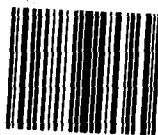


CAVELIER
ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier-abogados.com
E-MAIL: cavelier@colomsat.net.co



00 68921

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

688
692

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00068921 00000001
Fecha (AMD): 2001-01-09 17:05:17
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REQUERIDA
Dependencia: 2620 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Folios: 87

Referencia : Expediente No. 00.068.921

Solicitante : BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Asunto : Solicitud de patente para:
"NUEVOS DERIVADOS DEL ACIDO
AMINODICARBOXILICO CON
PROPIEDADES FARMACEUTICAS"

Fecha de la solicitud : 12 de septiembre de 2000

TRAMITE:02 - EVENTO:01 - ACTUACION:444

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al auto número 3298, notificado por estado del 23 de noviembre de 2000.

2. Mediante el auto número 3298 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. En las reivindicaciones. Presento con este escrito un nuevo pliego reivindicatorio en el cual las antiguas reivindicaciones de uso se dirigen al compuesto de fórmula (I).

Le solicito se sirva aceptar este nuevo capítulo reivindicatorio en sustitución del presentado originalmente.

Finalmente, solicito a Usted muy comedidamente que si el examinador encuentra alguna discrepancia con respecto a alguna de las anteriores explicaciones, éstas sean

CAVELIER

ABOGADOS

693 689

informadas junto con el examen de fondo y no constituyan impedimento substancial para el buen desarrollo de esta solicitud de patente.

2.2. Extracto. Adjunto a este memorial presento nuevo extracto en el cual se indica los sustituyentes correspondientes a los radicales en la estructura de los compuestos de la invención (fórmula I) y nueva tarjeta temática (Formas P-103 y P-104), los cuales están en conformidad con las modificaciones hechas al pliego reivindicatorio.

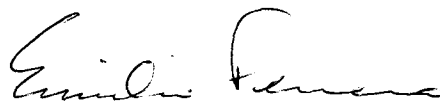
2.3. Recibos. Presento junto con este escrito, el recibo de pago por valor de \$68.000.00 por concepto de modificaciones en solicitud pendiente.

Asimismo presento recibo de pago por valor de \$ 887.000.00 por concepto de los derechos de publicación por palabra adicional.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, - 9 ENE 2001

Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

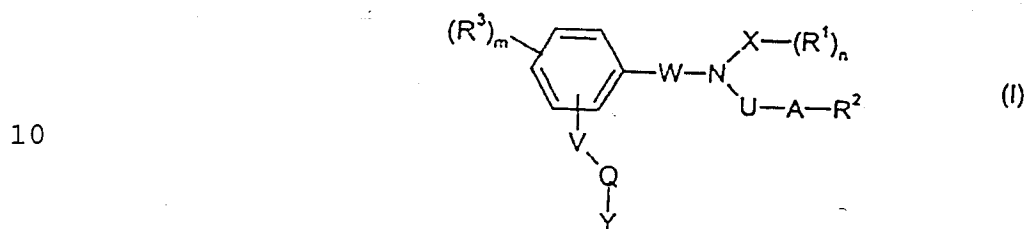
HCA
COLO 00698-801-125-7
JJC-ID-910

5

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula general (I)

(I):



En la que

V falta o es =, NR⁴, NR⁴ CONR⁴, NR⁴ CO, NR⁴ SO₂, COO,
15 CONR⁴ o S (O)O,

En la que

R⁴ es independiente de otro resto R⁴ eventualmente
20 existente, un alquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de
carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono arilalquilo con
7 a 18 átomos de carbono, pudiendo estar sustituido el

5 resto arilo a su vez una o varias veces con halógeno,
alquilo, alcoxi con hasta 6 átomos de carbono,

