R^3 son un átomo de hidrógeno.

28.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^4 es un átomo de hidrógeno.

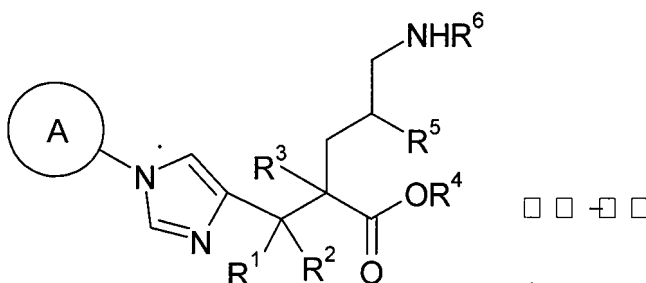
29.- El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque R^4 es un grupo de profármaco.

30.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 29 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el grupo de profármaco representado por R^4 es un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanoiilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

31.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 29 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el grupo de profármaco representado por R^4 es un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxicarbonil)oxi]etilo.

32.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-1) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 10]



en donde A representa un grupo cicloalquilo de C3 a C12 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; R^1 , R^2 y R^3 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo fluoro o un grupo alquilo de

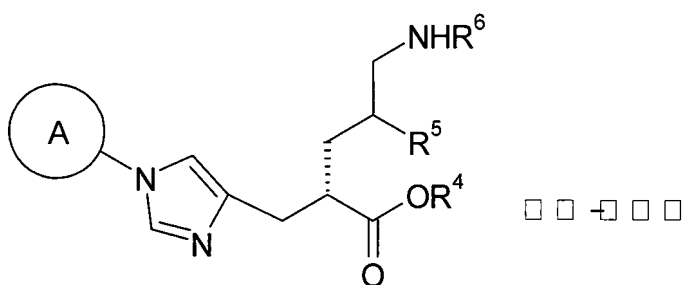
C1 a C6; R⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco; R⁵ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6; y R⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco.

33.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 32 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; R¹, R² y R³ son un átomo de hidrógeno; R⁴ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanoiolo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6; R⁵ es un átomo de hidrógeno; y R⁶ es un átomo de hidrógeno; un grupo alcanoiolo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxilo, un grupo carbamilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcoxicarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcanoiolo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquiloalcoxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

34.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 32 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; R¹, R² y R³ son un átomo de hidrógeno; R⁴ es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxicarbonil)oxi]etilo; R⁵ es un átomo de hidrógeno; y R⁶ es un átomo de hidrógeno, un grupo fenilalanilo, un grupo L-norleucilo, un grupo [(5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metoxi]carbonilo, un grupo [1-(isobutiriloxi)etoxi]carbonilo, un grupo [1-(2,2-dimetilpropanoiloxi)etoxi]carbonilo, un grupo ({1-[(ciclohexilcarbonil)oxi]etoxi}carbonilo) o un grupo (1-acetoxietoxi)carbonilo.

35.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-1a) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 11]



en donde A representa un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; R⁴ representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanoiloxi de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarboniloxi de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6; R⁵ representa un átomo de hidrógeno, un

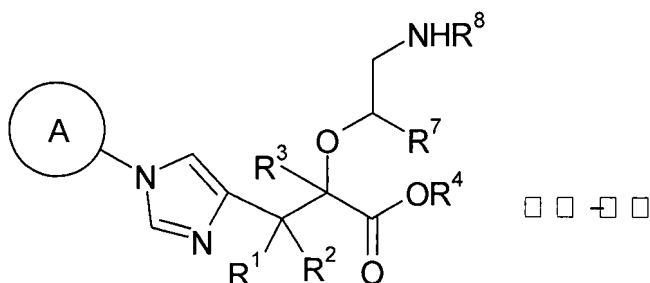
grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6; y R⁶ representa un átomo de hidrógeno; un grupo alcanilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxilo, un grupo carbamilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclico; un grupo alcoxycarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquylcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclicylalquylcarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

36.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 35 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; R¹, R² y R³ son un átomo de hidrógeno; R⁴ es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxycarbonil)oxi]etilo; R⁵ es un átomo de hidrógeno; y R⁶ es un átomo de hidrógeno, un grupo fenilalanilo, un grupo L-norleucilo, un grupo [(5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metoxi]carbonilo, un grupo [1-(isobutirilo)etoxi]carbonilo, un grupo [1-(2,2-dimetilpropanoilo)etoxi]carbonilo, un grupo ({1-[(ciclohexilcarbonil)oxi]etoxi}carbonilo) o un grupo (1-acetoxietoxi)carbonilo.

