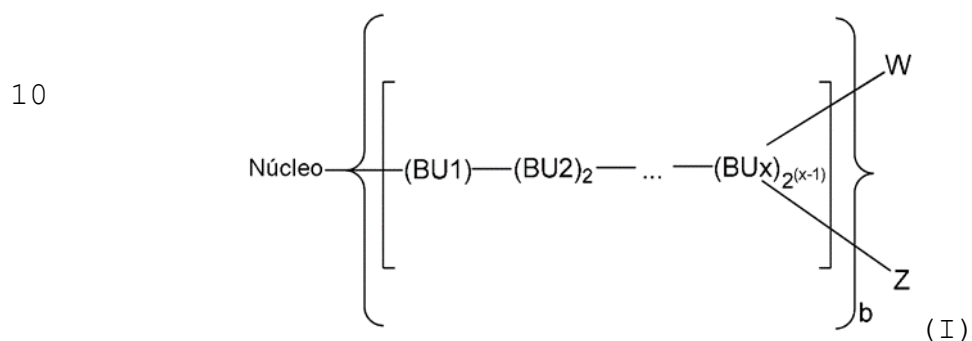


NOVEDAD DE LA INVENCION

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

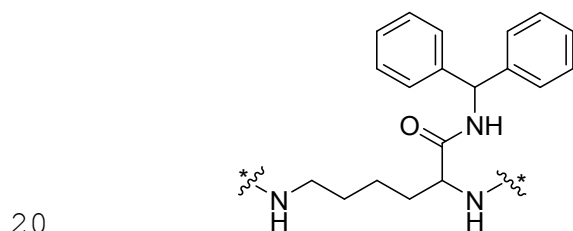
REIVINDICACIONES

1. Un dendrímero de fórmula (I)



15 o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, en
donde:

Núcleo es

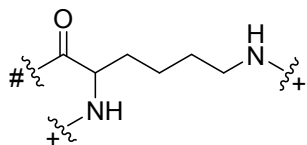


* indica unión covalente a un resto de carbonilo de
(BU1);

b es 2;

BU son unidades de construcción;

BU_x son unidades de construcción de generación x, en donde el número total de unidades de construcción en la generación x del dendrímero de fórmula (I) es igual a 2^(x) y el número total de BU en el dendrímero de fórmula (I) es igual a (2^x-1)b; en donde BU tiene la siguiente estructura:



indica unión covalente a un resto de amina de Núcleo o un resto amino de BU;

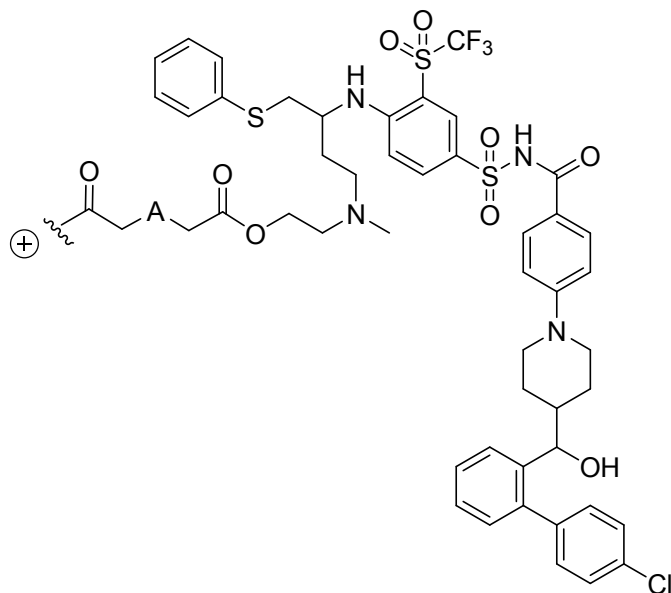
+ indica una unión covalente a un resto de carbonilo de BU o una unión covalente a W o Z;

W es independientemente (PM)_c o (H)_e;

