



No. 08-125263- -00011-0000

Fecha: 2013-05-30 16:14:51 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

icación

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 titular y/o solicitante

☐ Persona Natural

☒ Persona Jurídica

SANOFI-AVENTIS

Nombre o denominación /Razón Social completa (En caso de que haya más de un solicitante, relacionese en hoja adjunta)

Nombre del representante legal

Tipo de empresa ☐ Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra

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

Nacionalidad/Pais de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Francia	174 avenue de France, 75013	Paris
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico

☐ 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:

PATÍÑO BONNET MAURICIO

11.342.699

73583

Apellidos y Nombre

Documento de identificación

Tarjeta profesional

Dirección del representante	Ciudad	
Carrera 9 Número 74 – 08 Oficina 403	Bogotá D.C.	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
patmarks@prietocarrizosa.com	3268610	3268600

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 08 – 125263

Aparece _____

Debe ser _____

Modificación:

☒ Modificación al capítulo reivindicatorio.

Presento nuevo pliego reivindicatorio compuesto por cinco (5) reivindicaciones

☐ 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 solicitud No. **13 – 0052124**, Fecha: **29 de mayo de 2013**

☐ Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación.

☒ Documento que contiene las modificaciones o correcciones.

☐ Copia de la solicitud y sus anexos en medio magnético

6. Firma

Nombre y apellidos

MAURICIO PATIÑO BONNET

C.C. 11.342.699

Firma

Tarjeta Profesional: 73583

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

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0052124
		Bogotá D.C., Mayo 29 de 2013 - 15:22:10

RECIBIDO DE : PRIETO & CARRIZOSA S.A.					NI 800.240.450	
*** Soporte del Pago ***						
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO	
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	524735201	29/05/2013	845.000.00	

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION	125.000.00	125.000.00
				\$125.000.00
=====				

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

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

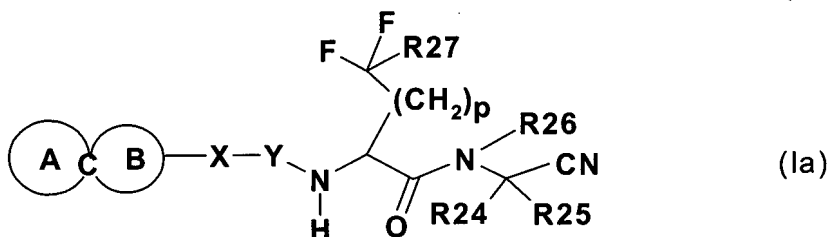
CLIENTE: SANOFI AVENTIS
Solicitud de modificación Ref. 71803/1
\$ 125.000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-125263- -00011-0000
Fecha: 2013-05-30 16:14:51 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

Reivindicaciones

1. Un compuesto de la fórmula la



y/ o todas las formas estereosoméricas del compuesto de fórmula la y/o mezclas de estas formas en cualquier proporción, y/o sales fisiológicamente toleradas del compuesto de la fórmula la, en donde

el radical es un compuesto espiro,

Los sub anillos y son cada uno de manera independiente seleccionados del grupo de azetidina, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1,3-dihidroisobenzofuran, 2,3-dihidroisoxazola, 2,5-dihidroisoxazola, 4,5-dihidroisoxazola, 1,3-dioxano, dioxolano, 1,3-dioxolano, imidazolidina, indano, morfolina, 1,3-oxazinano, oxazolidina, piperazina, piperidina, pirrolidina, tetrahidrofuran, y 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno, y en el cual los dos sub anillos son cada uno no sustituidos o de manera independiente, de acuerdo con el tamaño del anillo, -mono, -di, o -tri sustituido por R4

