

638 ~~695~~

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00001165 00000008

Folios: 30

Fecha (h/m/s): 2005-06-15 17:52:58

Trámite : 002 PATENTES D I REGISTRO/ 444 RESPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señores

Superintendencia de Industria y Comercio

División de Nuevas Creaciones

E. S. D.

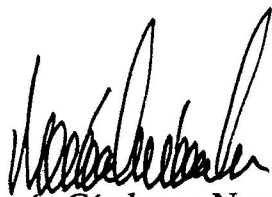
Ref: Expediente No. 00-001.165

Solicitud de Patente de Invención denominada "Derivados de Monosacáridos como Inhibidores de Adhesión Celular"

Solicitante: Ranbaxy Laboratories Limited

Darío Cárdenas Navas, identificado como aparece al pie de mi firma y obrando en mi condición de apoderado de la sociedad **Ranbaxy Laboratories Limited**, solicitante de la patente de invención mencionada en la referencia, doy respuesta al Oficio No. 12395 notificado por fijación en lista el 17 de Marzo de 2.005 y para tal fin adjunto un nuevo capítulo reivindicatorio en el cual (i) se han eliminado las reivindicaciones 6 a 15 del capítulo anterior, y (ii) se han eliminado los términos "prodrogas" y "metabolitos".

Atentamente,



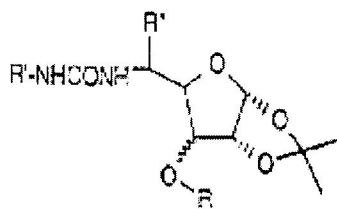
Darío Cárdenas Navas

C.C. 17.066.629 de Bogotá *CHS*

T. P. 1.250 del Consejo Superior de la Judicatura

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la estructura de la Fórmula I:

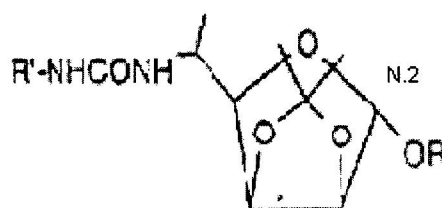


Fórmula I

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas. farmacéuticamente aceptables, en donde R es C₁, a C₁₅ alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arilo, arilo sustituido o alquilarilo, R' es SO₂C₆H₅, SO₂C₆H₄CH₃-p, o SO₂C₆H₄Cl-p, fenilo o fenilo sustituido, representado como C₆H₄- R'''-p, R''' siendo Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, CH₂COOCH₃, CH₂COLDVP, CH₂CODVP, CH₂COVP, en donde LDVP, DVP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valiloprolilo), respectivamente, R'' es H o CH₃, y () representa configuraciones de idofuranosa, talofuranosa, xilofuranosa o ribofuranosa.

2. Un compuesto que tiene la estructura de la Fórmula II constando de derivados de gulofuranosida o lixofuranosida

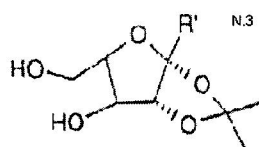
Def
640



Formula II

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, N-óxidos, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es C₁ a C₁₅ alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arilo, arilo sustituido o alquilarilo, R' es SO₂C₆H₅, SO₂C₆H₄CH₃-p, o SO₂C₆H₄Cl-p, fenilo o fenilo sustituido, representado como C₆H₄R'''-p, R''' siendo Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, CH₂COOCH₃, CH₂COLDVP, CH₂CODVP, CH₂COVP, en donde LDVP, DVP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valiloprolilo), respectivamente, R'' es H o CH₃.

3. Un compuesto que tiene la estructura de la Fórmula III



Formula III

~~644~~
644

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5,6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino} β ,L-talofuranosa (compuesto 30)

1,2-O-isopropilideno-3-O-heptilo-5,6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino} β ,L-talofuranosa (compuesto 31)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5,6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino} β ,L-talofuranosa (compuesto 32)

butilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo amino} β ,L-talofuranosida (compuesto 33)

hexilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo amino} β ,L-talofuranosida (compuesto 34)

heptilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo amino} β ,L-talofuranosida (compuesto 35)

decilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo amino} β ,L-talofuranosida (compuesto 36)

dodecilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo-amino} β ,L-talofuranosida (compuesto 37)

butilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} β ,L-talofuranosida (compuesto 38)

hexilo 2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-clorofenilo] aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 39)

heptilo2,3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-clorofenilolaminocarbonilamino} β ,L-talofuranosida (compuesto 40)

~~640~~
645

decilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 41)

dodecilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 42)

butilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 43)

hexilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 44)

heptilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 45)

decilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 46)

dodecilo 2,3-0-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 47)

butilo 2, 3-0-isopropilideno-5, 6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 48)

hexilo 2, 3-0-isopropilideno-5, 6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino} β , L-talofuranosida (compuesto 49)