37.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 35 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por un grupo metilo o un grupo etilo; y R⁴, R⁵ y R⁶ son un átomo de hidrógeno.

38.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-2) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 12]



en donde A representa un grupo cicloalquilo de C3 a C12 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; R¹, R² y R³ representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo fluoro o un grupo alquilo de C1 a C6; R⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco; R⁷ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6; y R⁸ representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco.

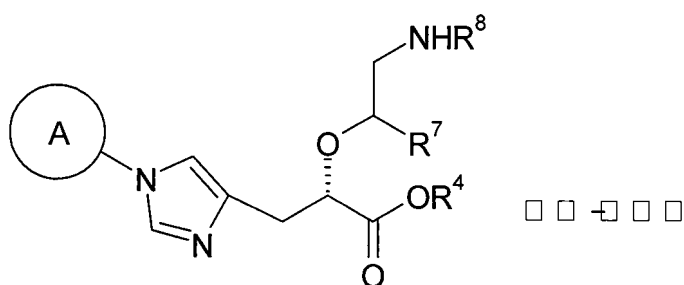
39.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 38 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; R¹, R² y R³ son un átomo de hidrógeno; R⁴ es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6; R⁷ es un átomo de hidrógeno; y R⁸ es un

átomo de hidrógeno; un grupo alcanilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcóxicarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquiloxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

40.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 38 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; R^1 , R^2 y R^3 son un átomo de hidrógeno; R^4 es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxycarbonil)oxi]etilo; y R^7 y R^8 son un átomo de hidrógeno.

41.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-2a) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 13]



en donde A representa un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos

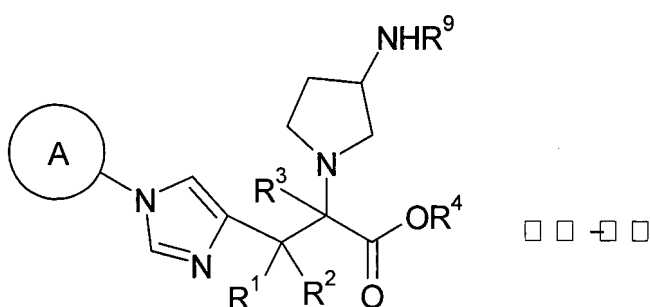
idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; R^4 representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6; R^7 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1 a C6 o un grupo alcoxi de C1 a C6; y R^8 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco.

42.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 41 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; R^1 , R^2 y R^3 son un átomo de hidrógeno; R^4 es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxicarbonil)oxi]etilo; R^7 es un átomo de hidrógeno; y R^8 es un átomo de hidrógeno; un grupo alcanilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxi, un grupo carbamilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcoxycarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquiloalcoxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

43.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 41 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por un grupo metilo o un grupo etilo; y R^4 , R^7 y R^8 son un átomo de hidrógeno.

44.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-3) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 14]



en donde A representa un grupo cicloalquilo de C3 a C12 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo fluoro, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; R^1 , R^2 y R^3 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo fluoro o un grupo alquilo de C1 a C6; R^4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco; y R^9 representa un átomo de hidrógeno o un grupo de profármaco.

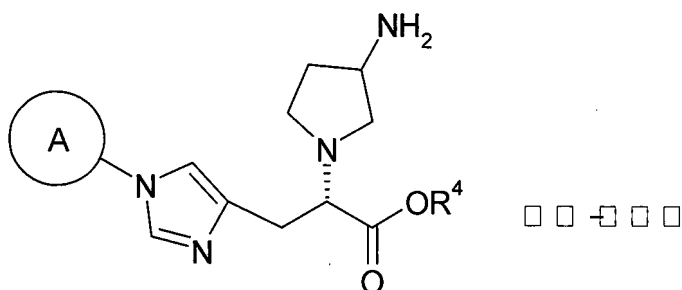
45.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 44 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; R^1 , R^2 y R^3 son un átomo de hidrógeno; R^4 es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes

seleccionados de un grupo alcanoiloxi de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6; y R⁹ es un átomo de hidrógeno; un grupo alcanoilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo amino, un grupo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo alcoxi de C1 a C6, un grupo arilo y un grupo heterociclilo; un grupo alcoxicarbonilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C1 a C6, un grupo alcanoiloxi de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo oxycarbonilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