R4 es =O, =S, -(C₀-C₃)-alquilenos-C(O)-O-R10, -(C₀-C₃)-alquilenos-N(R21)-R22, -(C₀-C₃)-alquilenos-NH-C(O)-R21, -(C₀-C₄)-alquilenos-(C₃-C₆)-cicloalquilo-R23, -(C₀-C₃)-alquilenos-O-R10, -(C₀-C₄)-alquilenos-fenilo, en donde fenilo es no sustituido o de manera independiente -mono, -di, o -tri - sustituido por R8, o -(C₀-C₄)-alquilo en donde el alquilo es mono, -di, o -tri - sustituido de manera independiente por R9, R8 es flúor, cloro, bromo, -O-(C₁-C₃)-fluoroalquilo o -O-(C₁-C₄)-alquilo, R9 es halógeno, -NO₂, -CN, =O, -OH, CF₃, C(O)-O-R10, -C(O)-N(R21)-R22, -N(R21)-R22, -(C₃-C₈)-cicloalquilo, (C₀-C₃)-alquilenos-O-R10, -Si-(CH₃)₃, -N(R10)-S(O)_u-R10 en donde u es el entero 1 o 2, -S-R10, -SO_r-R10 en donde r es el entero 1 o 2, -S(O)_v-N(R10)-R20 en donde v es el entero 1 o 2, -C(O)-R10, -(C₁-C₈)-alquilo, -(C₁-C₈)-alcoxi, fenilo, feniloxi-, -(C₁-C₃)-fluoroalquilo, -O-R19, -NH-C(O)-NH-R10, -(C₀-C₄)-alquilo-C(O)-O-C(R11,R19)-O-C(O)-R12, -NH-C(O)-NH-R21, -N(R21)-C(O)-R22, -(C₀-C₄)-alquilo-C(O)-O-C(R11,R19)-O-C(O)-O-R12, -NH-C(O)-O-R10 o -O-CF₃.

R10 y R20 son los mismos o diferentes y cada uno es de manera independiente un átomo de hidrógeno o $-(C_1-C_6)$ -alquilo

R11 y R19 son los mismos o diferentes y cada uno es de manera independiente un átomo de hidrógeno o $-(C_1-C_6)$ -alquilo

R12 es $-(C_1-C_6)$ -alquilo, $-(C_1-C_6)$ -alquilo-OH, $-(C_1-C_6)$ -alquilo-O- (C_1-C_6) -alquilo, $-(C_3-C_8)$ -cicloalquilo, $-(C_1-C_6)$ -alquilo-O- (C_1-C_8) -alquilo- (C_3-C_8) -cicloalquilo, $-(C_1-C_6)$ -alquilo- (C_3-C_8) -cicloalquilo, en donde el radical ciclo alquilo, es no sustituido o de manera independiente –mono, -di, o -tri - sustituido por -OH, -O- (C_1-C_4) -alquilo o R10,

R21 y R22 son los mismos o diferentes y cada uno es de manera independiente un átomo de hidrógeno o $-(C_1-C_6)$ -alquilo, -O-R12, $-(C_0-C_6)$ -alquilenos- (C_3-C_8) -cicloalquilo, -SOt-R10 en donde t es el entero 1 o 2 o $-(C_1-C_3)$ -fluoroalquilo,

R23 es un átomo de hidrógeno OH o -O- (C_1-C_4) -alquilo,

X es un enlace covalente o -N(R7)- en donde

R7 es un átomo de hidrógeno o $-(C_1-C_4)$ -alquilo,

Y es -C(O)- o -S(O₂)-,

P es el entero 1 o 2

R26 es un átomo de hidrógeno

R27 es un átomo de hidrógeno, $-(C_0-C_4)$ -alquilenos- (C_3-C_6) -cicloalquilo, $-(C_1-C_6)$ -alquilo, $-(C_0-C_2)$ -alquilenos-fenil en donde fenil es no sustituido o sustituido por halógeno, $-(C_1-C_6)$ -alquilo, -O- (C_1-C_3) -fluoroalquilo o -O- (C_1-C_6) -alquilo, o $-(C_0-C_2)$ -alquilenos-piridilo,

R24 y R25 son los mismos o diferentes y cada uno es de manera independiente un átomo de hidrógeno, $-(C_1-C_4)$ -alquilo o $-(C_0-C_4)$ -alquilenos- (C_3-C_6) -cicloalquilo

R24 y R25, juntos con el átomo de carbono o al que están enlazados, forman un anillo ciclo alquilo el cual es seleccionado del grupo de ciclo propil, ciclo butil, ciclo pentil y ciclo hexil, y es no sustituido o –mono, -di, o -tri – sustituido de manera independiente por R10 o flúor,

R24 y R25 junto con el átomo de carbono al cual están enlazados, forman un radical heterociclo alquilo de tres a seis miembros seleccionado del grupo de aziridina, azetidina, diazetidina, diaziridina, hexohidropiridazina, hexohidropirimidina, imidazolidina, morfolina, oxdiazinano, oxadiazolidina, oxatiano, oxatolano, oxazetidina, oxazolidina, oxetano, oxirano, piperazina, piperidina, pirazolidina, pirrolidina, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, tetrahidrotiofeno, tetrahidrotiopirano, tetrazinano, tiadiazolidina, tiazetidina, tiaziridina, tiazolidina, tietano, tiirano, tiomorfolina, triazetidina, triazinano o triazolidina la cual es no sustituido o –mono, -di, o -tri - sustituido de manera independiente por R10 o flúor.