677
646

heptilo 2, 3-O-isopropilideno-5, 6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]am ino carbonilamino } β , L-talofuranosida (compuesto 50),

decilo 2, 3-O-isopropilideno-5, 6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]am ino carbonilamino } β , L-talofuranosida (compuesto 51)

dodecilo 2, 3-O-isopropilideno-5,6-dideoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino } β , L-talofuranosida (compuesto 52)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 53)

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 54)

1,2-O-isopropilideno-3-O-hexilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 55)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 56)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2 -hidroxi- 2- oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 57)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 58)

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α ,D-xilofuranosa (compuesto 59)

~~67~~
647

1,2-O-isopropilideno-3-O-hexil-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 60)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 61)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metil-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 62)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecil-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 63)

1,2-O-isopropilideno-3-O-decil-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 64)

1,2-O-isopropilideno-3-O-hexil-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 65)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butil-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino] α ,D-xilofuranosa (compuesto 66)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metil-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino] α , D-xilofuranosa (compuesto 67)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecil-5-deoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino] α , D-xilofuranosa (compuesto 68)

~~673~~
648

1,2 -O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino } α ,
0- xilofuranosa (compuesto 69)

1,2-0-isopropilideno-3-0-hexilo-5-deoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , 0-
xilofuranosa (compuesto 70)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , 0-
xilofuranosa (compuesto 71)

1,2-0-isopropilideno-3-0-metilo-5-deoxi-5-N-[[4-tolilo]aminocarbonilamino } α ,
0- xilofuranosa (compuesto 72)

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-{aminocarbonilamino}fenilacetilo-L-
Leucilo-a, L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina}-a, D-xilofuranosa (compuesto 73)

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[aminocarbonilamino]fenilacetilo-
a, L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina } α , 0- xilofuranosa (compuesto 74)

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[aminocarbonilamino]fenilacetilo-L-
-Valilo-L-Prolina } α , D-xilofuranosa (compuesto 75)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxietilo)fenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 76)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-decilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxietilo)fenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 77)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-heptilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxietilo)fenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 78)

1,2-O-isopropilideno-3-0-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxietilo)fenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 79)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-metilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxietilo)fenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 80)

1,2 -O-isopropilideno-3-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-

clorofenilo]aminocarbonilamino } α , D-ribofuranosa (compuesto 81)

634
649

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-([4-clorofenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 82)

1,2-O-isopropilideno-3-O-heptilo-5-deoxi-5-N-([4-clorofenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 83)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5-deoxi-5-N-([4-clorofenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 84)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metilo-5-deoxi-5-N-([4-clorofenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 85)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecilo-5-deoxi-5-N-([4-metoxifenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 86)

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-([4-metoxifenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 87)

1,2-O-isopropilideno-3-O-heptilo-5-deoxi-5-N-([4-metoxifenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 88)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5-deoxi-5-N-([4-metoxifenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 89)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metilo-5-deoxi-5-N-([4-metoxifenilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 90)

1,2-O-isopropilideno-3-O-dodecilo-5-deoxi-5-N-([4-tolilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 91)

1,2-O-isopropilideno-3-O-decilo-5-deoxi-5-N-([4-tolilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 92)

1,2-O-isopropilideno-3-O-heptilo-5-deoxi-5-N-([4-tolilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 93)

1,2-O-isopropilideno-3-O-butilo-5-deoxi-5-N-([4-tolilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 94)

1,2-O-isopropilideno-3-O-metilo-5-deoxi-5-N-([4-tolilo]aminocarbonilamino) α , D-ribofuranosa (compuesto 95)

650

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecil-5-deoxi-5-[[aminocarbonilaminofenilo]acetilo-L-Leucilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina} α ,D-ribofuranosa (compuesto 96)

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecil-5-deoxi-5-N-[[aminocarbonilaminofenilo]acetilo-a, L-Aspartilo-L -V alilo-L -Prolina } α , D- ribofuranosa (compuesto 97)

1,2-0-isopropilideno-3-0-dodecil-5-deoxi-5-N[[aminocarbonilainofenilo]aceti10-L -V alilo-L -Prolina } α , D-ribofu ranosa (compuesto 98)

2, 3-0-isopropilideno-1-0-metil-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 99)

2,3-0-isopropilideno-1-0-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2cfenilo]aminocarbonilamino}-a,D-lixofuranosida (compuesto 1 00)

2,3-0-isopropilideno-1-0-heptilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino}-a,D-lixofuranosida (compuesto 101)

2, 3-0-isopropil ideno-1-0-deci lo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-h idroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilamino } α ,D-lixoiuranosida (compuesto 102)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-(2-hidroxi-2-oxoetilo)fenilo]aminocarbonilo amino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 103)

2,3-0-isopropilideno-1-0-metilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino } α ,D-lixofuranosida (compuesto 104)

2,3-0-isopropilideno-1-0-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 105)

2,3-0-isopropilideno-1-0-heptilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α , D-lixofuranosida (compuesto 106)

