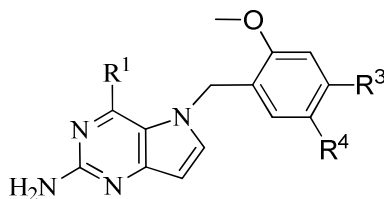


REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la estructura de la fórmula (I), o una sal farmacéutica del mismo:

5



Fórmula (I)

10

en donde:

R^1 es $-NHR^6$ o $-NHCHR^6R^9$;

R^3 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$,
15 $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$ o tetrazolilo;

R^4 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$,
 $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$ o tetrazolilo;

en donde, cuando R^3 es H, entonces R^4 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$ o tetrazolilo;

o cuando R^4 es H, entonces R^3 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$ o
25 $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$ o

tetrazolilo;

L_1 es $-(CH_2)_m-$;

L_2 es $-(CH_2)_m-$;

$L_7 = -(CH_2)_m(CHR^{11}CH_2)_m(CH_2)_n-$;

5 R^6 es -alquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R^7 es -alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;

R^9 es L_1OH ;

cada R^{11} se selecciona independientemente a partir de
-OH;

10 R^{12} es:

d) un tetrazolilo insustituido;

e) un tetrazolilo sustituido con $-L_1C(=O)OH$;

o

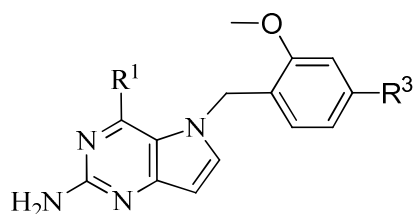
f) un heterocicloalquilo de 5 a 6 miembros que tiene
15 de 1 a 2 heteroátomos independientemente seleccionados a partir de
N y O sustituido con $-C(=O)OH$;

cada m se selecciona independientemente a partir de 1,
2, 3, y 4,

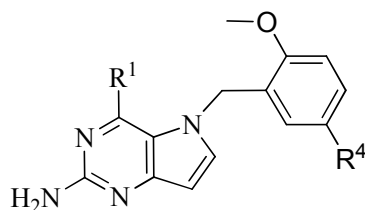
y

20 cada n se selecciona independientemente a partir de 0, 1,
2, 3, y 4.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el
compuesto de la fórmula (I) es un compuesto de la fórmula (Ia) o de
25 la fórmula (Ib):



Fórmula (Ia)



Fórmula (Ib).

5

3. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación 2, en donde:

R^1 es $-NHR^6$ o $-NHCHR^6R^9$;

R^3 es H, $-OL_2C(=O)OH$ o tetrazolilo;

10

R^4 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$ o tetrazolilo;

15

en donde, cuando R^3 es H, entonces R^4 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$ o tetrazolilo;

o cuando R^4 es H, entonces R^3 es $-OL_2C(=O)OH$ o tetrazolilo;

L_1 es $-(CH_2)_m-$;

20

L_2 es $-(CH_2)_m-$;

$L_7 = -(CH_2)_m(CHR^{11}CH_2)_m(CH_2)_n-$;

R^6 es -alquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R^7 es -alquilo de 1 a 3 átomos de carbono; metil

R^9 es L_1OH ;

25

cada R^{11} se selecciona independientemente a partir de

-OH;

R^{12} es:

d) un tetrazolilo insustituido;

e) un tetrazolilo sustituido con $-L_1C(=O)OH$;

5

o

f) un heterocicloalquilo de 5 a 6 miembros que tiene

de 1 a 2 heteroátomos independientemente seleccionados a partir de N y O sustituido con $-C(=O)OH$;

cada m se selecciona independientemente a partir de 1,

10 2, 3, y 4,

y

cada n se selecciona independientemente a partir de 0, 1,

2, 3, y 4.

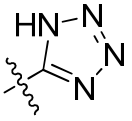
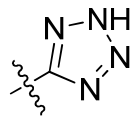
4. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación

15 2, en donde:

R^1 es $-NHR^6$ o $-NHCHR^6R^9$;

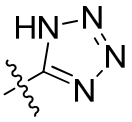
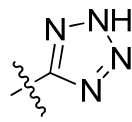
R^3 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$,

20

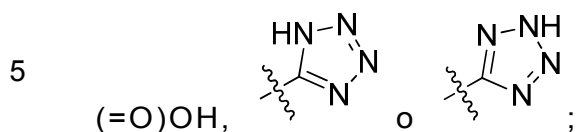
$-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$,  o  ; I;

R^4 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$,

25

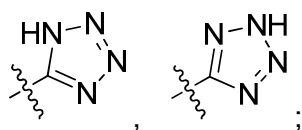
$-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$,  o  ;

en donde, cuando R^3 es H, entonces R^4 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C$



o cuando R^4 es H, entonces R^3 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$, $-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$, $-OL_2C(=O)OH$,