2. Un compuesto de la fórmula la como es reivindicó en la reivindicación 1 en

donde el sub anillo  es seleccionado de grupo de azetidina, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1,3-dihidroisobenzofuran, 1,3-dioxano, 1,3-dioxolano, imidazolidina, indano, morfolina, 1,3-oxazinano, piperazina, piperidina, pirrolidina, tetrahidrofuran, y 1,2,3,4-tetrahidronaftaleno,

el sub anillo  es seleccionado del grupo de azetidina, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, morfolina, oxazolidina, piperidina, y pirrolidina y en el cual los dos sub anillos son no sustituidos o de manera independiente, de acuerdo con el tamaño del anillo, -mono, -di, o -tri – sustituido por R4 en donde, R4 es -O-(C₁-C₄)-alquilo, =O, -(C₀-C₄)-alquileo-(C₃-C₆)-cicloalquilo, -(C₁-C₄)-alquilo o -(C₀-C₄)-alquileo-fenil, en donde fenil es no sustituido o sustituido por F, Cl, Br o -O-(C₁-C₄)-alquilo,

X es un enlace covalente o -NH-,

Y es -C(O)- o -S(O₂)-,

P es el entero 1,

R27 es un átomo de hidrógeno, -(C₁-C₆)-alquilo, 4-F-bencilo o bencilo,

R26 es un átomo de hidrógeno,

R24 y R25 son el mismo o diferentes y son cada uno de manera independiente un átomo de hidrógeno, metilo o etilo,

R24 y R25 junto con el átomo de carbono al cual ellos están enlazados forman un radical ciclopropilo o ciclobutilo o

R24 y R25 junto con el átomo de carbono al cual ellos están enlazados forman un anillo de piperidina el cual está no sustituido o sustituido por -(C₁-C₄)-alquilo.

3. Un compuesto de la fórmula la como es reivindicado en una o mas de la reivindicaciones 1 a 2 el cual es el compuesto

N-[(S)-1-{1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3- difluorobutilo]-3-azaspiro[5.5] undecano- 3-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3- difluorobutilo] -8-axaspiro[4.5] decano -8-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3- difluorobutilo] 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5] decano -8 -carboxamida.

N[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3- difluorobutilo] -2-azaspiro[5.5] undecano-2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorohexilo] -8- azaspiro[4.5] decano-8-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilecarbamoil) -3,3-difluorohexilo]-3-azaspiro[5.5] undecano-3-

carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3-difluorobutilo]-2-(4-metoxifenilo)-1-oxo-2,8-diazaspiro [4.5] decano -8- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3-difluorobutilo] -4-oxo-1 fenilo -1, 3, 8 tri-Azaspiro [4.5] decano -8- carboxamida,

N [(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3- difluorobutilo]- 1,5-dioxa -9 -aza -espiro [4.5] undecano -9 -carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutilo] -1 -oxo -2,8-Diazaspiro [4.5] decano -8 -carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3 -difluorobutilo] 2-metil - 1-oxo -2,8 -Diazaspiro [4.5] decano -8 -carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutilo] 3,3-dimetilo -1-oxa-5,9-Diazaspiro [4.5] undecano-9-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)- 3,3-difluoro- 4- fenilbutil] -8-Azaspiro [4.5] decano -8- carboxamida.

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)-3,3-difluorobutilo)-2,4-dioxo-1,3,8-Triazaspiro [4.5] decano-8- carboxamida.