2,3-0-isopropilideno-1-0-decilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 107)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[[4-clorofenilo]aminocarbonilamino } α , D-lixofuranosida (compuesto 108)

2,3-0-isopropilideno-1-0-metilo-5-deoxi-5-N-[[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino}a,D-lixofuranosida (compuesto 109)

2,3-0-isopropilideno-1-0-butilo-5-deoxi-5-N-[[4-

656
651

metoxifenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 110)

2,3-0-isopropilideno-1-0-heptilo-5-deoxi-5-N-{[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 111)

2,3-0-isopropilideno-1-0-decilo-5-deoxi-5-N-{[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 112)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-{[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino} α ,D-lixofuranosida (compuesto 113)

2,3-0-isopropilideno-1-0-metilo-5-deoxi-5-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , 0-lixofuranosida (compuesto 114)

2,3-0-isopropilideno-1-0-butilo-5-deoxi-5-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , 0-lixofuranosida (compuesto 115)

2, 3-0-isopropilideno-1-0-heptilo-5-deoxi-5-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , D-lixofuranosida (compuesto 116)

2,3-0-isopropilideno-1-0-decilo-5-deoxi-5-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , D-lixofuranosida (compuesto 117)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino } α , D-lixofuranosida (compuesto 118)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-{[aminocarbonilamino]fenilacetilo-L-Leucilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina} α ,D-lixofuranosida (compuesto 119)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N-[aminocarbonilamino]fenilacetilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina} α ,D-lixofuranosida (compuesto 120)

2,3-0-isopropilideno-1-0-dodecilo-5-deoxi-5-N[aminocarbonilamino]fenilacetilo-L-Valilo-L-Prolina } α , D-lixofuranosida (compuesto 121)

2,3 ;4, 6-Di-O-isopropilideno-1-carbonilo-L-Leucilo-a, L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina-a,L-xilo-2-ácido hexulofuranosónico (compuesto 122)

2,3;4,6-Di-O-isopropilideno-1-carbonilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina-a,L-xilo-2-ácido hexulofuranosónico (compuesto 123)

14

~~677~~
652

2, 3-0-isopropilideno-1-carbonilo-L-Leucilo-a, L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina-a, L-xilo- 2-ácido hexulofuranosónico (compuesto 124)

2,3-0-isopropilideno-1-carbonilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina-a,L-xil0-2- ácido hexulofuranosónico (compuesto 125)

2,3-0-isopropilideno-1-carbonilo-L-Valilo-L-Prolina-a,L-xil0-2-ácido hexulofuranosónico (compuesto 126)

2,3;4,6-Di-O-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-clorofenilo]aminocarbonilamino} α,L-xil0-2-hexulofuranosa (compuesto 127)

2,3;4,6-Di-O-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4- metoxifenilo]aminocarbonilamino}α,L-xil0-2-hexulofuranasa (compuesto 128)

2,3;4,6-Di-O-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino }α, L-xilo- 2-hexulofuranosa (compuesto 129)

2,3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-(2-hidroxi-2oxoetilo)fenil]aminocarbonilamino}α,L-Yilo-2-hexulofuranosa (compuesto 130)

2,3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-clorofenilo]aminocarbonilamino }α,L-xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 131)

2, 3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-metoxifenilo]aminocarbonilamino}α,L- xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 132)

2,3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[4-tolilo]aminocarbonilamino}α,L-xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 133)

2, 3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[aminocarbonilaminofenilacetilo-L-Leucilo-a,L-Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina)} α,L-xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 134)

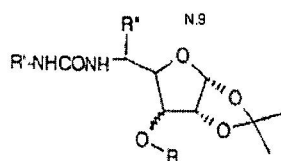
2,3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[aminocarbonilaminofenilacetilo-a,L- Aspartilo-L-Valilo-L-Prolina)}-a,L-xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 135)

2,3-0-isopropilideno-1-deoxi-1-N-{[aminocarbonilaminofenilacetilo-L-Valilo-L-Prolina)} α,L-xilo-2-hexulofuranosa (compuesto 136)

~~658~~
653

5. Una composición farmacéutica que contiene una cantidad farmacéuticamente eficaz de un compuesto, tal como está definido en la reivindicación 1, 2, 3 Y 4, Y un portador farmacéuticamente aceptable.