Z es independientemente (L-AA)_d o (H)_e;

PM es PEG₉₀₀₋₁₂₀₀ o PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀;

L-AA es un enlazador unido covalentemente a un agente activo; en donde L-AA es de fórmula:



en donde

A es $-N(CH_3)$, $-O-$, $-S-$ o $-CH_2-$;

$\oplus$ es el punto de unión a un resto de amina de BUx;

a condición de que $(c+d) \leq (2^x)b$ y d sea ≥ 1 ; y

a condición de que si $(c+d) < (2^x)b$, entonces cualquier

grupo W y Z restante sea $(H)_e$, en donde e es $[(2^x)b] - (c+d)$.

2. El dendrímero de la reivindicación 1, en donde b es 2 y x es 5.

3. El dendrímero de la reivindicación 1 o 2, en donde PM es PEG₉₀₀₋₁₂₀₀.

4. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-3, en donde A es $-O-$.

5. El dendrímero de la reivindicación 2, en donde PM es PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀.

6. El dendrímero de la reivindicación 5, en donde A es -O-.

7. El dendrímero de la reivindicación 5, en donde A es -(CH₂)-.

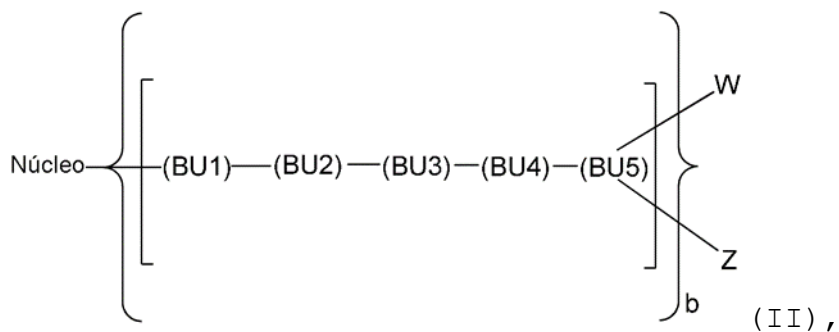
5 8. El dendrímero de la reivindicación 5, en donde A es -S-.

9. El dendrímero de la reivindicación 5, en donde A es -N(CH₃).

10 10. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 5-9, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de entre aproximadamente 2000 y aproximadamente 2200 Da.

11. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 10, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de 2150 Da.

15 12. Un dendrímero de fórmula (II):

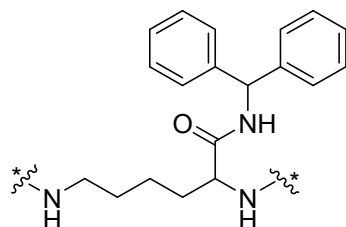


20

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

b es 2;

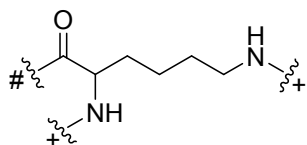
Núcleo es



5

* indica unión covalente a un resto de carbonilo de (BU1);

BU son unidades de construcción y el número de BU es igual a 62; en donde BU tiene la siguiente estructura:



10

indica unión covalente a un resto de amina de Núcleo o un resto amino de BU y + indica una unión covalente a un resto carbonilo de BU o una unión covalente a W o Z;