 ó es 0, 1 ó 2,

10 Q falta o es alquilo de cadena lineal o ramificada,
alquendiilo de cadena lineal o ramificada o alquindiilo de
cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 12 átomos de
carbono, pudiendo tener cada uno, uno o varios grupos
seleccionados entre O, S(O)p, NR⁵, CO, NR⁵ SO₂ o CONR⁵ y
15 pudiendo estar sustituidos una o varias veces con halógeno,
hidroxi o alcoxi con hasta 4 átomos de carbono, donde
eventualmente dos átomos cualquiera de la cadena anterior
pueden estar unidos entre sí formando un anillo de tres a ocho
elementos,

20

 en la que

 R⁵ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o,
ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo

- 5 con 3 a 8 átomos de carbono que puede estar sustituido con halógeno o alcoxi con hasta 4 átomos de carbono,
- p es 0, 1 ó 2,
- 10 Y es hidrógeno, $\text{NR}^8 \text{R}^9$, arilo con 6 a 10 átomos de carbono un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O o cicloalquilo de cadena lineal o ramificada con 3 a 8 átomos de carbono, que también pueden estar unidos a
- 15 través del N, pudiendo estar sustituido cada uno de los restos cíclicos de una a tres veces con alquilo de cadena lineal o ramificada, alqueno de cadena lineal, alquino de cadena lineal o ramificada ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada,, halógenoalquilo de cadena
- 20 lineal o ramificada, alogenoalcoxi de cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo de cadena lineal o ramificada con 3 a 8 átomos de carbono, halógeno, hidroxilo, CN, SR^6 , NO_2 , $\text{NR}^8 \text{R}^9$, $\text{NR}^7 \text{COR}^7$, $\text{NR}^7 \text{CONR}^7 \text{R}^{10}$ o $\text{CONR}^{11} \text{R}^{12}$,

5

en la que

10

R^6 es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

15

R^7 es independientemente de otro resto R^7 eventualmente existente hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono

20

R^8 , R^9 , R^{11} y R^{12} son, independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, alquenilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 al 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N

5 y/o 0, arilalquilo con 8 a 18 átomos de carbono,
cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono o un
resto di fórmula SO_2R^{13} , pudiendo estar sustituido el
resto de arilo a su vez una o varias veces con
halógeno, hidróxi, CN, NO_2 , NH_2 , NHCOR^7 , alquilo,
10 alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con
hasta 6 átomos de carbono, donde eventualmente dos
sustituyentes de entre R^8 y R^9 o R^{11} y R^{12} pueden
estar unidos entre sí formando un anillo de cinco o
seis elementos, que puede contener O o N,

15

en la que

20

R^{13} es alquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos
de carbono, donde el resto de arilo a su vez puede
estar sustituido una o varias veces con halógeno CN,
 NO_2 , alquilo, alcoxi, halógenoalquilo con hasta 6
átomos de carbono,

5 R^{10} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 12 átomos de carbono, alqueno
de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de
carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un
heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y
10 hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o o
cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, que a su vez
pueden estar sustituidos con halógeno, hidroxilo, CN,
NO₂, NH₂, NHCOR⁷, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo,
alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6
15 átomos de carbono;

y/o los restos cíclicos pueden estar sustituidos cada
uno de ellos de una a tres veces con arilo con 6 a 10
átomos de carbono, un heterociclo aromático o saturado con
20 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie
S, N y/o O, que también pueden estar unidos mediante el
N, los cuales pueden estar unidos directamente o mediante
un grupo seleccionado entre O, S, SO, SO₂, NR⁷, SO₂ NR⁷, CONR⁷,
alquileno de cadena lineal o ramificada, alqueno de