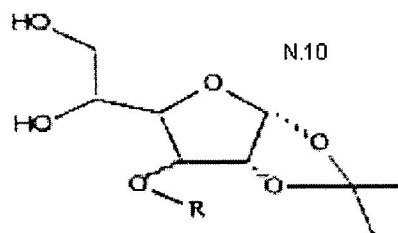
6. Un proceso para la preparación de un compuesto de la Fórmula I:



Formula I

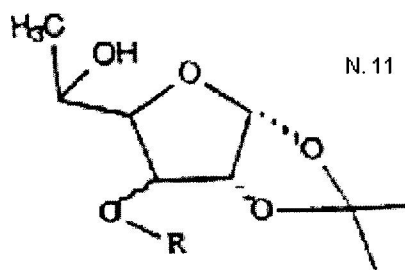
y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es C, a C'5 alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arilo sustituido o alquilarilo, R' es $SO_2C_6H_5$, $SO_2C_6H_4CH_3$ -p, o $SO_2C_6H_4Cl$ -p, fenilo o fenilo sustituido, representado como $C_6H_4--R''-p$, siendo R'' Cl, NO_2 , OCH_3 , CH_3 , CH_2COOH , CH_2COOH_3 , CH_2COOCH_3 , $CH_2COLDVP$, CH_2CODVP , CH_2COVP , en donde LDVP, DVP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valilo-prolilo), respectivamente, R'' es CH_3 , y () representa las configuraciones de idofuranosa, talofuranosa, xilofuranosa o ribofuranosa, cuyo método consta de los pasos de: (A) hacer reacción de un compuesto de la Fórmula IV

619
654



FORMULA IV

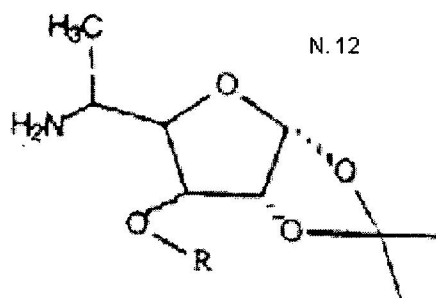
con p-toluenosulfonilo cloruro seguido de una reducción con hidruro de litio y aluminio (HLA) para obtener el compuesto de la Fórmula V



FORMULA V

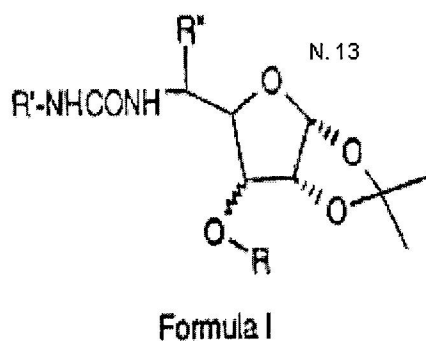
(B) tratar el compuesto de la Fórmula V con toluenosulfonilo cloruro seguido de azida de sodio e hidruro de litio y aluminio para obtener un compuesto de la Fórmula VI

~~650~~
655



Y (C) hacer reacción del compuesto de la Fórmula VI con un isocianato apropiado para obtener el compuesto de la Fórmula I ($R'' = CH_3$).

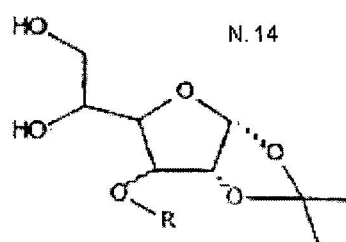
7. Un proceso para preparar un compuesto de la Fórmula 1:



y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde Res C1 a C15 alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arijo sustituido o alquilarilo, R' es $SO_2C_6H_5$, $SO_2C_6H_4CH_3$ -p, o $SO_2C_6H_4Cl$ -p, fenilo o fenilo sustituido, representa~o como C_6H_4 -- R''' -p, siendo R''' Cl, NO_2 , OCH_3 , CH_3 , CH_2COOH , CH_2COOH_3 ,

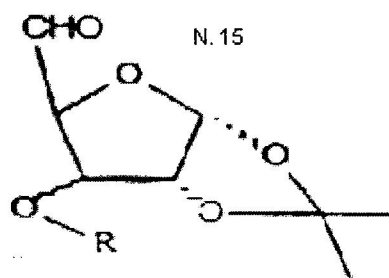
667
656

CH₂COOCH₃, CH₂COLOVP, CH₂COOVP I CH₂COVP I en donde LOVP, OVP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valilo-prolilo), respectivamente, R" es H, y () representa las configuraciones de idofuranosa, talofuranosa, xilofuranosa o ribofuranosa, cuyo método consta de los pasos de: (A) oxidar 1,2-O-isopropilideno-6-deoxi-3-O-alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arijo sustituido o alquilarilo, α, O- glucofuranosa o α, O-alofuranosa representada por la Fórmula IV:



FORMULA IV

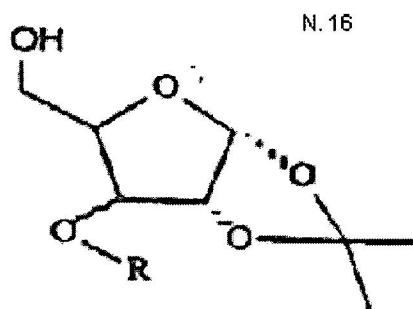
para obtener el compuesto de la fórmula VII