15

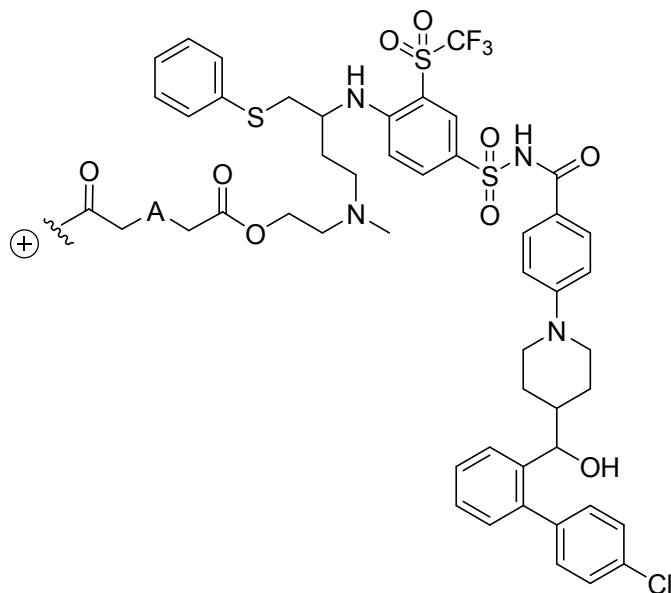
W es independientemente (PM)_c o (H)_e;

Z es independientemente (L-AA)_d o (H)_e;

PM es PEG₉₀₀₋₁₂₀₀ o PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀;

L-AA es un enlazador unido covalentemente a un agente activo; en donde L-AA es de fórmula:

20



en donde

A es $-N(CH_3)$, $-O-$, $-S-$ o $-CH_2-$;

$\oplus$ indica unión covalente a un resto de amina de BU5;

a condición de que $(c+d)$ sea ≤ 64 y d sea ≥ 1 ; y

a condición de que si $(c+d) < 64$, entonces cualquier

grupo W o Z restante sea $(H)_e$, en donde e es $64-(c+d)$.

13. El dendrímero de la reivindicación 12, en donde PM es PEG₉₀₀₋₁₂₀₀.

14. El dendrímero de la reivindicación 12 o 13, en donde A es $-O-$.

15. El dendrímero de la reivindicación 12, en donde PM es PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀.

16. El dendrímero de la reivindicación 15, en donde A es $-O-$.

17. El dendrímero de la reivindicación 15, en donde A es $-(CH_2)-$.

18. El dendrímero de la reivindicación 15, en donde A es $-S-$.

5 19. El dendrímero de la reivindicación 15, en donde A es $-N(CH_3)-$.

20. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 15-19, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de entre aproximadamente 2000 y
10 aproximadamente 2200 Da.

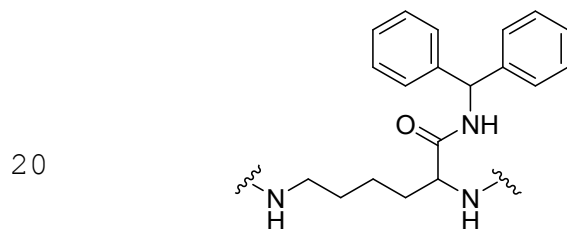
21. El dendrímero de la reivindicación 20, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de aproximadamente 2150 Da.

22. Un dendrímero de fórmula (III):

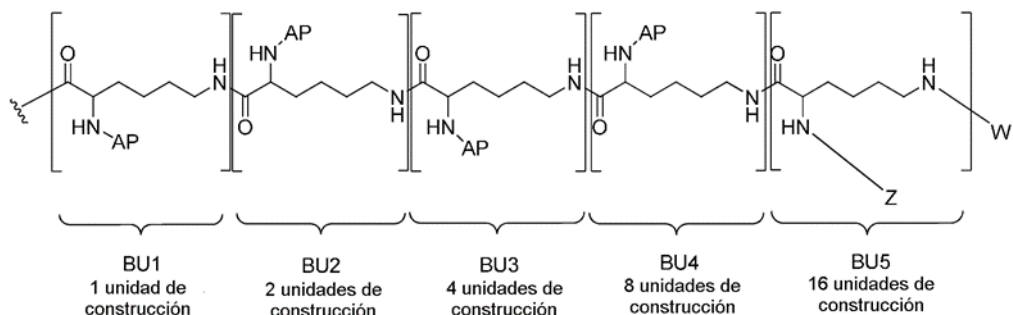
D-Núcleo-D (III)

