

JOSE LLORED CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

258

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00063018 00000007 Folios: 13
Fecha (AMD): 2005-10-06 09:36:12
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 329 COMPLEMEN.
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: **P1.-ABBOTT LABORATORIES.-Solicitud de Patente de
Invención para "9A-AZALIDAS CON ACTIVIDAD
ANTIBACTERIAL"-Clase A.61K-Expediente número
00-063.018.-**

1. Me refiero a mi memorial de 12 de Febrero de 2001, mediante el cual se dividió la solicitud de la referencia en dos solicitudes.
2. De conformidad con lo señalado en el numeral 4 (1) c del mencionado escrito, anexo me permito presentar copia del nuevo capítulo reivindicatorio que comprende las reivindicaciones originales 1, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17 y 18, renumeradas y una reivindicación 15, quedando así el capítulo reivindicatorio para la solicitud original, compuesto por **17** reivindicaciones.
3. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,


ALICIA LLORED CAMACHO

T.P. 53.215

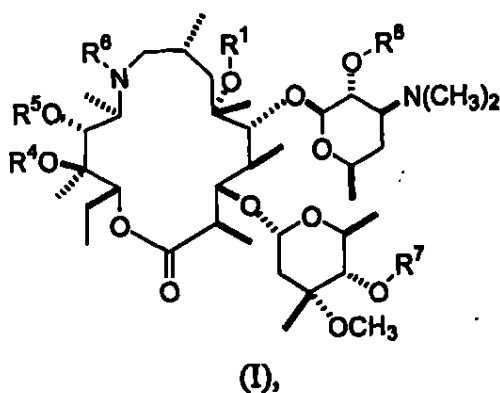
259

64

REIVINDICACIONES

LO QUE SE REIVINDICA ES:

1. Un compuesto de fórmula (I)



o sales farmacéuticamente aceptables del mismo, donde R^1 y R^2 son independientemente seleccionados del grupo que consiste de

- (1) hidrógeno
- (2) alquil $-C_1-C_{12}-$,
- (3) alquénil $-C_3-C_{12}-$,
- y
- (4) alquínil $-C_3-C_{12}-$,

donde (2)-(4) pueden ser opcionalmente substituidos con uno, dos, o tres substituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de

- (a) halógeno,
- (b) $-OR^3$, donde R^3 es seleccionado entre el grupo que consiste de
 - (i) hidrógeno

(ii) alquil-C₁-C₁₂,

(iii) heteroalquil -C₂-C₁₂,

donde (ii) y (iii) pueden ser opcionalmente substituidos con uno, dos, o tres substituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de

(1') aril,

(2') aril substituido por el reemplazo independiente de uno, dos o tres átomos de hidrógeno con -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -NO₂, -CN, -(CO)-alquil-C₁-C₆, -C(O)-aril, -(CO)-heteroaril, -CO₂-alquil, -CO₂-aril, -CO₂-heteroaril, -CONH₂, -CONH-alquil-C₁-C₆, -CONH-aril, -CONH-heteroaril, -OC(O)-alquil-C₁-C₆, -OC(O)-aril, -OC(O)-heteroaril, -OCO₂-alquil, -OCO₂-aril, -OCO₂-heteroaril, -OCONH₂, -OCONH-alquil-C₁-C₆, -OCONH-aril, -OCONH-heteroaril, -NHC(O)-alquil-C₁-C₆, -NHC(O)-aril, -NHC(O)-heteroaril, -NHCO₂-alquil, -NHCO₂-aril, -NHCO₂-heteroaril, -NHCONH₂, -NHCONH-alquil-C₁-C₆, -NHCONH-aril, -NHCONH-heteroaril, -SO₂-alquil-C₁-C₆, -SO₂-aril, SO₂-heteroaril, -SO₂NH₂, -SO₂NH-alquil-C₁-C₆, -SO₂NH-aril, -SO₂NH-heteroaril, alquil-C₁-C₆, cicloalquil-C₃-C₆, -CF₃, -CH₂CF₃, CHCl₂, -CH₂OH, -CH₂CH₂OH, -CH₂NH₂, -CH₂SO₂CH₃, aril, heteroaril, bencil, benciloxi, ariloxi, heteroariloxi, alcoxi-C₁-C₆, metoximetoxi, metoxietoxi, amino, bencilamino, arilamino, heteroarilamino, alquilamino-C₁-C₃, tio, ariltio, heteroariltio, benciltio, alquiltio-C₁-C₆, o metiltiometil.

(3') heteroaril,

y

(4') heteroaril substituido por el reemplazo independiente de uno, dos o tres átomos de hidrógeno con -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -NO₂, -CN, - (CO)-alquil-C₁-C₆, -C(O)-aril, -(CO)-heteroaril, -CO₂-alquil, -CO₂-aril, -CO₂-heteroaril, -CONH₂, -CONH-alquil-C₁-C₆, -CONH-aril, -CONH-heteroaril, -OC(O)-alquil-C₁-C₆, -OC(O)-aril, -OC(O)-heteroaril, -OCO₂-alquil, -OCO₂-aril, -OCO₂-heteroaril, -OCONH₂, -OCONH-alquil-C₁-C₆, -OCONH-aril, -OCONH-heteroaril, -NHC(O)-alquil-C₁-C₆, -NHC(O)-aril, -NHC(O)-heteroaril, -NHCO₂-alquil, -NHCO₂-aril, -NHCO₂-heteroaril, -NHCONH₂, -NHCONH-alquil-C₁-C₆, -NHCONH-aril, -NHCONH-heteroaril, -SO₂-alquil-C₁-C₆, -SO₂-aril, SO₂-heteroaril, -SO₂NH₂, -SO₂NH-alquil-C₁-C₆, -SO₂NH-aril, -SO₂NH-heteroaril, alquil-C₁-C₆, cicloalquil-C₃-C₆, -CF₃, -CH₂CF₃, CHCl₂, -CH₂OH, -CH₂CH₂OH, -CH₂NH₂, -CH₂SO₂CH₃, aril, heteroaril, bencil, benciloxi, ariloxi, heteroariloxi, alcoxi-C₁-C₆, metoximetoxi, metoxietoxi, amino, bencilamino, arilamino, heteroarilamino, alquilamino-C₁-C₃, tio, ariltio, heteroariltio, benciltio, alquiltio-C₁-C₆, o metiltiometil.

(iv) aril,

(v) aril substituido, como se definió anteriormente.

(vi) heteroaril,

y

(xv) heteroaril substituido, como se definió anteriormente.

(c) $-NR^{11}R^{12}$, donde R^{11} y R^{12} son independientemente seleccionados del grupo que consiste de

(i) hidrógeno

(ii) alquil $-C_1-C_{12}-$,

(iii) heteroalquil $-C_2-C_{12}-$,

donde (ii) y (iii) pueden ser opcionalmente substituidos con uno, dos o tres substituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de

(1') aril,

(2') aril substituido, como se definió anteriormente.

(3') heteroaril,

y

(4') heteroaril substituido, como se definió anteriormente.

(iv) aril,

(v) aril substituido, como se definió anteriormente.

(vi) heteroaril,

y

(xv) heteroaril substituido, como se definió anteriormente.

o

R^{11} y R^{12} , junto con el átomo al cual están unidos, forman un anillo heterocicloalquil, donde el anillo heterocicloalquil puede ser opcionalmente substituido por el reemplazo independiente de uno, dos o tres átomos de hidrógeno con $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-NO_2$, $-CN$, $-(CO)-alquil-C_1-C_6$, $-C(O)-aril$, $-(CO)-heteroaril$, $-CO_2-alquil$, $-CO_2-aril$, $-CO_2-heteroaril$, $-CONH_2$, $-CONH-alquil-C_1-C_6$, $-CONH-aril$, $-CONH-heteroaril$, $-OC(O)-alquil-C_1-C_6$, $-OC(O)-aril$, $-OC(O)-heteroaril$, $-OCO_2-alquil$, $-OCO_2-aril$, $-OCO_2-$