10



L_1 es $-(CH_2)_m-$;

15

L_2 es $-(CH_2)_m-$;

$L_7 = -(CH_2)_m(CHR^{11}CH_2)_m(CH_2)_n-$;

R^6 es -alquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R^7 es -alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;

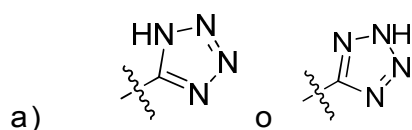
R^9 es L_1OH ;

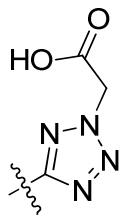
20

cada R^{11} se selecciona independientemente a partir de $-OH$;

R^{12} es:

25

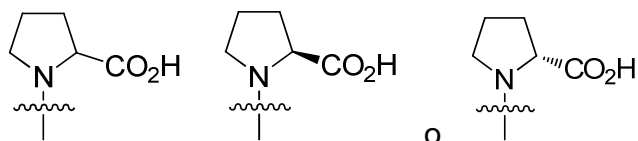




b)

o

5



c)

o

cada m se selecciona independientemente a partir de 1,

10 2, 3, y 4,

y

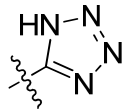
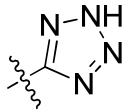
cada n se selecciona independientemente a partir de 0, 1,

2, 3, y 4.

5. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación

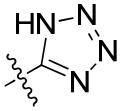
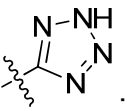
15 2, en donde:

R^1 es $-NHR^6$ o $-NHCHR^6R^9$;

R^3 es H, $-OL_2C(=O)OH$,  o ; I;

20

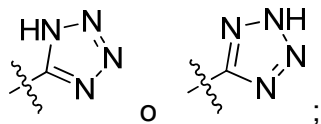
R^4 es H, $-L_2R^{12}$, $-OL_2R^{12}$, $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)OH$, $-CH=CHC(=O)OH$, $-C(=O)OH$,

$-L_2C(=O)OH$, $-L_7C(=O)OH$,  o ;

en donde, cuando R^3 es H, entonces R^4 es $-L_2R^{12}$, $-OL_2$

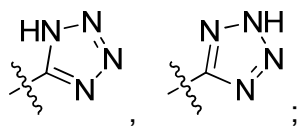
25 R^{12} , $-C(CH_3)_2R^{12}$, $-P(=O)(OH)_2$, $-P(=O)OH(OR^7)$, $-CF_2R^{12}$, $-CF_2C(=O)$

OH, $-\text{CH}=\text{CHC}(=\text{O})\text{OH}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$, $-\text{L}_2\text{C}(=\text{O})\text{OH}$, $-\text{L}_7\text{C}(=\text{O})\text{OH}$,



5

o cuando R^4 es H, entonces R^3 es $-\text{OL}_2\text{C}(=\text{O})\text{OH}$,



10

L_1 es $-(\text{CH}_2)_m-$;

L_2 es $-(\text{CH}_2)_m-$;

$\text{L}_7 = -(\text{CH}_2)_m(\text{CHR}^{11}\text{CH}_2)_m(\text{CH}_2)_n-$;

R^6 es -alquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R^7 es -alquilo de 1 a 3 átomos de carbono;

15

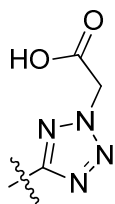
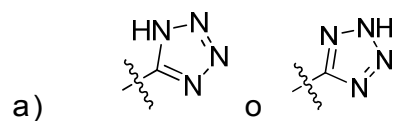
R^9 es L_1OH ;

cada R^{11} se selecciona independientemente a partir de

-OH;

R^{12} es:

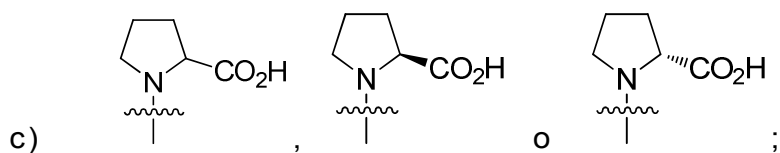
20



25

b)

o



cada m se selecciona independientemente a partir de 1,

5

2, 3, y 4,

y

cada n se selecciona independientemente a partir de 0, 1,

2, 3, y 4.

10

6. El compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5,
en donde:

L_1 es $-\text{CH}_2-$;

L_2 es $-\text{CH}_2-$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

$L_7 = -(\text{CH}_2)_2(\text{CHR}^{11}\text{CH}_2)_2-$;

15

R^6 es -alquilo de 4 átomos de carbono o -alquilo de 5
átomos de carbono;

R^7 es metilo, etilo, o propilo,

y

R^{11} es OH.

20

7. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación
2, en donde:

R^1 es $-\text{NHR}^6$;

R^3 es H;

R^4 es $-\text{L}_2\text{R}^{12}$;

25

L_2 es $-(\text{CH}_2)_m-$;

R^6 es -alquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R^{12} es:

d) un tetrazolilo insustituido;

5 e) un tetrazolilo sustituido con $-L_1C(=O)OH$;

o

f) un heterocicloalquilo de 5 a 6 miembros que tiene de 1 a 2 heteroátomos independientemente seleccionados a partir de N y O sustituido con $-C(=O)OH$,

10 y

cada m se selecciona independientemente a partir de 1, 2, 3, y 4.

8. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación
15 2, en donde:

R^1 es $-NHR^6$;

R^3 es H;

R^4 es $-L_2R^{12}$;

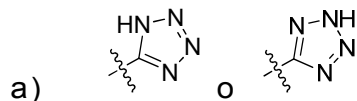
L_2 es $-CH_2-$ o $-CH_2CH_2-$;

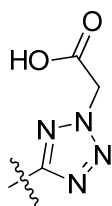
20 R^6 es -alquilo de 5 átomos de carbono;

y

R^{12} es:

25

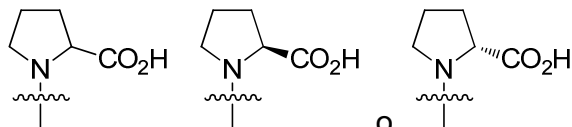




b)

o

5



c)

o

9. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación 2, en donde:

10 R^1 es $-NHR^6$;

R^3 es H;

R^4 es $-L_2R^{12}$;

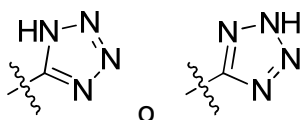
L_2 es $-\text{CH}_2-$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

R^6 es -alquilo de 5 átomos de carbono;

15

y

R^{12} es:

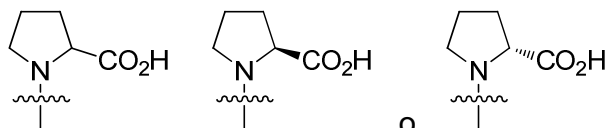


a)

o

o

20



b)

o

10. El compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación 2, en donde:

25 R^1 es $-NHR^6$;

R^3 es H;

R^4 es $-L_2C(=O)OH$;

L_2 es $-CH_2-$ o $-CH_2CH_2-$;

y

5 R^6 es -alquilo de 5 átomos de carbono.

11. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto se selecciona a partir de:

5-(5-((1H-tetrazol-5-il)-metoxi)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

10 5-(5-((1H-tetrazol-5-il)-metil)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

(S)-2-((5-(5-((1H-tetrazol-5-il)-metil)-2-metoxi-bencil)-2-amino-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-4-il)-amino)-hexan-1-ol;

15 (S)-2-((5-(5-((1H-tetrazol-5-il)-metil)-2-metoxi-bencil)-2-amino-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-4-il)-amino)-pentan-1-ol;

5-(5-(2-(1H-tetrazol-5-il)-etil)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

N4-hexil-5-(2-metoxi-5-(1H-tetrazol-5-il)-bencil)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

20 (S)-2-((2-amino-5-(2-metoxi-5-(1H-tetrazol-5-il)-bencil)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-4-il)-amino)-hexan-1-ol;

ácido 2-(5-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-bencil)-2H-tetrazol-2-il)-acético;

25 5-(2-metoxi-4-(1H-tetrazol-5-il)-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

5-(2-metoxi-5-(1H-tetrazol-5-il)-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

5-(5-(2-(1H-tetrazol-5-il)-propan-2-il)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

5 (S)-2-((5-(5-(2-(1H-tetrazol-5-il)-propan-2-il)-2-metoxi-bencil)-2-amino-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-4-il)-amino)-hexan-1-ol;

5-(5-(difluoro(1H-tetrazol-5-il)-metil)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

10 ácido 2-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-2,2-difluoro-acético;

(3R,5R)-ácido 7-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-3,5-dihidroxi-heptanoico;

ácido 2-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-acético;

15 (S)-ácido 2-(3-((2-amino-4-((1-hidroxi-hexan-2-il)-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-acético;

ácido 3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-benzoico;

20 ácido (3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-fosfónico;

(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-fosfonato ácido de metilo;

(E)-ácido 3-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-acrílico;

25 ácido 3-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-

pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-propanoico;

(S)-ácido 3-(3-((2-amino-4-((1-hidroxi-hexan-2-il)-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-propanoico;

(S)-ácido 1-(4-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-3-metoxi-bencil)-pirrolidin-2-carboxílico;

(R)-ácido 1-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-bencil)-pirrolidin-2-carboxílico, y

ácido 2-(4-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-3-metoxi-fenoxi)-acético.

12. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto se selecciona a partir de:

ácido 2-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-fenil)-acético;

ácido 3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-benzoico;

5-(5-((1H-tetrazol-5-il)-metil)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

5-(5-(2-(1H-tetrazol-5-il)-etil)-2-metoxi-bencil)-N4-pentil-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-2,4-diamina;

(S)-ácido 1-(4-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-3-metoxi-bencil)-pirrolidin-2-carboxílico, y

(R)-ácido 1-(3-((2-amino-4-(pentil-amino)-5H-pirrolo-[3,2-d]-pirimidin-5-il)-metil)-4-metoxi-bencil)-pirrolidin-2-carboxílico.

13. Una composición farmacéutica, la cual comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de cualquiera

de las reivindicaciones 1 a 12, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

14. El uso de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en la elaboración de un medicamento para el
5 tratamiento de una enfermedad o de un trastorno asociado con la actividad de TLR7.

15. El uso de la reivindicación 14, en donde la enfermedad es una enfermedad infecciosa, una enfermedad infecciosa viral, una enfermedad inflamatoria, una enfermedad respiratoria, una
10 enfermedad dermatológica, una enfermedad autoinmune, una enfermedad proliferativa celular o cáncer.

16. El uso de la reivindicación 14, en donde la enfermedad o condición es asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), síndrome de insuficiencia respiratoria de adultos (ARDS),
15 colitis ulcerativa, enfermedad de Crohn, bronquitis, dermatitis, queratosis actínica, carcinoma de células basales, cáncer de vejiga, rinitis alérgica, soriasis, esclerodermia, urticaria, artritis reumatoide, esclerosis múltiple, cáncer, cáncer de mama, VIH, hepatitis, hepatitis C o lupus.

20 17. El método de la reivindicación 14, en donde la enfermedad o condición es hepatitis B, hepatitis C, cáncer colo-rectal o carcinoma hepatocelular.

18. Un método para el tratamiento de una enfermedad o de un trastorno asociado con la actividad de TLR7, en donde el método
25 comprende administrar a un sistema o a un sujeto que necesite dicho

tratamiento, una cantidad efectiva de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12.

19. El método de la reivindicación 18, en donde la enfermedad es una enfermedad infecciosa, una enfermedad
5 infecciosa viral, una enfermedad inflamatoria, una enfermedad respiratoria, una enfermedad dermatológica, una enfermedad autoinmune, una enfermedad proliferativa celular o cáncer.

20. El método de la reivindicación 18, en donde la enfermedad o condición es asma, enfermedad pulmonar obstructiva
10 crónica (COPD), síndrome de insuficiencia respiratoria de adultos (ARDS), colitis ulcerativa, enfermedad de Crohn, bronquitis, dermatitis, queratosis actínica, carcinoma de células basales, cáncer de vejiga, rinitis alérgica, soriasis, esclerodermia, urticaria, artritis reumatoide, esclerosis múltiple, cáncer, cáncer de mama, VIH,
15 hepatitis, hepatitis C o lupus.

21. El método de la reivindicación 18, en donde la enfermedad o condición es hepatitis B, hepatitis C, cáncer colo-rectal o carcinoma hepatocelular.

22. Un compuesto para utilizarse en un método de
20 tratamiento médico, en donde el método de tratamiento médico es para el tratamiento de una enfermedad asociada con la actividad del receptor TLR7, en donde la enfermedad es una enfermedad infecciosa, una enfermedad infecciosa viral, una enfermedad inflamatoria, una enfermedad respiratoria, una enfermedad
25 dermatológica, una enfermedad autoinmune, una enfermedad

proliferativa celular o cáncer, y en donde el compuesto es un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12.

23. El compuesto de la reivindicación 22, en donde la enfermedad es asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), síndrome de insuficiencia respiratoria de adultos (ARDS), colitis ulcerativa, enfermedad de Crohn, bronquitis, dermatitis, queratosis actínica, carcinoma de células basales, cáncer de vejiga, rinitis alérgica, soriasis, esclerodermia, urticaria, artritis reumatoide, esclerosis múltiple, cáncer, cáncer de mama, VIH, hepatitis, hepatitis C o lupus.

24. El compuesto de la reivindicación 22, en donde la enfermedad o condición es hepatitis B, hepatitis C, cáncer colo-rectal o carcinoma hepatocelular.

15

20

25