

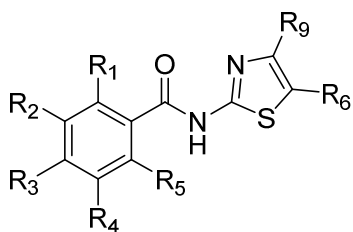
NOVEDAD DE LA INVENCION

Habiendo descrito la presente invención, se considera como novedad, y por lo tanto se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

5

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por:



10

(I),

caracterizado porque R₁ hasta R₅ son, independientemente, seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, CN, NO₂, F, Cl, Br, I, hidroxil, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilalqueno, cicloalquilalquino, cicloalqueno, cicloalquenalquilo, cicloalquenalqueno, cicloalquenalquino, alcoxil, alquenoiloxil, alquinoiloxil, alcoxialquilo, alcoxialqueno, alcoxialquino, alquenoiloxialquilo, alquenoiloxialqueno, alquenoiloxialquino, alquinoiloxialquilo, alquenoiloxialqueno, alquenoiloxialquino, cicloalcoxil, cicloalquilalcoxil, cicloalquilalquenoiloxil, cicloalquilalquinoiloxil, cicloalquenoiloxil, cicloalquenalcoxil, cicloalquenalquenoiloxil, cicloalquenalquinoiloxil, alcoxialquilamino, hidroxialquilo,

15

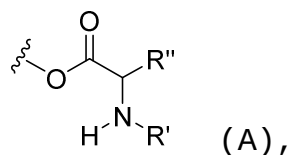
20

acilo, aciloxi, aroiloxi, arilalcanoiloxi, arilalquenoiloxi,
 heteroaroiloxi, heteroarilalcanoiloxi,
 heteroarilalquenoiloxi, alcoxycarbonilo, ariloxycarbonilo,
 arilalcoxycarbonilo, heteroariloxycarbonilo,
 5 heteroarilalcoxycarbonilo, alcoxycarboniloxi, carbamoilo,
 carbamoiloxi, alquylamino, dialquylamino, alquylaminoalquilo,
 amido, alquylamido, dialquylamido, haloalquilo,
 perhaloalquilo, perhaloalcoxi, alquiltio, alquiltioalquilo,
 alquilsulfonilo, alquilsulfonilalquilo, alquenilsulfonilo,
 10 alquinilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo,
 cicloalquylalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilalquilo,
 cicloalquylalquilsulfonilalquilo, arilsulfonilo,
 arilalquilsulfonilo, arilalquenilsulfonilo,
 heteroarilsulfonilo, heteroarilalquilsulfonilo,
 15 heteroarilalquenilsulfonilo, alquilsulfonamido, N,N'-
 dialquilsulfonamido, sulfonamidoalquilo, sulfonamidoarilo,
 sulfonamidoarilalquilo, sulfonamidoarilalquenilo, arilo,
 arilalquilo, ariloxi, arilalcoxi, ariltio, arilalquiltio,
 arilamino, arilalquylamino, arilalquenilo, arilalquinilo,
 20 heteroarilo, heteroarilalquilo, heteroarilalquenilo,
 heteroarilalquinilo, heteroariloxi, heteroarilalcoxi,
 heteroarilamino, heteroarilalquylamino, heteroariltio,
 heteroarilalquiltio, heteroarilalquylamino,
 heterocicloalquilo, heterocicloalquenilo, heterocicloalcoxi,

y heterocicloalqueniloxi, cualquiera de los cuales puede estar opcionalmente sustituido,

y donde cada uno de R_1 hasta R_5 comprende 1 hasta 60 átomos;

5 siempre que al menos uno de R_1 hasta R_5 es un aminoácido está seleccionado del grupo que consiste de alanina, arginina, asparagina, ácido aspártico, cisteína, glutamina, ácido glutámico, glicina, histidina, isoleucina, leucina, lisina, metionina, fenilalanina, prolina, serina, treonina,
 10 triptofano, tirosina, y valina, o una porción representada por la Fórmula A:



15 en donde R' está seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo, y un grupo protector de nitrógeno;

R'' está seleccionado del grupo que consiste de alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilalquenilo, cicloalquilalquinilo, cicloalquenilo, cicloalquenilalquilo, cicloalquenilalquenilo,
 20 cicloalquenilalquinilo;

uno de R_6 y R_9 está seleccionado del grupo que consiste de NO_2 , F, Cl, Br, $-\text{SO}_2$ -alquilo(C_1 - C_{10}), $-\text{SO}$ -alquilo(C_1 - C_{10}), haloalquilo, perhaloalquilo, haloalcoxi, perhaloalcoxi,