heteroaril, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{CONH}$ -aril, $-\text{CONH}$ -heteroaril, $-\text{NHC}(\text{O})$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{NHC}(\text{O})$ -aril, $-\text{NHC}(\text{O})$ -heteroaril, $-\text{NHCO}_2$ -alquil, $-\text{NHCO}_2$ -aril, $-\text{NHCO}_2$ -heteroaril, $-\text{NHCONH}_2$, $-\text{NHCONH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{NHCONH}$ -aril, $-\text{NHCONH}$ -heteroaril, $-\text{SO}_2$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{SO}_2$ -aril, $-\text{SO}_2$ -heteroaril, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -aril, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -heteroaril, alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, cicloalquil- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, CHCl_2 , $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$, aril, heteroaril, bencil, benciloxi, ariloxi, heteroariloxi, alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, metoximetoxi, metoxietoxi, amino, bencilamino, arilamino, heteroarilamino, alquilamino- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -, tio, ariltio, heteroariltio, benciltio, alquiltio- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, o metiltiometil.

(d) $=\text{N-O-R}^9$, donde R^9 es definido arriba,

(e) aril,

(f) aril substituido, como se definió anteriormente.

(g) heteroaril,

(h) heteroaril substituido, como se definió anteriormente.

(i) cicloalquil $-\text{C}_3\text{-C}_6$ -,

(j) cicloalquil $-\text{C}_3\text{-C}_6$ - substituido por el reemplazo independiente de uno, dos o tres átomos de hidrógeno con $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-(\text{CO})$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-(\text{CO})$ -aril, $-(\text{CO})$ -heteroaril, $-\text{CO}_2$ -alquil, $-\text{CO}_2$ -aril, $-\text{CO}_2$ -heteroaril, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{CONH}$ -aril, $-\text{CONH}$ -heteroaril, $-\text{OC}(\text{O})$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{OC}(\text{O})$ -aril, $-\text{OC}(\text{O})$ -heteroaril, $-\text{OCO}_2$ -alquil, $-\text{OCO}_2$ -aril, $-\text{OCO}_2$ -heteroaril, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{CONH}$ -aril, $-\text{CONH}$ -heteroaril, $-\text{NHC}(\text{O})$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{NHC}(\text{O})$ -aril, $-\text{NHC}(\text{O})$ -heteroaril, $-\text{NHCO}_2$ -alquil, $-\text{NHCO}_2$ -aril, $-\text{NHCO}_2$ -heteroaril, $-\text{NHCONH}_2$, $-\text{NHCONH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{NHCONH}$ -aril, $-\text{NHCONH}$ -heteroaril, $-\text{SO}_2$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{SO}_2$ -aril, $-\text{SO}_2$ -heteroaril, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -aril, $-\text{SO}_2\text{NH}$ -heteroaril, alquil- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -, cicloalquil-

C₃-C₆-, -CF₃, -CH₂CF₃, CHCl₂, -CH₂OH, -CH₂CH₂OH, -CH₂NH₂, -CH₂SO₂CH₃, aril, heteroaril, bencil, benciloxi, ariloxi, heteroariloxi, alcoxi-C₁-C₆-, metoximetoxi, metoxietoxi, amino, bencilamino, arilamino, heteroarilamino, alquilamino-C₁-C₃-, tio, ariltio, heteroariltio, benciltio, alquiltio-C₁-C₆-, o metiltiometil.

(k) heterocicloalquil,

(l) heterocicloalquil sustituido, como se definió anteriormente.

(m) -NHC(O)R⁹, donde R⁹ es definido arriba,

(n) -NHC(O)OR¹⁰, donde R¹⁰ es seleccionado entre el grupo que consiste de

(i) alquil -C₁-C₁₂-,

(ii) heteroalquil -C₁-C₁₂-,

donde (i) y (ii) pueden ser opcionalmente sustituidos con uno, dos, o tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de

(1') aril,

(2') aril sustituido, como se definió anteriormente.

(3') heteroaril,

y

(4') heteroaril sustituido, como se definió anteriormente.

(iii) aril,

(iv) aril sustituido, como se definió anteriormente.

(v) heteroaril,

y

(vi) heteroaril sustituido, como se definió anteriormente.

265

70

- (o) $\text{-NHC(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, donde R^{11} y R^{12} son definidos arriba,
- (p) -OC(O)R^{10} , donde R^{10} es definido arriba,
- (q) -OC(O)OR^{10} , donde R^{10} es definido arriba,
- (r) $\text{-OC(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, donde R^{11} y R^{12} son definidos arriba,
- (s) -C(O)R^9 , donde R^9 es definido arriba,
- (t) $\text{-CO}_2\text{R}^9$, donde R^9 es definido arriba,
- y
- (u) $\text{-C(O)NR}^{11}\text{R}^{12}$, donde R^{11} y R^{12} son definidos arriba;

R^4 y R^5 son hidrógeno;

o

R^4 y R^5 juntos son -C(O)- o $\text{-(CH}_2\text{)}_x\text{-}$, donde x es uno, dos, o tres;

o

R^5 y R^6 juntos son -C(O)- o $\text{-(CH}_2\text{)}_x\text{-}$, donde x es definido arriba;

R^7 es seleccionado del grupo que consiste de

- (1) hidrógeno
- (2) alquil $\text{-C}_1\text{-C}_{12}\text{-}$,
- (3) alquenil $\text{-C}_3\text{-C}_{12}\text{-}$,
- (4) alquinil $\text{-C}_3\text{-C}_{12}\text{-}$,
- (5) heteroalquil $\text{-C}_2\text{-C}_{12}\text{-}$,
- (6) heteroalquenil $\text{-C}_4\text{-C}_{12}\text{-}$,
- (7) heteroalquinil $\text{-C}_4\text{-C}_{12}\text{-}$,

donde (2)-(7) pueden ser opcionalmente substituidos con uno, dos, o tres substituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste de

- (a) halo,
- (b) hidroxi,

(c) $-NR^{11}R^{12}$ donde R^{11} y R^{12} son definidos arriba,

(d) aril,

(e) aril sustituido, como se definió anteriormente.

(f) heteroaril, y

(g) heteroaril sustituido, como se definió anteriormente.

(8) $-C(O)R^8$, donde R^8 es definido arriba,

(9) $-CO_2R^8$, donde R^8 es definido arriba,

y

(10) $-C(O)NR^{11}R^{12}$, donde R^{11} y R^{12} son definidos arriba;

y

R^8 es hidrógeno o un grupo protector hidroxil

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R^4 y R^5 son hidrógeno.

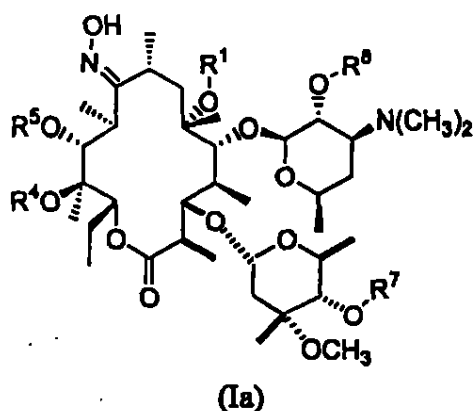
3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R^4 y R^5 juntos son $-C(O)-$.

4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R^6 es hidrógeno.

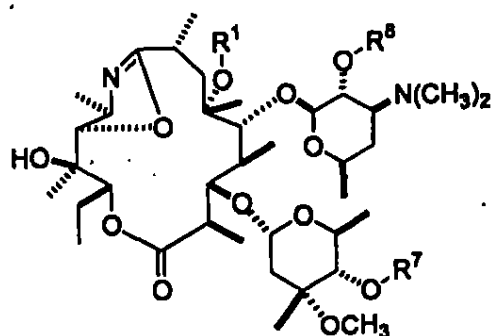
5. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R^6 es metil.

6. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde R^1 es $-CH_2-CH=CH_2$ o $-CH_2-CH=CH-(3\text{-quinolinil})$.

7. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 6, en donde R^1 es $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$.
8. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 6, en donde R^1 es $\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-(3\text{-quinolinil})$.
9. Un método para la preparación de los compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, el método comprende
- (a) reacción de los compuestos de la fórmula (Ia)



En donde R^1 , R^4 , R^5 , R^7 y R^8 son como se definió en la Reivindicación 1, con un agente activador oxima para formar compuestos de fórmula (III)



(III),

(b) reacción del producto del paso (a) con un agente reductor;

(c) opcionalmente, alquilación del producto del paso (b); y

(d) opcionalmente desprotección del producto del Paso (c).

10. El método de acuerdo con la Reivindicación 9, en donde el agente activador oxima es un haluro de sulfonilo.

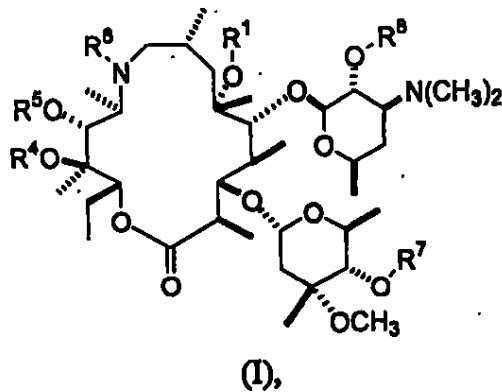
11. El método de acuerdo con la Reivindicación 10, en donde el haluro de sulfonilo es cloruro de para-toluensulfonilo, cloruro de metanosulfonilo, cloruro de para-bromosulfonilo, o cloruro de para-bromosulfonilo.

12. El método de acuerdo con la Reivindicación 9, en donde el agente reductor es borano en tetrahidrofurano, borano•dimetil sulfuro, cianoborohidruro de sodio, o borohidruro de sodio, opcionalmente en presencia de un ácido.

13. El método de acuerdo con la reivindicación 12, en donde el agente reductor es cianoborohidruro de sodio en presencia de ácido.

14. El método de acuerdo con la Reivindicación 13, en donde el ácido es ácido acético.

15. Un compuesto intermediario en la preparación de los compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, el cual tiene la fórmula:



o sales farmacéuticamente aceptables del mismo, en donde R¹, R⁷ y R⁸ son como se definió en la Reivindicación 1.

16. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad farmacéuticamente efectiva de un compuesto de la Reivindicación 1 o de la Reivindicación 15 en combinación con un portador farmacéuticamente aceptable.

17. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o la Reivindicación 15 seleccionado entre el grupo que consiste de

Compuesto de la fórmula (III): R¹ es -CH₂CH=CH₂, R⁴ es hidrógeno, R⁷ es hidrógeno, R⁸ es hidrógeno,

Compuesto de la fórmula (I): R¹ es -CH₂CH=CH₂, R⁴ es hidrógeno, R⁵

270

175

es hidrógeno, R^6 es hidrógeno, R^7 es hidrógeno, R^8 es hidrógeno,
Compuesto de la fórmula (I): R^1 es $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, R^4 es hidrógeno,
 R^5

es hidrógeno, R^6 es metil, R^7 es hidrógeno, R^8 es hidrógeno

y

Compuesto de la fórmula (I): R^1 es $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-(3\text{-quinolinil})$, R^4 es
hidrógeno, R^5 es hidrógeno, R^6 es metil, R^7 es hidrógeno, R^8 es
hidrógeno.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

271

RADICACIÓN: 0-63018

EDICTO No. 6012

**LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:**

Que esta Superintendencia profirió Resolución No. 8022 de 30-MAR-2006. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

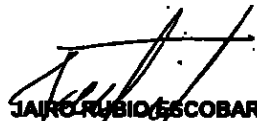
ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud correspondiente a "9A-AZALIDAS CON ACTIVIDAD ANTIBACTERIAL".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Alicia Lloreda Ricaurte, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderada de Abbott Laboratories., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE
Dada en Bogotá, D.C., a los

30 MAR. 2006

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


JAIRO RUBIO ESCOBAR

Para notificar a los interesados, se fija el presente EDICTO en lugar visible al público en la SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, por el término de (10) diez días hábiles contados a partir de las 8:30 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc 18-ABR-2006
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 6012

Este edicto se desfija hoy 02-MAY-2006 a las cinco (5:00 p.m.)