FORMULA VII

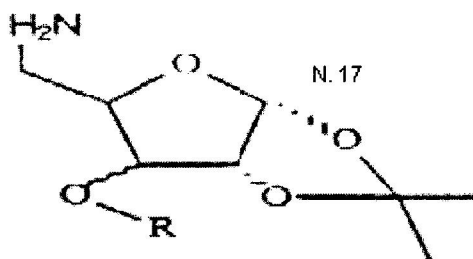
662
657

(B) reducir el compuesto de la Fórmula VII para obtener α ,D-ribofuranosa correspondiente o los derivados de α ,O-ribofuranosa de la Fórmula IX:



FORMULA IX

(C) tosilar el compuesto de la Fórmula IX con p-toluenosulfonilo cloruro; (O) hacer reacción del producto de dicha reacción con azida de sodio; (E) reduciendo el producto del Paso O con hidruro de litio y aluminio para obtener la amina deseada de la Fórmula X:

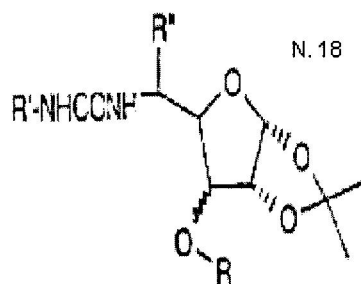


FORMULA X

663
658

Y (F) hacer reacción de la amina de la Fórmula X con los isocianatos apropiados para obtener los compuestos de la Fórmula 1,

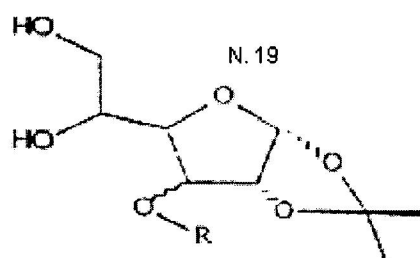
8. Un proceso para preparar un compuesto de la Fórmula 1:



Fórmula I

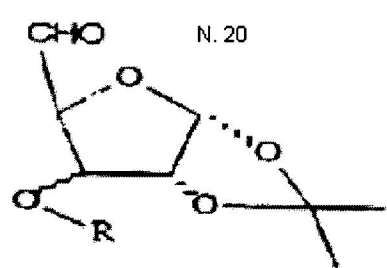
y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es C1 a C1s alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arijo sustituido o alquilarilo, R' es SO₂CeH₅, SO₂CeH₄CH₃-p, o SO₂CeH₄Cl-p, fenilo o fenilo sustituido, representado como CeH₄.- R'''-p, siendo R''' Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, CH₂COOCH₃, CH₂COOCH₃, CH₂COLDVP, CH₂CODVP, CH₂COVP, en donde LDVP, DVP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valilo-prolilo), respectivamente, R'' es H, y () representa las configuraciones de idofuranosa, talofuranosa, xilofuranosa o ribofuranosa, cuyo método consta de los pasos de: (A) oxidar 1,2-O-isopropilideno-6-deoxi-3-O-alquilo, alqueno, alquino(cadena recta o ramificada), arijo, arijo sustituido o alquilarilo, a,D-glucofuranosa o a,D-alofuranosa representada por la Fórmula IV:

664
659



FORMULA IV

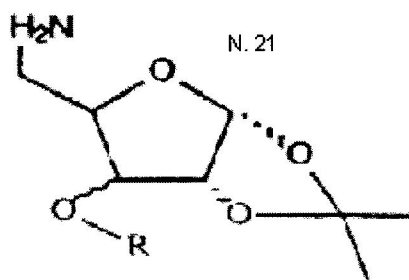
para obtener el compuesto de la Fórmula VII:



FORMULA VII

(8) hacer reacción de un compuesto de 1,2-O-isopropilideno-4-carboxal-dehidrato-a,O-glucofuranosa o del compuesto alofuranosa de la Fórmula VII con hidrocloreuro de hidroxilamina; (C) reducir el producto del Paso 8 con hidruro de litio y aluminio para obtener la amina deseada de la Fórmula X:

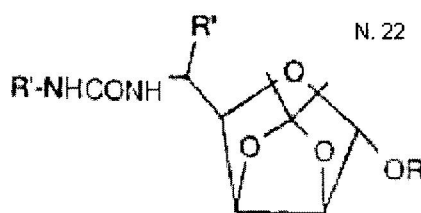
667
660



FORMULA X

(O) hacer reacción de la amina de la Fórmula X con los isocianatos apropiados para obtener los compuestos de la Fórmula 1,

9. Un proceso para preparar los compuestos de la Fórmula II que consta de los derivados de gulofuranosida o lixofuranosida.