5 cadena lineal o ramificada, alquiloxi de cadena lineal o
ramificada, oxialquiloxi de cadena lineal o ramificada,
sulfonilalquilo de cadena lineal o ramificada,
tioalquilo de cadena lineal o ramificada, cada uno
con hasta 8 átomos de carbono, pudiendo estar sustituidos
10 de una a tres veces con alquilo de cadena lineal o
ramificada, alcoxi de cadena lineal o alógenoalquilo de
cadena lineal o ramificada, alógenoalcoxi de cadena lineal
o ramificada, carbonilalquilo o alquenilo de cadena
lineal o ramificada, cada uno con hasta 6 átomos de
15 carbono, alógeno, SR^6 , CN , NO_2 , NR^8 , R^9 , $CONR^{15}$, R^{16} o NR^{14}
 COR^{17} ,

en la que

20 R^{14} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con
3 a 8 átomos de carbono,

5 R^{15} , R^{16} independientemente uno de otro, son
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3
átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de
carbono o, arilo con 6 a 10 átomos de carbono o un
10 resto de fórmula $SO_2 R^{18}$, pudiendo estar a su vez el
resto arilo una o varias veces sustituido con
halógeno, hidraxi, CN , NO_2 , NH_2 , $NHCOR^7$ alquilo,
halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos
de carbono,

15

en la que

R^{18} es alquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos
20 de carbono, pudiendo estar a su vez el resto arilo una
o varias veces sustituido con halógeno, hidroxí,
 $CN, NO_2, NH_2, NHCOR_7$, hasta 6 átomos de carbono,

y

5

10

15

20

R^{17} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, con hasta 12 átomos de carbono, alquenilo de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N, y/o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbon, los cuales a su vez pueden estar sustituidos con halógeno, hidroxí, CN, NO₂, NH₂, NHCOR⁷ alquilo, alcoxi, halogenoalquilo o halogenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono;

y/o los restos cíclicos pueden estar condensados con un carbociclo aromático o saturado con 1 a 10 átomos de carbono o un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O,

5 R^3 es hidrógeno, halógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada o alcoxycarbonilo, cada uno con hasta 4 átomos de carbono, CN, NO₂ o NR¹⁹R²⁰.

10

en la que

R^{19} y R^{20} son independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

15

m es un número entero de 1 a 4,

20

W es alquilenos de cadena lineal o ramificada, con hasta 6 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono, pudiendo contener cada uno un grupo seleccionado entre O, S (O)_q, NR²¹, CO o CONR²¹ o CO, NHCO o OCO,

5

en la que

q es 0, 1 ó 2.

10 R^{21} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

U es un alquilo de cadena lineal o ramificada con
15 hasta 4 átomos de carbono,

A es arilo con 6 a 10 átomos de carbono o un heterocicloaromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O, los cuales a su vez
20 pueden estar sustituidos una a tres veces con halógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada, halógenoalcoxi o alcoxycarbonilo con hasta 4 átomos de carbono, CN, NO₂ o NR²² R²³,

5

en la que

10 R^{22} y R^{23} es cada uno de ellos independientemente
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8
átomos decarbono, carbonialquilo o sulfonilalquilo,

R^{22} es tetrazolilo, COOR^{24} o $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}$,

15 en la que

R^{24} es hidrógeno, alquilo con 1 hasta 8 átomos
de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de
carbono

20 R^{25} y R^{26} son independientemente uno de otro
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3
a 8 átomos de carbono o un resto de fórmula SO_2
 R^{27} ,

5

o R^{25} y R^{26} forman juntos un anillo de cinco a seis elementos que puede contener N o O,

en la que

10

R^{27} es alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos de carbono, pudiendo estar a su vez el resto arilo una o varias veces sustituido con halógeno, CN, NO_2 , alquilo, alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono,

15

X es quileno de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono, pudiendo contener cada uno, de uno a tres grupos seleccionado entre O, $S(O)_r$, NR^{28} , CO o $CONR^{29}$, arilo o ariloxi con 6 a 10 átomos de carbono, pudiendo estar sustituido el resto arilo a su vez una vez o varias veces con alógeno,

20

5 CN, NO₂, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo o
halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono, donde
eventualmente dos átomos cualquiera de la cadena anterior
están unidos mediante una cadena alquilo formando de uno a
tres anillos de ocho elementos,

10

en la que

r es 0, 1 ó 2,

15 R²⁸ es hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono
o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