15 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

Núcleo es



D es



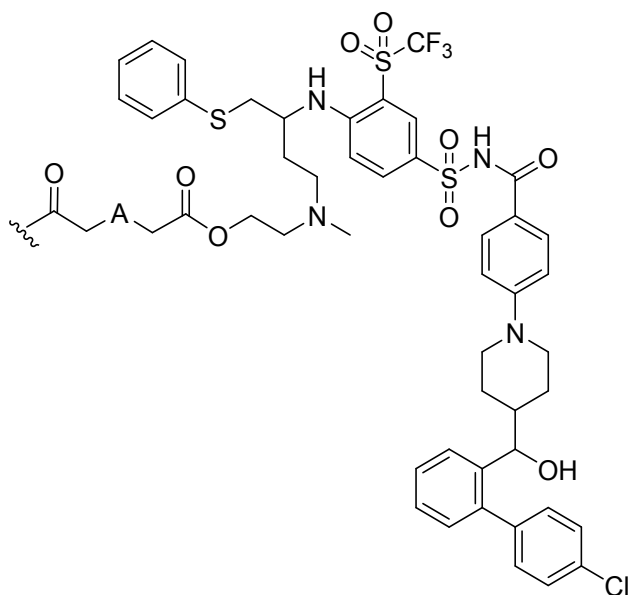
AP es un punto de unión a otra unidad de construcción;

W es independientemente $(PM)_c$ o $(H)_e$;

Z es independientemente $(L-AA)_d$ o $(H)_e$;

PM es $PEG_{900-1200}$ o $PEG_{1800-2400}$;

L-AA es un enlazador unido covalentemente a un agente activo; en donde L-AA es de fórmula:



en donde

A es $-N(CH_3)$, $-O-$, $-S-$ o $-CH_2-$;

a condición de que si $(c+d) < 64$, entonces cualquier grupo W o Z restante sea $(H)_e$, en donde e es $64-(c+d)$; y d es ≥ 1 .

23. El dendrímero de la reivindicación 22, en donde PM
5 es PEG₉₀₀₋₁₂₀₀.

24. El dendrímero de la reivindicación 23, en donde A es -O-.

25. El dendrímero de la reivindicación 22, en donde PM
es PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀.

10 26. El dendrímero de la reivindicación 25, en donde A es -O-.

27. El dendrímero de la reivindicación 25, en donde A es $-(CH_2)-$.

15 28. El dendrímero de la reivindicación 25, en donde A es -S-.

29. El dendrímero de la reivindicación 25, en donde A es $-N(CH_3)$.

30. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 25-29, en donde el PEG tiene un peso
20 molecular medio de entre aproximadamente 2000 y aproximadamente 2200 Da.

31. El dendrímero de la reivindicación 30, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de aproximadamente 2150 Da.

32. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-31, en donde c es un número entero entre 25 y aproximadamente 32.

5 33. El dendrímero de la reivindicación 32, en donde c es un número entero entre 29 y 32.

34. El dendrímero de la reivindicación 33, en donde c es 29 o 30.

10 35. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-34, en donde d es un número entero entre 25 y 32.

36. El dendrímero de la reivindicación 35, en donde d es un número entero entre 29 y 32.

37. El dendrímero de la reivindicación 36, en donde d es 32.

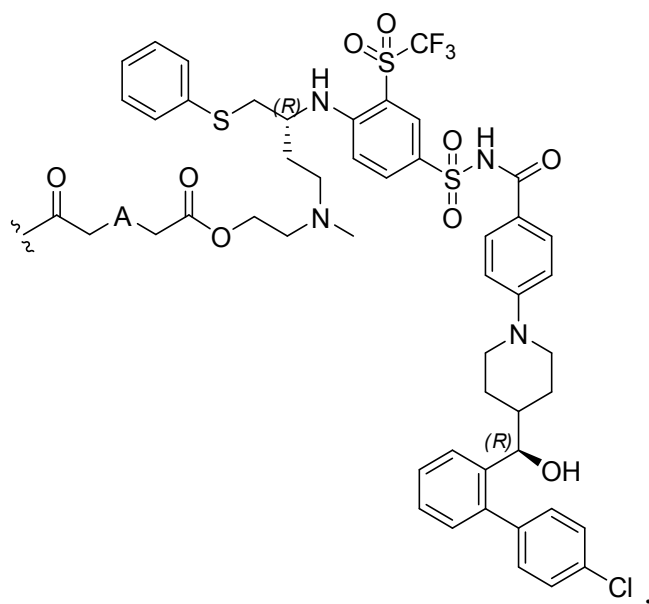
15 38. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-37, en donde $(c+d)$ es igual a un número entero entre 50 y 64.

39. El dendrímero de la reivindicación 38, en donde $(c+d)$ es igual a un número entero entre 58 y 64.

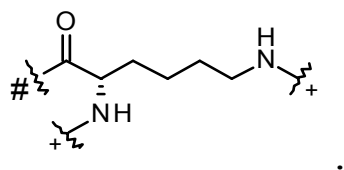
20 40. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-39, en donde e es un número entero entre 0 y 14.

41. El dendrímero de la reivindicación 40, en donde e es un número entero entre 0 y 6.

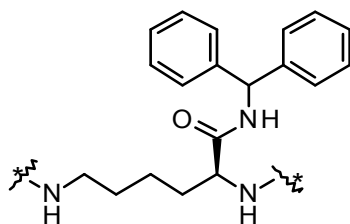
42. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-41, en donde L-AA es



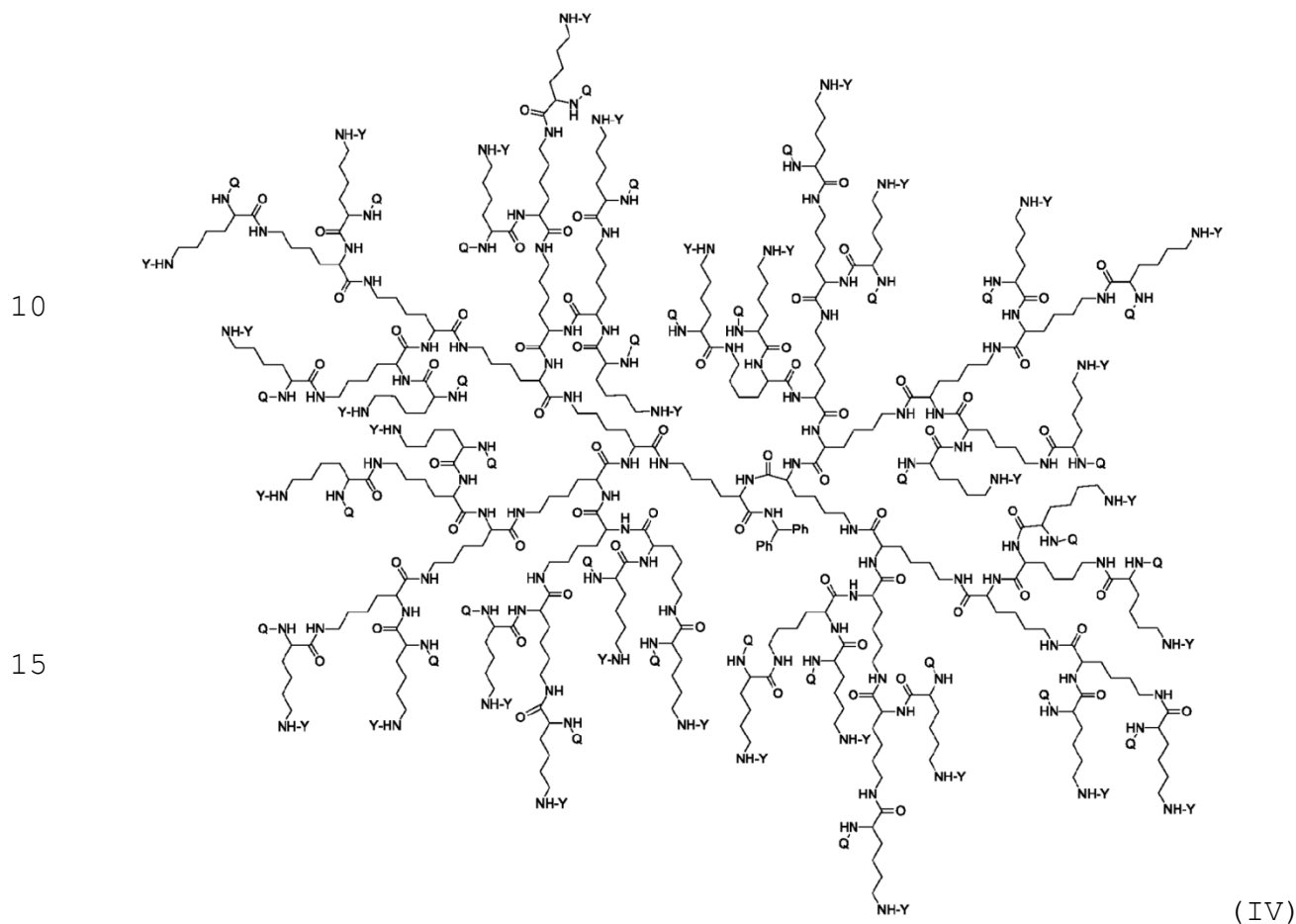
43. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-42, en donde BU es