$S(O)_mC(R_7R_8)_nCF_3$, y $C(R_7R_8)_nCF_3$; y el otro de R_6 y R_9 que no está seleccionado del grupo, es hidrógeno;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la
 5 misma, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado
 porque R_6 está seleccionado del grupo que consiste de NO_2 , F,
 Cl, Br, $-SO_2$ -alquilo(C_1-C_{10}), $-SO$ -alquilo(C_1-C_{10}), haloalquilo,
 perhaloalquilo, haloalcoxi, perhaloalcoxi, $S(O)_mC(R_7R_8)_nCF_3$, y
 $C(R_7R_8)_nCF_3$, y R_9 es hidrógeno, o en donde R_9 está seleccionado
 10 del grupo que consiste de NO_2 , F, Cl, Br, $-SO_2$ -alquilo(C_1-C_{10}),
 $-SO$ -alquilo(C_1-C_{10}), haloalquilo, perhaloalquilo, haloalcoxi,
 perhaloalcoxi, $S(O)_mC(R_7R_8)_nCF_3$, y $C(R_7R_8)_nCF_3$, y R_6 es
 hidrógeno.

3. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la
 15 misma, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado
 porque R_6 está seleccionado del grupo que consiste de NO_2 , F,
 Cl, Br, $-SO_2$ -alquilo(C_1-C_{10}), y $-SO$ -alquilo(C_1-C_{10}), y R_9 es
 hidrógeno, o en donde R_9 está seleccionado del grupo que
 consiste de NO_2 , F, Cl, Br, $-SO_2$ -alquilo(C_1-C_{10}), y $-SO$ -
 20 alquilo(C_1-C_{10}), y R_6 es hidrógeno.

4. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la
 misma, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado
 porque R_6 está seleccionado del grupo que consiste de NO_2 y
 Cl, y R_9 es hidrógeno, o en donde R_9 está seleccionado del

grupo que consiste de NO_2 y Cl , y R_6 es hidrógeno.

5. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R_9 es
5 hidrógeno.

6. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R_6 es hidrógeno.

10 7. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R' está seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno y un grupo protector de nitrógeno, y R'' es una de cadena recta, cadena
15 ramificada, o cíclica no saturada porción alquilo($\text{C}_1\text{-C}_{10}$).

8. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R'' es una de cadena recta o cadena ramificada porción alquilo($\text{C}_1\text{-C}_5$).

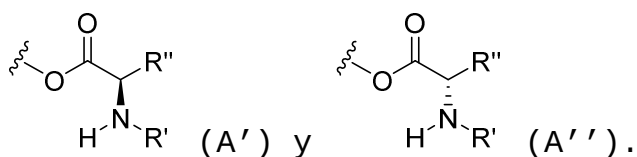
20 9. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R'' es una porción alquilo($\text{C}_1\text{-C}_3$).

10. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de

la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R'' es una porción alquilo C₃₋₄, o una porción t-Bu, n-Bu o s-Bu.

11. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R' es hidrógeno.

12. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque la Fórmula A es una porción seleccionada de



13. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque uno de R₁ hasta R₃ es una porción representada por la Fórmula A, y el resto de R₁ hasta R₅ son hidrógeno.

14. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R₁ es una porción representada por la Fórmula A, y R₂ hasta R₅ son hidrógeno.

15. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R_2 es una porción representada por la Fórmula A, y R_1 y R_3 hasta R_5 son
5 hidrógeno.

16. El compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque R_3 es una porción representada por la Fórmula A, y R_1 , R_2 , R_4 y R_5 son
10 hidrógeno.

17. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto, o sal farmacéuticamente aceptable de la misma, de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes, y un excipiente
15 farmacéuticamente aceptable.

18. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 17, caracterizada porque está en la forma de una forma de dosificación oral sólida.

19. La composición farmacéutica de conformidad con la
20 reivindicación 18, caracterizada porque la forma de dosificación oral sólida es un comprimido.

20. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada porque la forma de dosificación oral sólida es una cápsula.

21. La composición farmacéutica de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones de composición precedentes, caracterizada porque la composición farmacéutica es en la forma de una forma de dosificación oral sólida que
5 comprende:

- (a) una primera porción que comprende una primera cantidad de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-16, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, en una formulación de liberación controlada; y
- 10 (b) una segunda porción que comprende una segunda cantidad de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-16, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, en una formulación de liberación inmediata.

22. La composición farmacéutica de conformidad con
15 cualesquiera de las reivindicaciones de composición precedentes, caracterizada porque la composición farmacéutica está en la forma de una forma de dosificación oral sólida que comprende una cantidad de un compuesto de cualquiera de reivindicaciones 1-16 o una sal farmacéuticamente aceptable
20 de la misma, en una formulación de liberación controlada.

23. La composición farmacéutica de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones de composición precedentes, caracterizada porque la composición farmacéutica comprende uno o más diluyentes, desintegrantes, aglutinantes,

agentes de suspensión, deslizantes, lubricantes, o rellenos.

24. La composición farmacéutica de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones de composición precedentes, caracterizada porque, cuando la composición
5 farmacéutica comprende una formulación de liberación controlada.

25. La composición farmacéutica de conformidad con cualesquiera de las composiciones precedentes caracterizada porque cuando es ingerida oralmente, la composición induce
10 biodisponibilidad estadísticamente significativa de un derivado del compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-16 o la sal farmacéuticamente aceptable de la misma.

26. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 25, caracterizada porque el derivado del
15 compuesto de cualquiera de reivindicaciones 1-16 es un derivado que no incluye la porción representada por la Fórmula A.

27. Un método para tratar una infección intracelular por protozoarios, una infección vírica o un cáncer, caracterizado
20 porque comprende administrar a un paciente que necesita del mismo una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto o composición de conformidad con cualesquiera de las reivindicaciones precedentes.

28. El método de conformidad con la reivindicación 27,

caracterizado porque el compuesto de conformidad con la reivindicación 1 se administra en combinación con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de una vacuna, un inmunoestimulante, un inhibidor de neuraminidasa, un análogo de adamantina, y una proteína de fusión de sialidasa recombinante.

29. El método de conformidad con la reivindicación 27 o 28, caracterizado porque el método es un método para tratar una infección vírica en un paciente que necesita del mismo.

30. El método de conformidad con la reivindicación 29, caracterizado porque la infección vírica es infección por influenza.

31. El método de conformidad con la reivindicación 30, caracterizado porque la infección vírica es causada por un virus seleccionado de H1N1, H2N2, H3N2, H5N1, H7N7, H1N2, H9N2, H7N2, H7N3, y H10N7.

32. El método de conformidad con la reivindicación 29, caracterizado porque la infección vírica es Hepatitis B.

33. El método de conformidad con la reivindicación 27 o 28, caracterizado porque el método es un método para tratar un cáncer en un paciente que necesita del mismo.

34. El método de conformidad con la reivindicación 33, caracterizado porque el cáncer es leucemia.

35. El método de conformidad con la reivindicación 34,

caracterizado porque la leucemia es leucemia de células pilosas o leucemia mieloide crónica.

36. El método de conformidad con la reivindicación 33, caracterizado porque el cáncer es melanoma.

5 37. El método de conformidad con la reivindicación 33, caracterizado porque el cáncer es linfoma no Hodgkin.

38. El método de conformidad con la reivindicación 33, caracterizado porque el cáncer es carcinoma de células renales.

10 39. El método de conformidad con una de cualesquiera de las reivindicaciones 33-38, caracterizado porque el compuesto de la composición se administra en combinación con al menos uno de una vacuna, un inmunoestimulante y un fármaco anticancerígeno.

15 40. El método de conformidad con la reivindicación 39, caracterizado porque el compuesto de la composición se administra en combinación con al menos un fármaco anticancerígeno está seleccionado del grupo que consiste de STI571, CGP 74588, 1- β -d-Arabinofuranosilcitosina (Ara-C),
20 doxorubicina, dacarbazina, cisplatino, bleomicina, vincristina, lomustina, vinblastina, carmustina, DTIC, tamoxifeno, sunitinib, sorafenib e interferón- α .

41. El método de conformidad con la reivindicación 27 o 28, caracterizado porque el método es un método para tratar

una infección intracelular por protozoarios en un paciente que necesita del mismo.

42. Un método para incrementar la biodisponibilidad de un compuesto de tiazolida, caracterizado porque comprende
5 administrar un compuesto, o sal de la misma, de cualquiera de reivindicaciones 1-16 a un mamífero, caracterizado porque la biodisponibilidad se incrementa en relación a la administración de nitazoxanida.

10

15

20