R²⁹ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 8 átomos de carbono o

20 cicloalquilo con 3 átomos de carbono,

n es 1 ó 2;

R¹ es tetrazolilo, COOR³⁰ o CONR³¹R³²,

5

en la que

R^{30} es hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono

10

R^{31} y R^{32} son independientemente uno de otro hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono o un resto de fórmula $SO_2 R^{33}$,

15

en la que

R^{33} es alquilo de cadena lineal ramificada con hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos de carbono, pudiendo estar el resto arilo a su vez sustituido una o varias veces con halógeno, CN, NO_2 , alquilo, alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono,

20

~~704~~
~~705~~
709

5

así como sus estereoisómeros y sales.

2. Compuestos según la reivindicación 1, en los que

10 V falta o es 0, NR^4 , NR^4CONR^4 , NR^4CO NR^4SO_2 , COO ,
 CONR^4 o S(O)_2 .

en la que

15 R^4 es independientemente de otro resto R^4
eventualmente existente, hidrógeno, alquilo de
cadenalinear o ramificada con hasta 8 átomos de
carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,
arilo con 6 a 10 átomos de carbono o arilalquilo
20 con 7 a 18 átomos de carbono, pudiendo estar
sustituido el resto arilo a su vez una o varias
veces con halógeno, alquilo, alcoxi con hasta
6 átomos de carbono,

5 ó es 0, 1 ó 2,

Q falta o es alquilo de cadena lineal o ramificada,
alquendiilo de cadena lineal o ramificada o alquindiilo de
cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 12 átomos de
10 carbono, pudiendo tener cada uno, uno o varios grupos
seleccionados entre 0, S(O)_p, NR⁵, CO, NR⁵ SO₂ o CONR⁵ y
pudiendo estar sustituidos una o varias veces con halógeno,
hidroxi o alcoxi con hasta 4 átomos de carbono, donde
eventualmente dos átomos cualquiera de la cadena anterior
15 pueden estar unidos entre sí formando un anillo de tres a
ocho elementos,

en la que

R⁵ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
20 ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo
con 3 a 8 átomos de carbono, que puede estar sustituido
con halógeno o alcoxi con hasta 4 átomos de carbono,

p es 0, 1 ó 2,

707
711

5

Y es hidrógeno, $\text{NR}^8 \text{R}^9$, arilo con 6 a 10 átomos de carbono un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O o cicloalquilo de cadena lineal o ramificada con 3 a 10 8 átomos de carbono, que también pueden estar unidos a través del N, pudiendo estar sustituido cada uno de los restos cíclicos una a tres veces con alquilo de cadena lineal o ramificada, alqueno de cadena lineal o ramificada, alquino de cadena lineal o ramificada, alcoxi de 15 de cadena lineal o ramificada, alcoxialcoxi de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada, halógenoalcoxi de cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 20 cadena lineal o ramificada con 3 a 8 átomos de carbono, átomos de carbono, halógeno, hidroxilo, CN, SR^6 , NO_2 , $\text{NR}^8 \text{R}^9$, $\text{NR}^7 \text{COR}^{10}$, $\text{NR}^7 \text{CONR}^7 \text{R}^{10}$ o $\text{CONR}^{11} \text{R}^{12}$,

en la que

5 R^6 es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

10

R^7 es independientemente de otro resto R^7 eventualmente presente, hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

15

R^8 , R^9 , R^{11} y R^{12} son, independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, alqueno de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O, arilalquilo con 8 a 18 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono o un resto de fórmula SO_2R^{13} , pudiendo estar

20

5 sustituido el resto arilo a su vez una a varias veces con
halógeno, hidroxí CN, NO₂, NH₂, NHCOR⁷, alquilo, alcoxi,
halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de
carbono, donde eventualmente dos sustituyentes de entre
R⁸ y R⁹ o R¹¹ y R¹² pueden estar unidos entre sí formando un
10 anillo de cinco o seis elementos, que puede contener O o
N,

en la que

R¹³ es alquilo de cadena lineal o ramificada con
15 hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10
átomos de carbono, donde el resto de arilo a su
vez puede estar sustituido una o varias veces con
halógeno, CN, NO₂, alquilo, alcoxi,
halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6
20 átomos de carbono,