46.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 44 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; R¹, R² y R³ son un átomo de hidrógeno; R⁴ es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxicarbonil)oxi]etilo; y R⁹ es un átomo de hidrógeno.

47.- Un compuesto representado por la fórmula general (I-3a) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

[Fórmula 15]



en donde A representa un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo biciclo[3.1.0]hexilo, un grupo biciclo[2.2.1]heptilo o un grupo adamantilo, cada uno de los cuales puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo hidroxilo, un grupo metilo y un grupo etilo; y R^4 representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1 a C6 el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo alcanilo de C2 a C6, un grupo cicloalquilcarbonilo de C3 a C6 y un grupo arilo; o un grupo heterociclilalquilo el cual puede ser sustituido por uno a tres grupos idénticos o diferentes seleccionados de un grupo oxo y un grupo alquilo de C1 a C6.

48.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 47 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por uno o dos grupos alquilo de C1 a C6 idénticos o diferentes; y R^4 es un átomo de hidrógeno, un grupo bencilo o un grupo [(isopropoxycarbonil)oxi]etilo.

49.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 48 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque A es un grupo ciclohexilo sustituido por un grupo metilo o un grupo etilo; y R^4 es un átomo de hidrógeno.

50.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, caracterizado además porque el compuesto se selecciona del grupo que consiste de: ácido 5-amino-2-[(1-

ciclohexil-1H-imidazol-4-il)metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(4-etilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(3-etilciclobutil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(3-metilciclobutil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-({1-[(1R,3s,5S)-biciclo[3.1.0]hexan-3-il]-1H-imidazol-4-il}metil)valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(4-hidroxiciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(4-hidroxi-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[[1-(3-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-amino-2-[(1-cicloheptil-1H-imidazol-4-il)metil}valérico, ácido 5-amino-2-({1-[exo-biciclo[2.2.1]hept-2-il]-1H-imidazol-4-il}metil)valérico, ácido 5-amino-2-({1-[endo-biciclo[2.2.1]hept-2-il]-1H-imidazol-4-il}metil)valérico, ácido 2-[(1-adamantan-2-il-1H-imidazol-4-il)metil]-5-aminovalérico, ácido 5-amino-2-[[1-(4-fenoxiciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, 5-amino-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerato de bencilo, ácido 2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]-5-(L-fenilalanilamino)valérico, ácido 2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]-5-(L-norleucilamino)valérico, ácido 2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]-5-({[(5-metil-2-oxo-1,3-dioxol-4-il)metoxi]carbonil}amino)valérico, ácido 5-({1-(isobutiriloxi)etoxi]carbonil}amino)-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, 5-({1-(isobutiriloxi)etoxi]carbonil}amino)-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerato de 1-[(isopropoxycarbonil)oxi]etilo, ácido 5-({1-(2,2-dimetilpropanoiloxi)etoxi]carbonil}amino)-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 5-({1-[(ciclohexilcarbonil)oxi]etoxi]carbonil}amino)-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil}valérico, ácido 2-(2-aminoetoxi)-3-[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]propiónico, ácido 2-[(1R)-2-amino-1-metiletoxi]-3-[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]propiónico y ácido 2-[(3S)-3-aminopirrolidin-1-il]-3-[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]propiónico.

51.- Ácido 5-amino-2-[[1-(4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico o una sal farmacológicamente aceptable del mismo.

52.- Ácido 5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico o una sal farmacológicamente aceptable del mismo.

53.- Ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico o una sal farmacológicamente aceptable del mismo.

54.- La sal farmacológicamente aceptable del compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 53, caracterizada además porque la sal farmacológicamente aceptable es p-toluensulfonato o bencensulfonato.