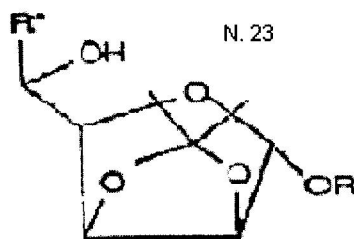


Formula II

y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es C1 a C15 alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arijo sustituido o alquilarilo, R' es SO₂CeH₅, SO₂CeH₄CH₃-p, o SO₂CeH₄Cl-p, fenilo o fer,ilo sustituido. representado como C₆H₄-- R'''-p, siendo R''' Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, Cl-2COOH₃, CH₂COOCH₃, CH₂COLOVP, Cl:i2COOVP, CH₂COVP, en donde LOVP, OVP y

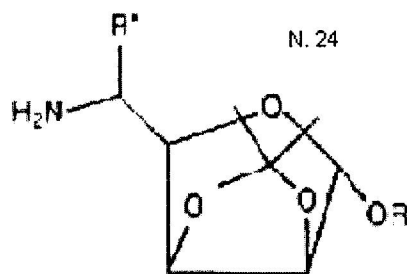
~~666~~
661

VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-proiilo), tripéptido (aspartilo-valilo-proiilo) y dipéptido (valilo-proiilo), respectivamente, R'' es CH_3 , cuyo proceso consta de los pasos de: (A) hacer reacción de 2,3-O-isopropilideno-6-deoxi-1-O-alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arilo sustituido o alquilaril manofuranosida de la Fórmula XI:



FORMULA XI

con sulfonylchloruro de p-tolueno; (8) hacer reacción del producto del Paso A con azida de sodio; (C) reducir el producto del Paso 8 con hidruro de litio y aluminio para obtener la correspondiente 5-Ooxi-5-amino gulofuranosida de la Fórmula XII:

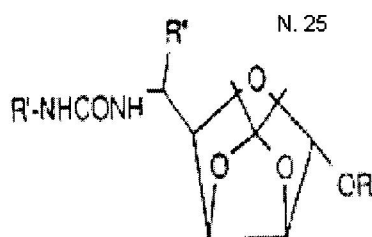


FORMULA XII

667
662

Y (D) tratar el compuesto de la Fórmula XII con el alquilo o arijo apropiado y los arijo isocianatos para obtener los compuestos de la Fórmula 11.

10. Un proceso de preparación de los compuestos de la Fórmula I1 que consta de derivados de gulofuranosida o lixofuranosida

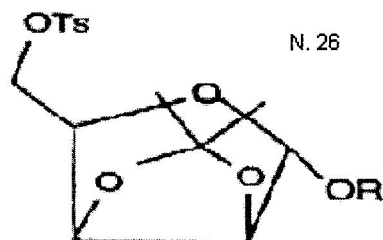


y sus sales, ésteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es C, a C'S alquilo, alqueno, alquino (cadena recta o ramificada), arijo, arilo sustituido o alquilarilo, R' es SO₂C₆H₅, SO₂C₆H₄CH₃-p, o SO₂C₆H₄Cl-p, fenilo o fenilo sustituido, representado como C₆H₄-- R'''-p, siendo R''' Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, ~H₂COOH₃, CH₂COOCH₃, CH₂COLDVP, CH₂CODVP, CH₂COVP, en donde LDVP, DVP y VP representan el tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo), el tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y el dipéptido (valilo-prolilo), respectivamente, R'' es H, cuyo proceso consta de los pasos ds (A) tratar 2,3-0-isopropilideno-5-deoxi-1-0-

25

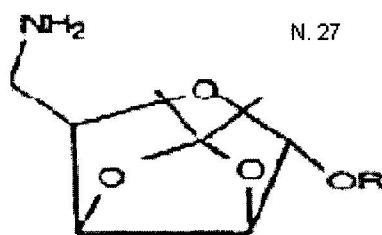
~~668~~
663

alquilo, alqueno, alquino(cadena recta o ramificada), arijo, arilo sustituido o alquilarilo)-5-tosilo-a-lixofuranosida de la Fórmula XIII:



FORMULA XIII

con azida de sodio; (B) reducir el compuesto de la Fórmula XIII con hidruro de litio y aluminio para obtener la amina deseada de la Fórmula XIV



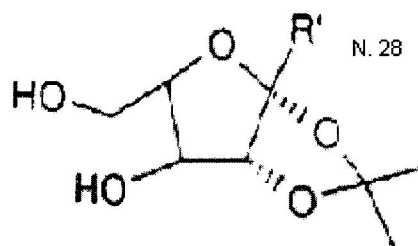
FORMULA XIV

Y (C) tratar el compuesto de la Fórmula XIV con un isocianato apropiado para obtener los compuestos de la Fórmula II.