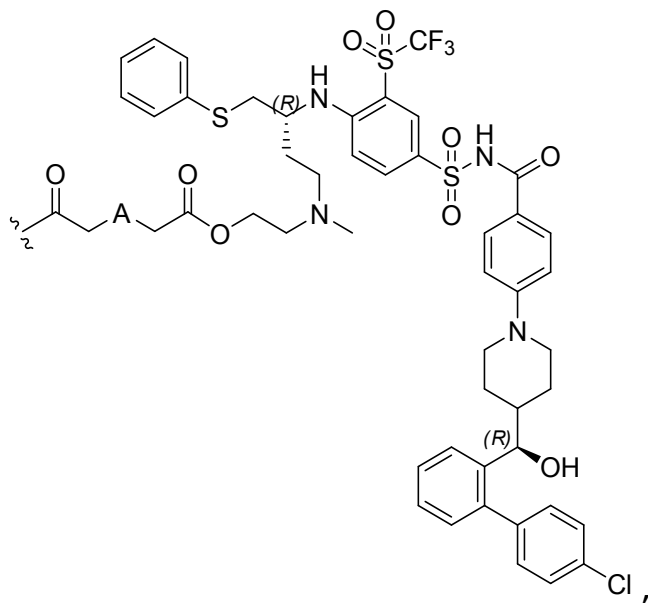
44. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-43, en donde Núcleo es



5 45. Un dendrímero de fórmula (IV):



20 o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, en
donde Y es PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀ o H; Q es H o L-AA, en el que L-AA tiene
la estructura:

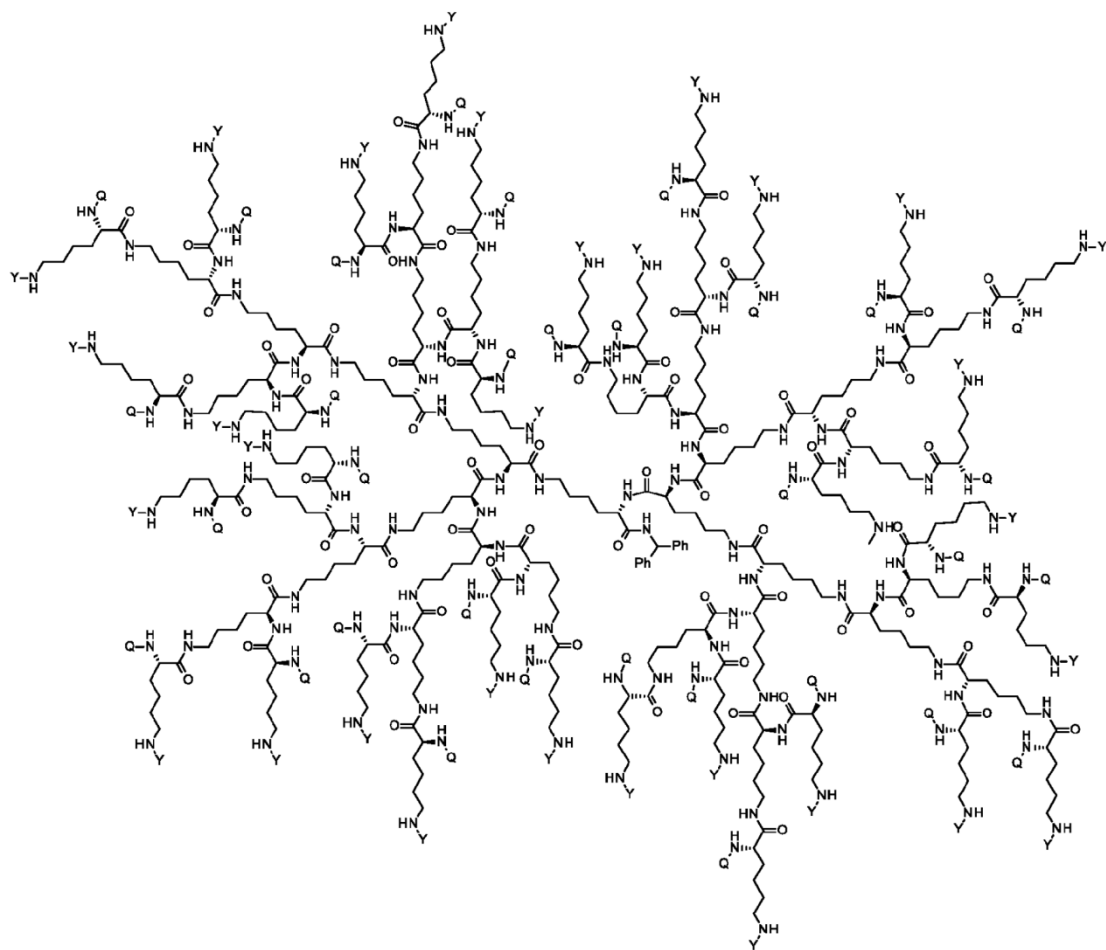


A es -S- o -N(CH₃), a condición de que si la suma de PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀ y L-AA es menor de 64, los demás restos Q e Y son H y a condición de que al menos un Q sea L-AA.

46. Un dendrímero de fórmula (V) :

15

20

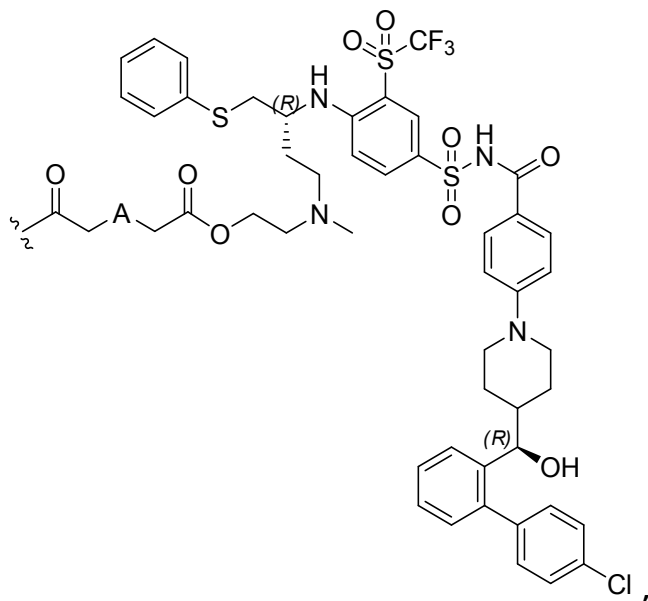


(V)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

Y es PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀ o H;