R¹⁰ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 12 átomos de carbono, alqueno de
cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de

5 carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S,N y/o o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, que a su vez pueden estar sustituidos con halógeno, hidroxí, CN, NO₂, NH₂. NHCOR⁷,
10 alquilo, alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono;

y/o los restos cíclicos pueden estar sustituidos cada uno de ellos de una a tres veces con arilo con 6 a 10
15 átomos de carbono, un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O, que también pueden estar unidos mediante el N, los cuales pueden estar unidos directamente o mediante un grupo seleccionado entre O,S, SO, SO₂,NR⁷ SO₂
20 NR⁷,CONR⁷, alquilenos de cadena lineal o ramificada, alquendiilo de cadena lineal o ramificada, alquiloxi de cadena lineal o ramificada, oxialquiloxi de cadena lineal o ramificada, sulfonilalquilo de cadena lineal o ramificada, tioalquilo de cadena lineal o ramificada, cada

5 uno con hasta 8 átomos de carbono, pudiendo estar
sustituídos de una a tres veces con alquilo de cadena
lineal o ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada,
alcoxialcoxi de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo
de cadena lineal o ramificada, halógeno alcoxi de
10 cadena lineal o ramificada, carbonilalquiloalqueno de
cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 6 átomos
de carbono, halógeno, SR^6 , CN , NO_2 , $NR^8 R^9$, $CONR^{15} R^{16}$ o NR^{14}
 COR^{17}

15 en la que

R^{14} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 8 átomos de carbono o
cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono,

20

R^{15} , R^{16} independientemente uno de otro, son
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos
de carbono o un resto de fórmula SO_2R^{18} ,

5

en la que

10 R^{18} es alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono o arilo con 6 a 10 átomos de carbono, pudiendo estar a su vez el resto arilo una o varias veces sustituido con halógeno, CN, NO₂, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo o halógenoalcoxi con hasta 6 átomos de carbono,

15 R^{17} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono, Alquenilo de cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 a 9
20 átomos y hasta 3 heteroátomos de la serie S,N, y/o O o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, los cuales a su vez estar sustituidos con halógeno, CN, NO₂, alquilo, alcoxi,

5 halógenoalquilo o halógenolacoxi con hasta 6 átomos de carbono;

y/o los restos cíclicos pueden estar condensados con un carbociclo aromático o saturado con 1 a 10
10 átomos de carbono o un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O.

R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo de cadena lineal o
15 ramificada, halogenoalquilo de cadena lineal o ramificada o alcoxi de cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 4 átomos de carbono,

m es un número entero de 1 a 4,
20

w es alquilenos de cadena lineal o ramificada o alquendiilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono,

5 U es CH_2- ,

A es fenilo o un heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N y/o O, los cuales a su vez pueden estar sustituidos una
10 a tres veces con halógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada, con hasta 4 átomos de carbono,

15 R^2 es COOR^{24}

en la que

R^{24} es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono,

20

X es alquilenos de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o ramificada con hasta 8 átomos de carbono, pudiendo contener

5 cada uno, de uno a tres grupos seleccionados entre fenilo,
feniloxi, O, CO o CONR²⁹,

en la que

10 R²⁹ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 6 átomos de carbono o
cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

n es 1 ó 2;