55.- Ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico.

56.- Bencensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico.

57.- P-toluensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico.

58.- Anhidrato de p-toluensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico.

59.- El anhidrato de p-toluensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico de conformidad con la reivindicación 58, caracterizado además porque está en forma cristalina exhibiendo picos principales a espaciamientos interplanares d de 23.9, 11.9, 4.5, 4.3 y 3.6 angstroms en la difracción de rayos X de polvos obtenida mediante radiación K α de cobre.

60.- Monohidrato de p-toluensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico.

61.- El monohidrato de p-toluensulfonato de ácido (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilciclohexil)-1H-imidazol-4-il]metil]valérico de conformidad con la reivindicación 60, caracterizado además porque está en forma cristalina exhibiendo picos principales a espaciamientos interplanares d de 22.9, 5.0, 4.9, 4.7 y 4.0 angstroms en la difracción de rayos X de polvos obtenida mediante radiación $K\alpha$ de cobre.

62.- Un fármaco farmacéutico que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

63.- Un inhibidor de TAFIa que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

64.- Un promotor de fibrinólisis que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

65.- Un fármaco preventivo o terapéutico para una enfermedad causada por la inhibición de la fibrinólisis, que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

66.- Una composición farmacéutica que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo y un vehículo farmacológicamente aceptable.

67.- Un fármaco farmacéutico para inyección que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

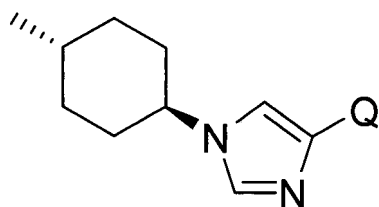
68.- Un inhibidor de TAFIa para inyección que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, como un ingrediente activo.

69.- Una composición farmacéutica para inyección que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo y un vehículo farmacológicamente aceptable.

70.- Una composición farmacéutica que contiene un compuesto como el que se reclama en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 61 o una sal farmacológicamente aceptable del mismo y uno o dos o más fármacos seleccionados de un anticoagulante, un fármaco antiplaquetario, una enzima relacionada con fibrinólisis, un fármaco anticáncer, un fármaco antiinflamatorio, un fármaco antifibrótico, un fármaco hipotensivo, un fármaco antihipertensión pulmonar y un fármaco inmunosupresor, como ingredientes activos.

71.- Un compuesto representado por la fórmula general siguiente o una sal del mismo:

[Fórmula 16]

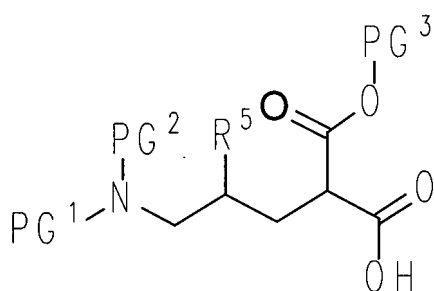


(A)

en donde Q representa un grupo COOR, un grupo hidroximetilo o un grupo formilo, y R representa un grupo alquilo de C1 a C6.

72.- Un compuesto representado por la fórmula general siguiente o una sal del mismo:

[Fórmula 17]

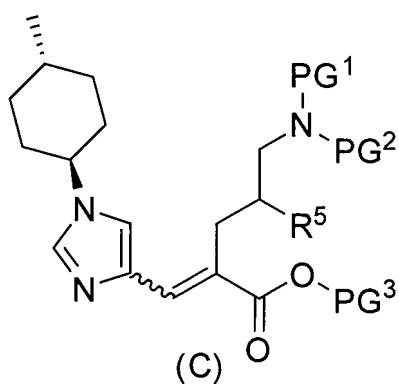


(B)

en donde R⁵ es como se definió anteriormente; PG¹ representa un grupo protector para el grupo amino; PG² representa un átomo de hidrógeno o un grupo protector para el grupo amino; y PG³ representa un grupo protector para el grupo carboxi.

73.- Un compuesto representado por la fórmula general siguiente o una sal del mismo:

[Fórmula 18]



(C)

en donde R⁵, PG¹, PG² y PG³ son como se definieron anteriormente.

Julio 13 de 2012 - 13:37:48