11. Un proceso para preparar los compuestos de la Fórmula III

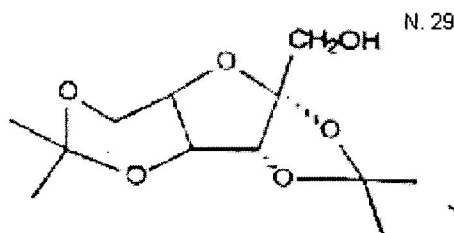
26

669
664



Formula III

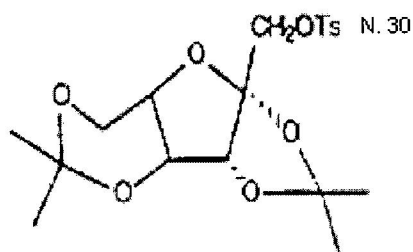
y sus sales, ésteres. enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas. farmacéuticamente aceptables, en donde R' es CH₂-NH-CO-NHR". y en donde R" es C₆H₄R'''-p (R''' es Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, CH₂COLOVP, CH₂COOVP o CH₂COVP, cuyo proceso consta de los pasos de: (A) tratar 2,3;4,6-Di- O-isopropilideno- α ,L-xil0-2-hexulofuranosida de la Fórmula XVI:



FORMULA XVI

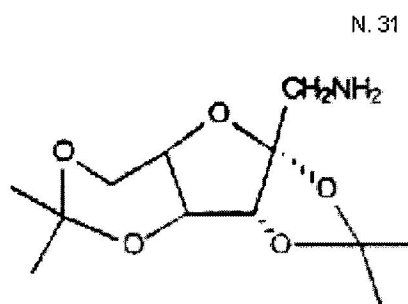
con p-toluenosulfonilo cloruro para obtener el compuesto de la Fórmula XVII:

665



FORMULA XVII

(B) hacer reacción del compuesto de la Fórmula XVII con azida de sodio e hidruro de litio y aluminio para obtener los derivados de l-amino correspondientes de la Fórmula XIX:

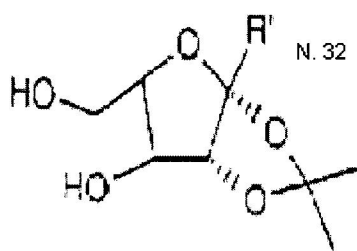


FORMULA XIX

(C) tratar el compuesto de la Fórmula XIX con un isocianato apropiado; y (O) hidrolizar selectivamente las posiciones-4,6 del producto del Paso C para obtener los compuestos de la Fórmula III

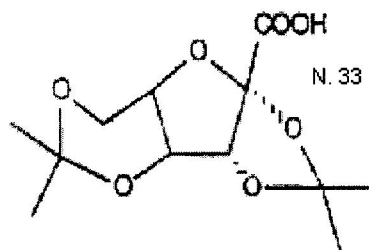
12. Un proceso para preparar compuestos de la Fórmula III

621
666



Formula III

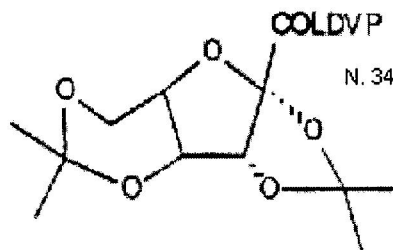
y sus sales, éteres, enantiómeros, diastereómeros, óxidos-N, amidas, farmacéuticamente aceptables, en donde R es COLDVP o CODVP en donde LDVP, D.YP y VP representan tetrapéptido (Leucilo-aspartilo-valilo-prolilo) , tripéptido (aspartilo-valilo-prolilo) y dipéptido (valilo-prolilo), respectiv~mente, y en donde R" es C₆H₄R'''-p (R'''es Cl, NO₂, OCH₃, CH₃, CH₂COOH, CH₂COLDVP, CH₂CODVP o CH₂COVP), cuyo proceso consta de los pasos de (A) hacer reacción de 2,3;4,6-Di-O-isopropilideno-α,L-xiló-2-ácido hexulofuranosónico de la Fórmula XV:



FORMULA XV

con LD (OBzl) VP (OBzl); (B) hidrogenar el compuesto de la Fórmula XV para obtener los compuestos de la Fórmula XXI:

~~677~~
667



FORMULA XXI

(C) hidrolizar selectivamente el compuesto de la Fórmula XXI con ácido perclórico para obtener los compuestos de la Fórmula III ($R' = \text{COLDVP}$).

(67)
668

375.
Sin Fecha

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 00 01165, realizado según el artículo 48 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica:

Documentos estudiados:

- . Descripción: folios 544-568
- . Ejemplos: folios 569-606
- . Capítulo reivindicatorio estudiado: folios 644-672
- . Se reivindica prioridad presentada en Estados Unidos, el 12.01.99, bajo el número 09/229155 y la 09/411357 de 01.10.99

Objeto de la invención

Según las reivindicaciones 1 a 12 de la presente solicitud, se refiere a monosacáridos derivados de pentosa y hexosa que exhiben una actividad potente en contra de la adhesión celular y antiinflamatoria. Se describen además sus métodos de síntesis y composiciones farmacéuticas que los contienen.

Clasificación internacional de patentes A 61 K 31/70

Claridad de la solicitud

El art. 30 de la Decisión 486 establece que *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción"*

Teniendo en cuenta lo anterior y gracias al nuevo capítulo reivindicatorio presentado, la presente solicitud cumple con el requisito de claridad, de acuerdo con el art. 30 de la Decisión 486.