15

R¹ es COOR³⁰,

en la que

20 R³⁰ es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 6 átomos de carbono.

3. Compuestos según la reivindicación 1,

5 en los que

V falta o es O, S o NR^4 ,

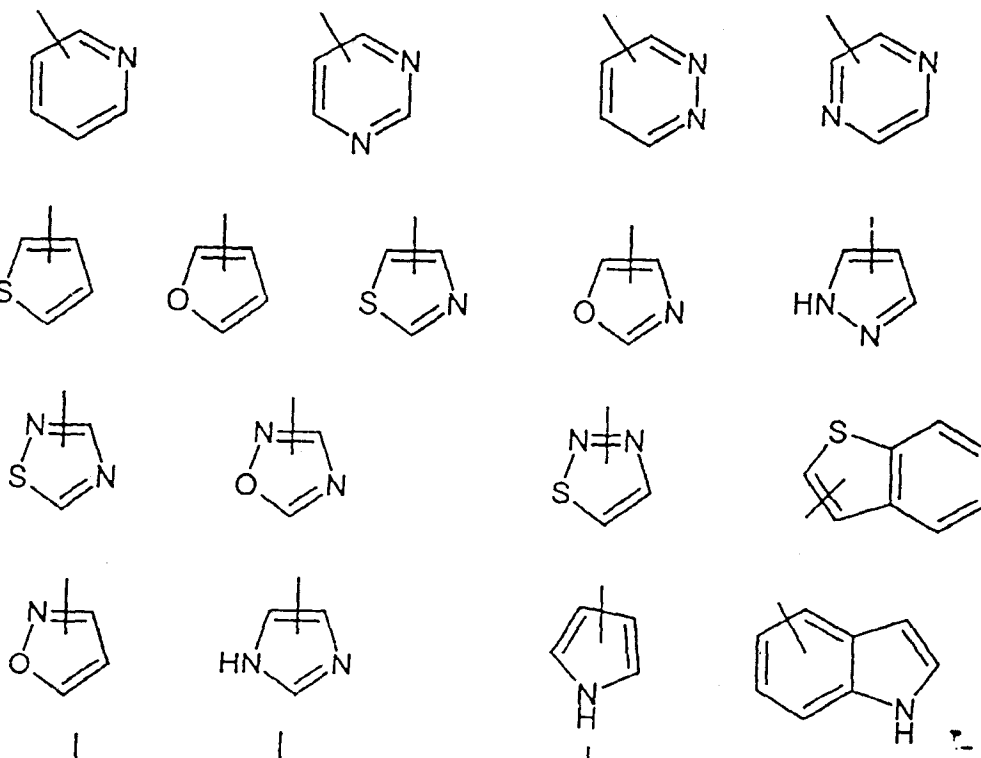
en la que

10

R^4 es hidrógeno o metilo,

Q falta o es alquileo de cadena lineal o ramificada con hasta 9 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o ramificada o alquindiilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono, pudiendo estar sustituidos con halógeno

Y es H, NR^8R^9 , ciclohexilo, fenilo, naftilo o un
20 heterociclo seleccionado entre el grupo



5

10

15 que también pueden estar unidos a través del N, pudiendo
estar sustituido cada uno de los restos cíclicos
sustituidos de una a tres veces con alquilo de cadena
lineal o ramificada, alquenido de cadena lineal o
ramificada, alquinilo de cadena lineal o ramificada,
20 alcoxi de cadena lineal o ramificada, alcoxialcoxi de
cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena
lineal o ramificada, halógenoalcoxi de cadena lineal o
ramificada, cada uno con hasta 4 átomos de carbono o
cicloalquilo de cadena lineal o ramificada con 3 a 6 átomos

5 de carbono, F, Cl, Br, I, NO₂, SR⁶, NR⁸R⁹, NR⁷COR¹⁰ o
CONR¹¹R¹²,

en la que

10 R⁶ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 8 átomos de carbono o halógenoalquilo de
cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de
carbono,

15 R⁷ es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 4 átomos de carbono o fenilo,

R⁸, R⁹, R¹¹ y R¹² son, independientemente unos de otros
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta
4 átomos de carbono o fenilo,

20

donde el resto de fenilo puede estar sustituido una a
tres veces con F, Cl, Br, hidroxí, metilo, etilo, n-
propilo, i-propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo,
metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO₂, CF₃, OCF₃, o CN, o