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutilo)-2-azaspiro[4.4]nonano-2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3- difluorobutil)-2-benzil- 1- oxo -2,8-Diazaspiro [4.5] decano-3-carboxamida

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3- difluorobutil]-2-(4-fluorofenil)-1-oxo-2,8-diazaspiro[4.5] decano -8- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3- metil butil] -1,4- dioxaspiro [4.5] decano-8-Carboxamida

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutil] -3-fenil- 1.5-dioxa-9-Azaspiro [5.5] undecano-9-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) ciclohexilo] -8-azaspiro [4.5] decano -8-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)- ciclo hexil metil -8- azaspiro [4.5] decano- 8-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)3,3-difluoro butilo]-9-butilo-3,9-Diazaspiro [5.5]undecano- 3-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutilo]-9-ciclopropilo -3,9-Diazaspiro [5.5] undecano -3- carboxamida

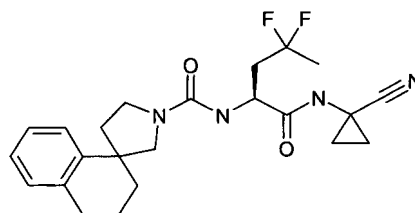
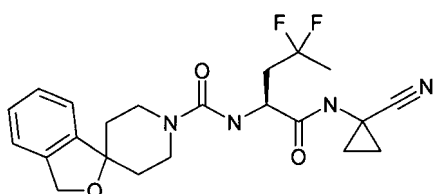
N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3-metil butilo] espiro [2.3] hexano-1-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluoro -4-fenilbutil]-8-azaspiro[4.5]decano -8-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutil] espiro [2.3] hexano-1-carboxamida,

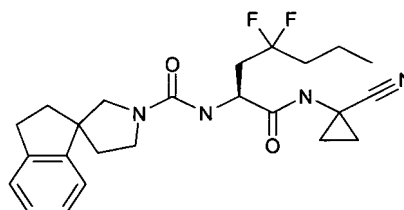
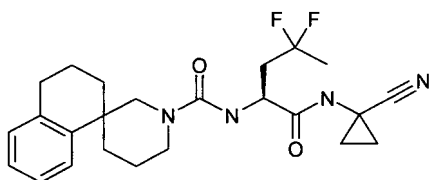
N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluoro butilo]-2,2- dimetilo-1-oxa-8-azaspiro[4.5] decano -8- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3,3-difluorobutil]-2-azaspiro [4.5] decano -2-Carboxamida



N-[(S)-1-(1-cianociclopropil - carbamoil) 3,3-difluorobutil]-1 -oxa-4-Azaspiro [4.5] decano -4- carboxamida,

N-(1-cianociclopropil)-(S)-2-[3-(1,4-dioxaspiro [4.5] dec -8-il) -ureido]-4,4-Difluoropentoxida



N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3.3-difluorobutil] -7 -cicloropilo-2, 7-diazaspiro[3.5] nonano-2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil 3.3-difluoro-butil)-2- cicloropilo -2, 7-diazaspiro[3.5] nonano-7 -carboxamida

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3, 3-difluorobutil]-2-propil-2, 7-diazaspiro[3.5] nonano-7 -carboxamida,

N-(1-cianociclopropil)-(S)-2-(8-azaspiro [4.5] decano-8-sulfonilamino)-4,4-difluoropentanamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3,3-difluorobutil]-4-ciclopropil-1-oxa-4,9-diazaspiro[5.5] undecano -9- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3- difluorobutilo] -9- ciclopropil-1 -oxa-4,9-diazaspiro[5.5] undecano -4- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3.3-difluorobutilo] -2-ciclopropil metilo - 3 -oxo 2.8-diazaspiro[4.5] decano- 8- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3,3-difluorohexilo]-2-(4-metoxifenil)-1-oxo-2,8 -diazaspiro[4.5] decano-8- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3,3- difluorohexilo] 2-(4-metoxifenil)-2,8-diazaspiro[4.5] decano -8 -carboxamida.

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) 3,3-difluorohexilo] -2-ciclopropilo-2,7-Diazaspiro [3.5] nonano-7 -carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil)) -3.3-difluorohexilo]-2-ciclopropilo-2,8-diazaspiro[4.5] decano-8 - carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3- difluorohexilo] -9- ciclopropilo -3,9-diazaspiro [4.5] undecano-3- carboxamida

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3- difluoro hexilo]-7-ciclopropil -2,7 -diazaspiro[3.5]nonano.2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3- difluorohexilo]-7 -propilo -2, 7-diazaspiro [3.5] nonano -2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro -4-fenilbutilo]-9-ciclopropilo-3,9-Diazaspiro [5.5] undecano -3- carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro-4-fenilbutilo]-2 -ciclopropilo- 2,7-diazaspiro [3.5] nonano -7 -carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro -4-fenilbutilo]-2-propilo-2,7-diazaspiro[3.5] nonano- 7-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro -4-fenilbutilo]- 7 ciclopropilo- 2,7-diazaspiro[3.5] nonano- 2-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluorobutilo]- 6 -azaspiro[2.5] octano- 6-carboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianometilcarbamoil) -3.3-difluoro butilo]- 6 azaspiro [2.5] octano- 8-calboxamida,