Evaluación de la unidad de invención

El Art. 25 de la decisión 486 dice *"La solicitud de patente sólo podrá comprender una invención o un grupo de invenciones relacionadas entre sí, de manera que conformen un único concepto inventivo"*

De acuerdo a lo anterior, la presente solicitud cumple con el requisito de unidad de invención, contemplado en el art. 25 de la Decisión 486.

Es una invención

El objeto de la presente solicitud sí puede ser considerado una invención, de acuerdo al art. 15 de la Decisión 486.

Excepciones a la patentabilidad

El contenido de las reivindicaciones 1 a 12 de la presente solicitud no se encuentra comprendido dentro de las excepciones a la patentabilidad consideradas dentro del art. 20 de la Decisión 486.

Determinación del estado de la técnica:

Consultadas las fuentes de información con que cuenta este despacho, no se encontraron documentos, anteriores a la fecha de prioridad de la presente solicitud - 12.01.99-, relacionados con la materia de la presente solicitud.

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

El artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina establece que: *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial"*

En cumplimiento del artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Evaluación de la NOVEDAD

El artículo 16 de la decisión 486 establece *"una invención se considerará nueva cuando no está comprendida dentro del estado de la técnica"*

Se realizó el estudio de novedad y comparando elemento por elemento de la presente solicitud, no se encontraron compuestos iguales a las de la presente solicitud, por lo tanto las reivindicaciones 1 a 12 cumplen con el requisito de novedad de acuerdo con el art. 16 de la decisión 486.

Evaluación del NIVEL INVENTIVO

El artículo 18 de la decisión 486 dispone *"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*

El estado de la técnica revela compuestos inhibidores de VLA4, pero no los compuestos de urea acoplados a un núcleo de azúcar de la presente solicitud, lo cual constituye una solución inesperada y nada obvia para una persona versada en la materia respecto a esta clase de compuestos.

En conclusión, los compuestos de las reivindicaciones 1 a 12 de la presente solicitud cumplen con el requisito de nivel inventivo, según el art. 18 de la decisión 486.

674
669

675
670

Evaluación de la aplicación industrial

El art. 19 de la Decisión 486 dispone "*Se considerará que una invención es susceptible de aplicación industrial, cuando su objeto pueda ser producido en la industria*"

De acuerdo a lo anterior, la presente solicitud cumple con el requisito de aplicación industrial, de acuerdo con el art. 19 de la Decisión 486.

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **CONCEDER** el privilegio solicitado para las reivindicaciones 1-12 (folios 644-672) de la presente solicitud.

CONCEPTO TÉCNICO Número 0948	Jefe de la División Nuevas creaciones	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202024
--	--	--



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION

16612

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

28338

Rad. N° 00-1165

el recurso de reposición ante el Superintendente de Industria y Comercio, del cual podrá hacer uso al momento de la notificación o dentro de los cinco 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los **15 JUL. 2005**

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,

JAIR RUBIO ESCOBAR

Doctor

DARIO CARDENAS NAVAS

Carrera 7 N° 71 – 52, Torre B, Piso 9.
Bogotá, D.C.

202021

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION 16612

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO 28338

Rad. N° 00-1165

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia con el número 00001165 del día 12 de enero del 2000, se solicitó conceder patente para la invención contenida en el expediente de la referencia.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado observaciones.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 641 y 642 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante, mediante escrito radicado bajo el número 00001165 00000008 del 15 de junio del 2005, atendió oportunamente el requerimiento formulado, presentando nuevos folios 644 a 672, con el texto de las reivindicaciones que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. El capítulo en mención se acepta, como quiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de La Comunidad Andina se otorgarán patentes "...para las invenciones sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

SEXTO: Que en el presente caso cumplen los requisitos indicados en el numeral anterior las reivindicaciones 1 a 12 contenidas en los folios 644 a 672, razón por la cual este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas el privilegio solicitado.

RESUELVE:

673
618



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION 16612

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO
28338

Rad. N° 00-1165

ARTICULO PRIMERO: Otorgar privilegio de patente de invención a la creación denominada:

**" DERIVADOS DE MONOSACARIDOS COMO INHIBIDORES DE ADHESION
CELULAR "**

Clasificación IPC: A 61 K 31/70.

Reivindicación(es): 1 a 12 **Folio(s):** 644 a 672.

Titular(es): RANBAXY LABORATORIES LIMITED.

Domicilio(s): Nueva Delhi, India.

Inventor(es): Sudershan K. Arora, Madan P. Tanwar, Jang B. Gupta y Geeta Sharma.

Prioridad N°: 09/229,155 **Fecha:** 12 de enero de 1999 **País:** US.
09/411,357 30 de septiembre de 1999 US.

Vigente desde: 12 de enero del 2000 **Hasta:** 12 de enero del 2020

ARTICULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y su privilegio caducará en las condiciones prescritas por las disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial.

ARTICULO TERCERO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTICULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución al doctor Darío Cárdenas Navas, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Ranbaxy Laboratories Limited., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede