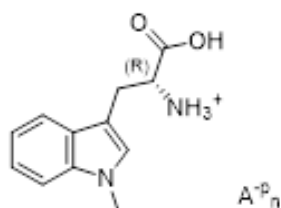


REIVINDICACIONES

Se reivindica lo siguiente:

1. Una sal de indoximod de acuerdo con la Fórmula 1a:



Fórmula 1a

donde A^{p_n} es un anión inorgánico u orgánico en un estado de ionización -p, el anión está presente en una relación estequiométrica n que garantiza la neutralidad de carga molecular.

2. La sal de la reivindicación 1, donde A^{p_n} es un anión que se selecciona del grupo que consiste en cloruro, fosfato, sulfato, mesilato, besilato, acetato, ascorbato, aspartato, glutamato, glutarato, lactato, maleato, malonato, oxalato, succinato, fumarato, tartrato y citrato, donde el estado de ionización -p es -1, -2 o -3 y la relación estequiométrica n es 1, ½ o 1/3, respectivamente, de manera que cumpla con las

condiciones estequiométricas de neutralidad de carga.

3. La sal de la reivindicación 2, donde el fosfato es HPO_4^- , el HPO_4^{-2} presente en una relación estequiométrica n de 0.5.

5

4. La sal de la reivindicación 2, donde el fosfato es HPO_4^- , el HPO_4^- presente en una relación estequiométrica n de 1.

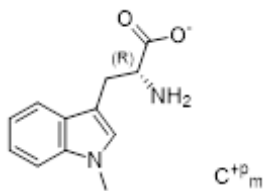
10

5. La sal de la reivindicación 1, donde el anión A^{-pn} es Cl^- , el Cl^- presente en una relación estequiométrica n de 1.

6. La sal de la reivindicación 2, donde el mesilato es CH_3SO_3^- , el CH_3SO_3^- presente en una relación estequiométrica n de 1.

15

7. Una sal de indoximod de acuerdo con la Fórmula 1b:



20

Fórmula 1b

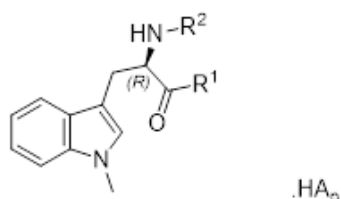
donde C^{+p}_m es un catión inorgánico en un estado de ionización $+p$, el catión está presente en una relación

estequiométrica m que garantiza la neutralidad de carga molecular de la sal.

8. La sal de la reivindicación 7, donde C^{+p}_m se selecciona del grupo que consiste en Li^+ , Na^+ , K^+ , Mg^{+2} y Ca^{+2} , donde cuando p es +1, m es 1, y cuando p es +2, m es $\frac{1}{2}$.

9. Un profármaco de indoximod, en forma de base libre o sal,
de acuerdo con la Fórmula 2:

10



Fórmula 2

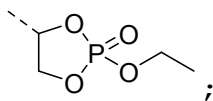
15

donde :

(a) R^1 es $-OH$, $-OalquiloC_{2-3}$, $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$,
 $-OalquiloC_{1-3}-R^3$,
 $-NHC^{(S)}HR^4(COOH)$, $-NHC^{(R)}HR^4(COOH)$, $-OalquiloC_{1-6}R^6$, $-OalquiloC_{1-2}-C^{(S)}H(NH_2)(COOH)$ o $-OalquiloC_{1-2}-C^{(R)}H(NH_2)(COOH)$;

20

(b) R^2 es H , $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$, $-C(O)C^{(R)}H(NH_2)R^4$, $-C(O)CH_2C^{(S)}H(NH_2)$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OR^5$ o $-C(O)NHR^5$;

(c) R^3 es tetrahidropirano o  ;

(d) R^4 es H, -alquilo C_{1-5} , $-(CH_2)_{1-2}SH$, alquilo $C_{1-5}SalquiloC_{1-5}$, alquilo $C_{1-5}OalquiloC_{1-5}$, $-CH_2-R^6$, $-CH_2OH$, $-CH(OH)CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-4}NH_2$ o $-(CH_2)_{1-3}NC(=NH_2)NH_2$;

(e) $C^{(S)}$ y $C^{(R)}$ son carbonos con la estereoquímica *S* o *R*, respectivamente, cuando R^4 no es H;

(f) R^5 es H, alquilo $C_{1-6}R^6$, o R^6

(g) R^6 es H, arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo, donde el arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno, dos o tres grupos R^7 ;

(h) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, -OR, $-N(R)_2$, -SR, $-C(O)OR$, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-C(O)N(R)_2$, $-C(O)R$, $-S(O)R$, $-S(O)OR$, $-S(O)N(R)_2$, $-S(O)_2R$, $-S(O)_2OR$, $-S(O)_2N(R)_2$, $-OC(O)R$, $-OC(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-N(R)C(O)OR$ o $N(R)C(O)N(R)_2$, donde R es H o alquilo C_{1-4} ;

con la condición de que R^1 no puede ser -OH cuando R^2 es H, y el compuesto no puede ser N^α -terc- butoxicarbonil-1-metil-*D*-triptófano, N^α -bencil-1-metil-*D*-triptofanato de etilo o N^α -(terc-butoxicarbonil)-1-metil-*D*-triptofanato de bencilo;

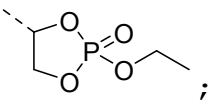
y

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en PO_4H_3 (ácido fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo), $C_6H_5SO_3H$ (ácido sulfónico de bencilo), ácido acético, ácido ascórbico, ácido aspártico, ácido glutámico, ácido glutárico, ácido láctico, ácido maleico, ácido malónico, ácido oxálico, ácido succínico, ácido fumárico, ácido tartárico y ácido cítrico, donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

10. El profármaco de la reivindicación 9, donde:

(a) R^1 es $-OH$, $-OalkiloC_{2-3}$, $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ o $-OalkiloC_{1-3}-R^3$;

(b) R^2 es H o $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$,

(c) R^3 es tetrahidropirano, o ;

(d) R^4 es H , $-alkiloC_{1-5}$, $-(CH_2)_{1-2}SH$, $-(CH_2)_{1-3}SCH_3$, $-(CH_2)_{1-3}OCH_3$, $-CH_2-R^6$, $-CH_2OH$, $-CH(OH)CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-4}NH_2$ o $-(CH_2)_{1-3}NC(=NH_2)NH_2$;

(e) $C^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S , cuando R^4 no

es H;

(f) R^6 es H, arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo, donde el arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno, dos o tres grupos R^7 ;

(g) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, -OR, -N(R)₂, -SR, -C(O)OR, alquiloC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, -C(O)N(R)₂, -C(O)R, -S(O)R, -S(O)OR, -S(O)N(R)₂, -S(O)₂R, S(O)₂OR, -S(O)₂N(R)₂, -OC(O)R, -OC(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)C(O)R, -N(R)C(O)OR o -N(R)C(O)N(R)₂, donde R es H o alquiloC₁₋₄;

con la condición de que R^1 no puede ser -OH cuando R^2 es H; y

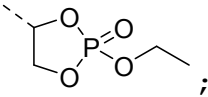
HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en PO₄H₃ (ácido fosfórico), SO₄H₂ (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO₃CH₃ (ácido sulfónico de metilo), C₆H₅SO₃H (ácido sulfónico de bencilo), ácido acético, ácido ascórbico, ácido aspártico, ácido glutámico, ácido glutárico, ácido láctico, ácido maleico, ácido malónico, ácido oxálico, ácido succínico, ácido fumárico, ácido tartárico y ácido cítrico, donde la relación estequiométrica n es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

11. El profármaco de la reivindicación 9, donde:

(a) R^1 es $-OH$, $-O$ alquilo C_{2-3} , $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ u $-O$ alquilo $C_{1-3}-R^3$;

(b) R^2 es H o $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$;

5

(c) R^3 es tetrahidropirano, o ;

(d) R^4 es H , $-$ alquilo C_{1-5} , $-(CH_2)_2SCH_3$, $-CH_2-R^6$, $-(CH_2)_{1-2}C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)OH$ o $-(CH_2)_{1-4}NH_2$;

(e) $C^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S , cuando R^4 no es H ;

10

(f) R^6 es H , arilo, alquilarilo o heteroarilo, donde el arilo, alquilarilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con un grupo R^7 ;

(g) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, $-OR$, $-N(R)_2$, $-SR$, $-C(O)OR$, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-C(O)N(R)_2$, $-C(O)R$, $-S(O)R$, $-S(O)OR$, $-S(O)N(R)_2$, $-S(O)_2R$,

15

$-S(O)_2OR$, $-S(O)_2N(R)_2$, $-OC(O)R$, $-OC(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-N(R)C(O)OR$ o $-N(R)C(O)N(R)_2$, donde R es H o alquilo C_{1-4} ;

con la condición de que R^1 no puede ser $-OH$ cuando R^2 es H ;

20

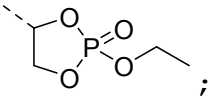
HA_n es un ácido que se selecciona del grupo de PO_4H_3 (ácido fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo), $C_6H_5SO_3H$ (ácido sulfónico

de bencilo), donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

12. El profármaco de la reivindicación 9, donde

5 (a) R^1 es $-OH$, $-OalkiloC_{2-3}$, $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ u $-OalkiloC_{1-3}-R^3$;

(b) R^2 es H o $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$;

(c) R^3 es tetrahidropirano, o ;

(d) R^4 es $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2SCH_3$, $-C^{(S)}H(CH_3)CH_2CH_3$, $-CH_2-R^6$, $-(CH_2)_2C(O)NH_2$, $-(CH_2)_3C(O)OH$ o $-(CH_2)_4NH_2$;

(e) $C^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S ;

(f) R^6 es fenilo;

con la condición de que R^1 no puede ser $-OH$ cuando R^2 es H ;

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo de PO_4H_3 (ácido fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo), $C_6H_5SO_3H$ (ácido sulfónico de bencilo), donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

20 13. El profármaco de la reivindicación 9, donde:

(a) R^1 es $-OalkiloC_{2-3}$ u $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$;

(b) R^2 es H o $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$;

(c) R^4 es $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$ o $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

(d) $C^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S ;

con la condición de que R^1 no puede ser $-\text{OH}$ cuando R^2 es H ;

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo de PO_4H_3 (ácido
5 fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico),
 HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo) o $\text{C}_6\text{H}_5\text{SO}_3\text{H}$ (ácido sulfónico
de bencilo), donde la relación estequiométrica n del ácido es
de 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga
neutra.

10

14. Un profármaco que comprende uno de los siguientes
compuestos:

N^α -(*L*-leucil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

N^α -(*L*-metionil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

15 1-metil-*D*-triptofanato de 2,3-dihidroxipropilo;

N^α -(*L*-leucil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^α -(*L*-metionil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^α -(*L*-isoleucil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

N^α -(*L*-glicil)-1-metil-*D*-triptófano;

20 ácido (*S*)-5-amino-6-(((*R*)-1-carboxi-2-(1-metil-1*H*-indol-
3-il)etil)amino)-6-oxohexanoico;

N^α -(*L*-lisil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^{α} -(*L*-fenilalanil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^{α} -(*L*-glutaminil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de 2-(dimetilamino)etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de (2-etoxi-2-oxido-1,3,2-

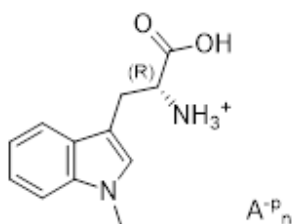
dioxafosfolan-4-il)metilo;

1-metil-*D*-triptofanato de 2-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de etilo; o

1-metil-*D*-triptofanato de isopropilo.

15. Una composición farmacéutica de indoximod de acuerdo con la Fórmula 1a:



Fórmula 1a

donde A^{p_n} es un anión inorgánico u orgánico en un estado de ionización $-p$, el anión está presente en una relación estequiométrica n que garantiza la neutralidad de carga

molecular.

16. La composición farmacéutica de la reivindicación 15, donde
 A^{-p}_n es un anión que se selecciona del grupo que consiste en
5 cloruro, fosfato, sulfato, mesilato, besilato, acetato,
ascorbato, aspartato, glutamato, glutarato, lactato, maleato,
malonato, oxalato, succinato, fumarato, tartrato y citrato,
donde el estado de ionización $-p$ es -1, -2 o -3 y la relación
estequiométrica n es 1, $\frac{1}{2}$ o $\frac{1}{3}$, respectivamente, de manera
10 que cumpla con las condiciones estequiométricas de neutralidad
de carga.

17. La composición farmacéutica de la reivindicación 16, donde
el fosfato es HPO_4^{-2} , el HPO_4^{-2} presente en una relación
15 estequiométrica n de 0.5.

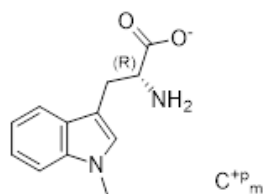
18. La composición farmacéutica de la reivindicación 16, donde
el fosfato es HPO_4^{-} , el HPO_4^{-} presente en una relación
estequiométrica n de 1.

19. La composición farmacéutica de la reivindicación 15, donde
el anión A^{-pn} es Cl^{-} , el Cl^{-} presente en una relación

estequiométrica n de 1.

20. La composición farmacéutica de la reivindicación 16, donde el mesilato es CH_3SO_3^- , el CH_3SO_3^- presente en una relación estequiométrica n de 1.

21. Una composición farmacéutica de indoximod de acuerdo con la Fórmula 1b:



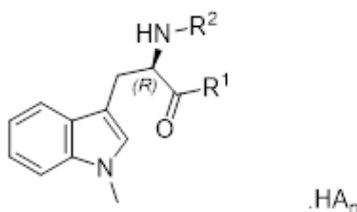
Fórmula 1b

donde C^{+p}_m es un catión en un estado de ionización $+p$, el catión está presente en una relación estequiométrica m que garantiza la neutralidad de carga molecular de la sal.

22. La composición farmacéutica de la reivindicación 21, donde C^{+p}_m se selecciona del grupo que consiste en Li^+ , Na^+ , K^+ , Mg^{+2} y Ca^{+2} , donde cuando p es +1, m es 1, y cuando p es +2, m es $\frac{1}{2}$.

23. Una composición farmacéutica de indoximod, en forma de

base libre o sal, de acuerdo con la Fórmula 2:



Fórmula 2

donde :

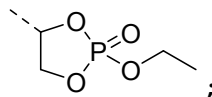
(a) R^1 es $-OH$, $-OalkiloC_{2-3}$, $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$,
 $-OalkiloC_{1-3}-R^3$,

10 $-\text{NHC}^{(S)}\text{HR}^4(\text{COOH})$, $-\text{NHC}^{(R)}\text{HR}^4(\text{COOH})$, $-\text{OalquiloC}_{1-6}\text{R}^6$, $-\text{OalquiloC}_{1-2}$

$$-C^{(S)}H(NH_2)(COOH) \text{ u } -OalkililoC_{1-2}-C^{(R)}H(NH_2)(COOH);$$
$$\begin{aligned} \text{(b)} \quad & \text{R}^2 \quad \text{es} \quad \text{H}, \quad -\text{C}(\text{O})\text{C}^{(S)}\text{H}(\text{NH}_2)\text{R}^4, \quad -\text{C}(\text{O})\text{C}^{(R)}\text{H}(\text{NH}_2)\text{R}^4, \quad - \\ & \text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}^{(S)}\text{H}(\text{NH}_2), \quad -\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3, \end{aligned}$$

15 $-C(O)OR^5$ o $-C(O)NHR^5$;

(c) R³ es tetrahidropirano o 



(d) R^4 es H, -alquiloC₁₋₅, -(CH₂)₁₋₂SH, alquiloC₁₋₅SalquiloC₁₋₅, alquiloC₁₋₅OalquiloC₁₋₅, -CH₂-R⁶, -CH₂OH, -CH(OH)CH₃, -(CH₂)₁₋₂C(O)NH₂, -(CH₂)₁₋₃C(O)OH, -(CH₂)₁₋₄NH₂ o -(CH₂)₁₋₃NC(=NH₂)NH₂;

20 (e) $C^{(S)}$ y $C^{(R)}$ son carbonos con la estereoquímica S o R ,
respectivamente, cuando R^4 no es H;

(f) R^5 es H, alquiloC₁₋₆R⁶, o R⁶

(g) R^6 es H, arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo, donde el arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno, dos o tres grupos R^7 ;

5 (h) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, -OR, -N(R)₂, -SR, -C(O)OR, alquiloC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, -C(O)N(R)₂, -C(O)R, -S(O)R, -S(O)OR, -S(O)N(R)₂, -S(O)₂R, -S(O)₂OR, -S(O)₂N(R)₂, -OC(O)R, -OC(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)C(O)R,

10 -N(R)C(O)OR o N(R)C(O)N(R)₂, donde R es H o alquiloC₁₋₄;

con la condición de que R^1 no puede ser -OH cuando R^2 es H, y el compuesto no puede ser N^α-terc- butoxycarbonil-1-metil-*D*-triptófano, N^α-bencil-1-metil-*D*-triptofanato de etilo o N^α-(terc-butoxicarbonil)-1-metil-*D*-triptofanato de bencilo;

15 y

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en PO₄H₃ (ácido fosfórico), SO₄H₂ (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO₃CH₃ (ácido sulfónico de metilo), C₆H₅SO₃H

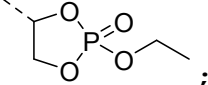
20 (ácido sulfónico de bencilo), ácido acético, ácido ascórbico, ácido aspártico, ácido glutámico, ácido glutárico, ácido láctico, ácido maleico, ácido malónico, ácido oxálico, ácido

succínico, ácido fumárico, ácido tartárico y ácido cítrico, donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

5 24. La composición farmacéutica de la reivindicación 23, donde:

(a) R^1 es $-OH$, $-OalkiloC_{2-3}$, $-OCH_2CH(OH)CH_2OH$, $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ u $-OalkiloC_{1-3}-R^3$;

(b) R^2 es H o $-C(O)C^{(S)}H(NH_2)R^4$,

(c) R^3 es tetrahidropirano, o ;

10 (d) R^4 es H , $-alkiloC_{1-5}$, $-(CH_2)_{1-2}SH$, $-(CH_2)_{1-3}SCH_3$, $-(CH_2)_{1-3}OCH_3$, $-CH_2-R^6$, $-CH_2OH$, $-CH(OH)CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-4}NH_2$ o $-(CH_2)_{1-3}NC(=NH_2)NH_2$;

(e) $C^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S , cuando R^4 no es H ;

15 (f) R^6 es H , arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo, donde el arilo, alquilarilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con uno, dos o tres grupos R^7 ;

(g) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, $-OR$,
20 $-N(R)_2$, $-SR$, $-C(O)OR$, $alkiloC_{1-6}$, $haloalkiloC_{1-6}$, $-C(O)N(R)_2$,
 $-C(O)R$, $-S(O)R$, $-S(O)OR$, $-S(O)N(R)_2$, $-S(O)_2R$, $-S(O)_2OR$,
 $-S(O)_2N(R)_2$, $-OC(O)R$, $-OC(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$,

$-N(R)C(O)OR$ o $-N(R)C(O)N(R)_2$, donde R es H o alquiloC₁₋₄;

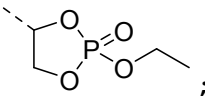
con la condición de que R¹ no puede ser -OH cuando R² es H; y

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en
 5 PO₄H₃ (ácido fosfórico), SO₄H₂ (ácido sulfúrico), HCl (ácido
 clorhídrico), HSO₃CH₃ (ácido sulfónico de metilo), C₆H₅SO₃H
 (ácido sulfónico de bencilo), ácido acético, ácido ascórbico,
 ácido aspártico, ácido glutámico, ácido glutárico, ácido
 láctico, ácido maleico, ácido malónico, ácido oxálico, ácido
 10 succínico, ácido fumárico, ácido tartárico y ácido cítrico,
 donde la relación estequiométrica n es 0, 0.5, 1 o 2, de manera
 que el profármaco tenga carga neutra.

25. La composición farmacéutica de la reivindicación 23, donde:

15 (a) R¹ es -OH, -OalquiloC₂₋₃, -OCH₂CH(OH)CH₂OH, -O(CH₂)₂N(CH₃)₂
 u -OalquiloC₁₋₃-R³;

(b) R² es H o -C(O)C^(S)H(NH₂)R⁴;

(c) R³ es tetrahidropirano, o ;

(d) R⁴ es H, -alquiloC₁₋₅, -(CH₂)₂SCH₃, -CH₂-R⁶, -(CH₂)₁₋₂C(O)NH₂,
 20 -(CH₂)₁₋₃C(O)OH o -(CH₂)₁₋₄NH₂;

(e) C^(S) es un carbono con la estereoquímica S, cuando R⁴ no
 es H;

(f) R^6 es H, arilo, alquilarilo o heteroarilo, donde el arilo, alquilarilo o heteroarilo se sustituye opcionalmente con un grupo R^7 ;

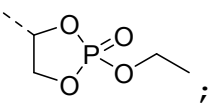
(g) cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, -OR, -N(R)₂, -SR, -C(O)OR, alquiloC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, -C(O)N(R)₂, -C(O)R, -S(O)R, -S(O)OR, -S(O)N(R)₂, -S(O)₂R, -S(O)₂OR, -S(O)₂N(R)₂, -OC(O)R, -OC(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)C(O)R, -N(R)C(O)OR y -N(R)C(O)N(R)₂, donde R es H o alquiloC₁₋₄;

con la condición de que R^1 no puede ser -OH cuando R^2 es H; HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en PO₄H₃ (ácido fosfórico), SO₄H₂ (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO₃CH₃ (ácido sulfónico de metilo) y C₆H₅SO₃H (ácido sulfónico de bencilo), donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

26. La composición farmacéutica de la reivindicación 23, donde:

(a) R^1 es -OH, -OalquiloC₂₋₃, -OCH₂CH(OH)CH₂OH, -O(CH₂)₂N(CH₃)₂ u -OalquiloC₁₋₃-R³;

(b) R^2 es H o -C(O)C^(S)H(NH₂)R⁴;

(c) R^3 es tetrahidropirano, o ;

(d) R^4 es $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$, $-\text{C}^{(S)}\text{H}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{R}^6$, $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $-(\text{CH}_2)_3\text{C}(\text{O})\text{OH}$ o $-(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$;

(e) $\text{C}^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S ;

(f) R^6 es fenilo;

5 con la condición de que R^1 no puede ser $-\text{OH}$ cuando R^2 es H ;

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo que consiste en PO_4H_3 (ácido fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico), HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo) y $\text{C}_6\text{H}_5\text{SO}_3\text{H}$ (ácido sulfónico de bencilo), y donde la relación estequiométrica n del ácido es 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el
10 profármaco tenga carga neutra.

27. La composición farmacéutica de la reivindicación 23, donde:

(e) R^1 es $-\text{OalquiloC}_2-3$ u $-\text{OCH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{OH}$;

15 (f) R^2 es H o $-\text{C}(\text{O})\text{C}^{(S)}\text{H}(\text{NH}_2)\text{R}^4$;

(g) R^4 es $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$ o $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

(h) $\text{C}^{(S)}$ es un carbono con la estereoquímica S ;

con la condición de que R^1 no puede ser $-\text{OH}$ cuando R^2 es H ,

HA_n es un ácido que se selecciona del grupo de PO_4H_3 (ácido fosfórico), SO_4H_2 (ácido sulfúrico), HCl (ácido clorhídrico),
20 HSO_3CH_3 (ácido sulfónico de metilo) o $\text{C}_6\text{H}_5\text{SO}_3\text{H}$ (ácido sulfónico de bencilo), donde la relación estequiométrica n del ácido es

de 0, 0.5, 1 o 2, de manera que el profármaco tenga carga neutra.

28. Una composición farmacéutica que comprende uno de los
5 siguientes compuestos:

N^{α} -(*L*-leucil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

N^{α} -(*L*-metionil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de 2,3-dihidroxipropilo;

N^{α} -(*L*-leucil)-1-metil-*D*-triptófano;

10 N^{α} -(*L*-metionil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^{α} -(*L*-isoleucil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

N^{α} -(*L*-glicil)-1-metil-*D*-triptófano;

ácido (*S*)-5-amino-6-(((*R*)-1-carboxi-2-(1-metil-1*H*-indol-
3-il)etil)amino)-6-oxohexanoico;

15 N^{α} -(*L*-lisil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^{α} -(*L*-fenilalanil)-1-metil-*D*-triptófano;

N^{α} -(*L*-glutaminil)-1-metil-*D*-triptofanato de etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de 2-(dimetilamino)etilo;

20 1-metil-*D*-triptofanato de (2-etoxi-2-oxido-1,3,2-dioxafosfolan-4-il)metilo;

1-metil-*D*-triptofanato de 2-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)etilo;

1-metil-*D*-triptofanato de etilo; o

1-metil-*D*-triptofanato de isopropilo.

29. La composición farmacéutica de cualquiera de las
reivindicaciones 15-28, donde la composición es una cápsula,
5 comprimido o píldora sólidos.

30. La composición farmacéutica de cualquiera de las
reivindicaciones 15-28, donde la composición es una cápsula
disoluble.