Q es H o L-AA, en donde L-AA tiene la estructura:



A es -S- o -N(CH₃), a condición de que si la suma de PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀ y L-AA es menor de 64, los demás restos Q e Y son H y a condición de que al menos un Q sea L-AA.

47. El dendrímero de la reivindicación 45 o 46, en donde A es -S-.

48. El dendrímero de la reivindicación 45 o 46, en donde A es $-N(CH_3)$.

49. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 45-48, en donde la suma de $\text{PEG}_{1800-2400}$ y L-AA es un número entero entre 50 y 64.

50. El dendrímero de la reivindicación 49, en donde la suma de PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀ y L-AA es un número entero entre 58 y 64.

51. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 45-50, en donde el dendrímero tiene entre 25 y 32 PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀.

5 52. El dendrímero de la reivindicación 51, en donde el dendrímero tiene entre 29 y 32 PEG₁₈₀₀₋₂₄₀₀.

53. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 45-52, en donde el dendrímero tiene entre 25 y 32 L-AA.

10 54. El dendrímero de la reivindicación 53, en donde el dendrímero tiene entre 29 y 32 L-AA.

55. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 45-54, en donde el dendrímero tiene entre 0 y 14 hidrógenos en las posiciones Q y/o Y.

15 56. El dendrímero de la reivindicación 55, en donde el dendrímero tiene entre 0 y 6 hidrógenos en las posiciones Q y/o Y.

57. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 45-56, en donde el PEG tiene un peso molecular medio de entre 2000 y 2200 Da.

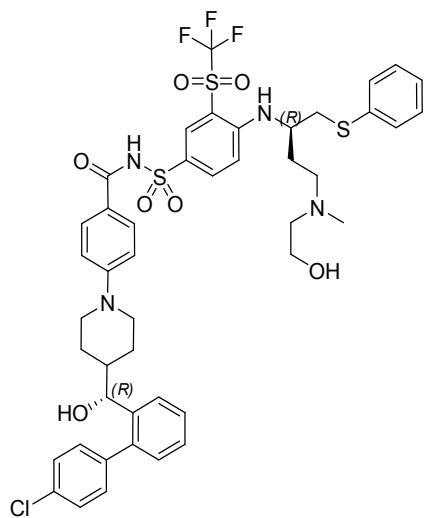
20 58. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-57, en donde el PEG tiene un PDI de entre aproximadamente 1.00 y 1.10.

59. El dendrímero de la reivindicación 58, en donde el PEG tiene un PDI de aproximadamente 1.05.

60. El dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-59, en donde el dendrímero tiene un peso molecular de entre aproximadamente 90 y 120 kDa.

61. El dendrímero de la reivindicación 60, en donde el dendrímero tiene un peso molecular de entre aproximadamente 103 y 107 kDa.

62. El dendrímero de una cualquiera de las
10 reivindicaciones 1-61, en donde AA es el Compuesto A:



(Compuesto A) .

63. Una composición farmacéutica que comprende un
dendrúmero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-62 o
una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un excipiente,
portador o diluyente farmacéuticamente aceptable.

64. Un método para tratar el cáncer que comprende administrar a un sujeto que lo necesite una cantidad eficaz de un dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-62 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

5 65. Un dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-62 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento del cáncer.

10 66. Uso de un dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-62 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para su uso en la fabricación de un medicamento para el tratamiento del cáncer.

15 67. Una composición farmacéutica que comprende un dendrímero de una cualquiera de las reivindicaciones 1-62 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para el tratamiento del cáncer.