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro hexilo]- 6 -azaspiro[2.5] octano- 6-calboxamida,

N-[(S)-1-(4-ciano-1-metilpiperidin -4-ilcarbamoil) 3,3-difluorobutilo] -6-azaspiro[2.5] octano -6- carboxamida,

N-[(S)-1-(4-ciano-1-metilpiperidin -4-ilcarbamoil) 3,3-difluoro hexilo] -6-azaspiro[2.5] octano -6- carboxamida,

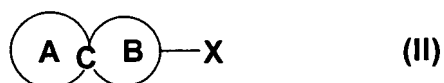
N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoropentilo]-6-azaspiro[2.5] octano- 6-carboxamida, o

N-[(S)-1-(1-cianociclopropilcarbamoil) -3.3-difluoro -4-fenilbutilo]-6-azaspiro[2.5] octano- 6-carboxamida.

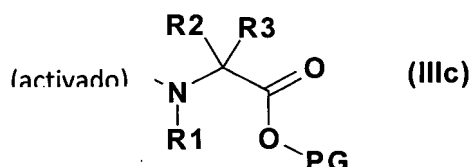
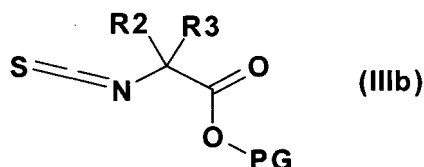
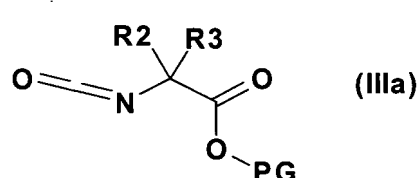
4. Un proceso para preparar el compuesto de la fórmula la y/o una forma estereoisomérica del compuesto de la fórmula la y/o una sal fisiológicamente

compatible del compuesto de la fórmula la y/o un N-óxido del compuesto de la fórmula la, conforme cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, la cual comprende:

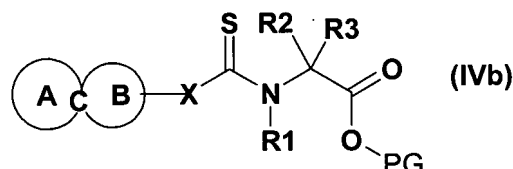
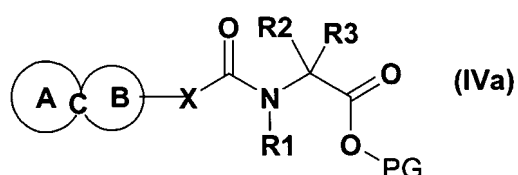
a) Reaccionar un compuesto de la fórmula II



En donde A y B son cada uno son como está definido en el compuesto de la fórmula la con un compuesto de fórmula IIIa o IIIb o IIIc

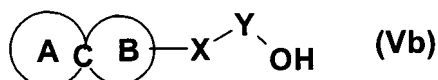
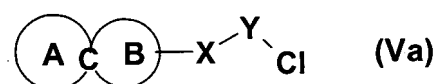


En donde X, R1, R2 y R3 son cada uno como está definido en el compuesto de la fórmula la, PG es un grupo éster protector y "activado" significa que la amina está presente en su forma activada, por ejemplo como un compuesto clorocarbonilo, para dar un compuesto de la fórmula IVa o IVb

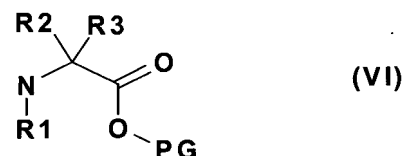


Y reaccionar el compuesto resultante de la fórmula IVa o IVb, después de convertir el éster en ácido carboxílico, con $-\text{N}(\text{R}_{26})-(\text{C}(\text{R}_{24})(\text{R}_{25}))_m\text{-CN}$, en donde m es el número entero 1, para dar el compuesto de la fórmula la, o

b) Reaccionar el compuesto de la fórmula Va o Vb en donde A, B, X y Y son cada uno como está definido en el compuesto de la fórmula la



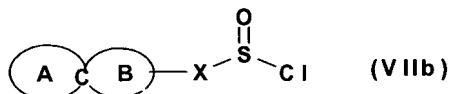
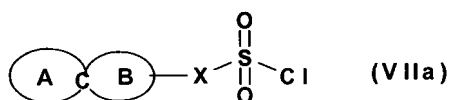
Con el compuesto de la fórmula VI en donde R1, R2 y R3 son cada uno como está definido en el compuesto de la fórmula la y PG es un grupo éster protector



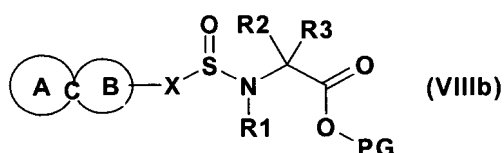
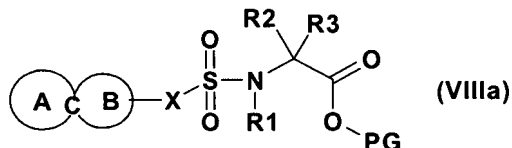
Para dar un compuesto de la fórmula IVa o IVb, y reaccionar el compuesto resultante de la fórmula IVa o IVb, después convertir el grupo éster protector en un ácido

carboxílico, con $-N(R_{26})-(C(R_{24})(R_{25}))_m-CN$, en donde m es el número entero 1, para dar el compuesto de la fórmula Ia o

c) Reaccionar el compuesto de la fórmula VIIa o VIIb en donde A, B y X son cada uno como está definido en el compuesto de la fórmula Ia

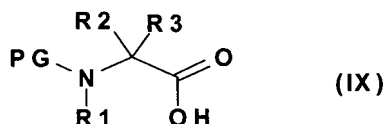


Con un compuesto de la fórmula VI

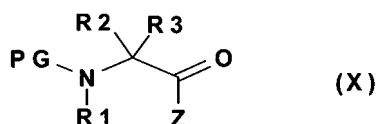


Para dar un compuesto de la fórmula VIIIa o VIIIb y reaccionar el compuesto resultante de la fórmula VIIIa o VIIIb, después convirtiendo el éster al correspondiente ácido carboxílico, con $-N(R_{26})-(C(R_{24})(R_{25}))_m-CN$, en donde m es el número entero 1, para dar el compuesto de la fórmula Ia, o

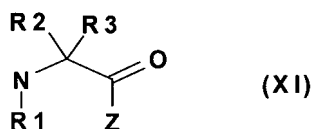
d) Reaccionar el compuesto de la fórmula IX



Con una amina $-N(R_{26})-(C(R_{24})(R_{25}))_m-CN$, en donde m es el número entero 1, para dar un compuesto de la fórmula X



Y luego convirtiendo el compuesto X así obtenido en un grupo protector eliminación para dar un compuesto de fórmula XI



Y luego reaccionar este compuesto XI con un compuesto Va o Vb, como está detallado bajo el literal b), para dar el compuesto de la fórmula Ia, o

e) separar el compuesto de la fórmula Ia preparada por los procesos a), b), c), o d) o por un precursor adecuado de la fórmula Ia, la cual, debido a su estructura química, ocurre en formas enantiomérica o diastereomérica, dentro de puros enantiómeros o diastereómeros por la formación de sal con sales enantiomericamente puras o bases, cromatografía en fases estacionarias quirales o derivatización por medios de compuestos quirales enantiomericamente puros tales como amino ácidos, separando el diastereomero así obtenido, y eliminado los grupos quirales auxiliares, o

f) ya sea aislar el compuesto de la fórmula la preparado por el proceso a), b), c) o d) en forma libre o liberándolo de las sales fisiológicamente incompatibles o, en el caso de la presencia de grupos ácidos o básicos, convirtiéndolo en sales fisiológicamente aceptables, o

g) convertir el compuesto de la fórmula la preparada por los procesos a), b), c) o d) o un precursor adecuado de la fórmula la, el cual debido a su estructura química es capaz de formar un N-óxido o, en el caso de la presencia de un N-óxido, convertirlo en una amina libre o la sal de una amina.

5. Composición caracterizada por un compuesto de la fórmula la conforme cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 junto con un portador farmacéuticamente aceptable y fisiológicamente compatible, un aditivo y/u otros ingredientes activos y/o excipientes.