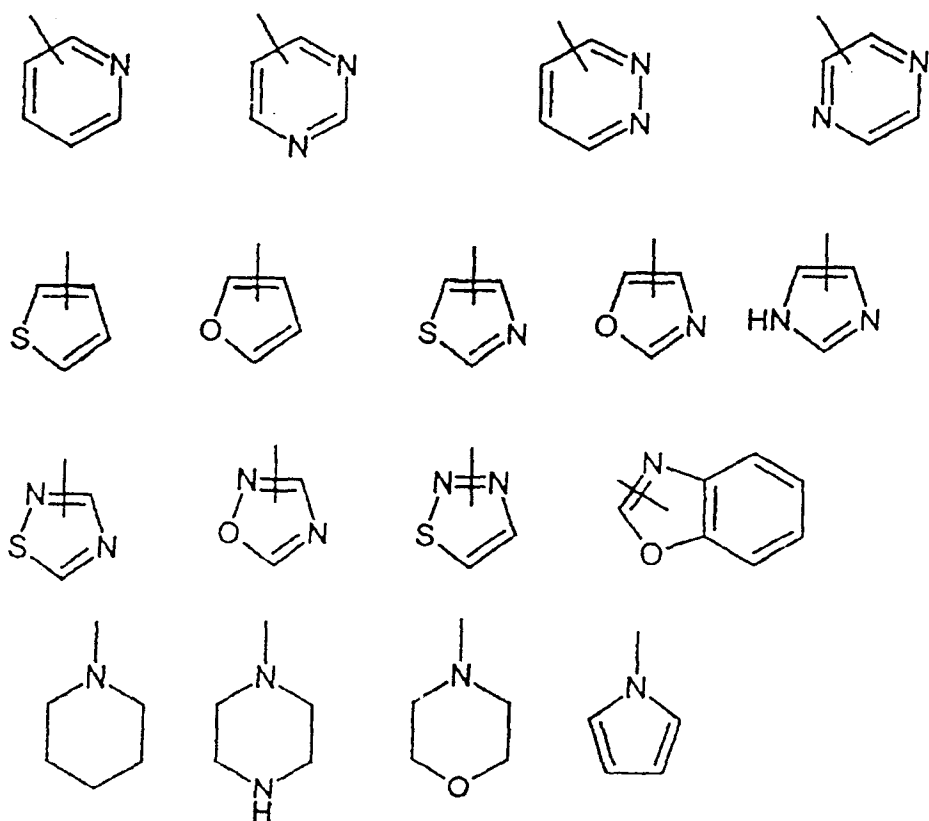
5 dos sustituyentes de entre R^8 y R^9 o R^{11} y R^{12} pueden estar
unidos entre sí formando un anillo de cinco o seis
elementos, que puede contener O o N,

R^{10} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
10 ramificada con hasta 4 átomos de carbono o fenilo, donde el
resto de fenilo puede estar sustituido de una a tres
veces con F, Cl, Br, hidroxilo, metilo, etilo, n-propilo, i-
propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi,
etoxi, amino, acetilamino, NO_2 , CF_3 , OCF_3 o CN;

15

y/o los restos cíclicos pueden estar sustituidos
cada uno de ellos de una a tres veces con fenilo o un
heterociclo del grupo

20



5

10

los cuales pueden estar unidos directamente o
15 mediante un grupo seleccionado entre O, S, SO, SO₂, NR⁴,
SO₂NR⁷, CONR⁷, alquilenos de cadena lineal o ramificada,
alquendiilo de cadena lineal o ramificada, alquiloxi de
cadena lineal o ramificada, oxialquiloxi de cadena lineal
o ramificada, sulfonilalquílo de cadena lineal o
20 ramificada, tioalquilo de cadena lineal o ramificada, cada
uno con hasta 4 átomos de carbono, pudiendo estar
sustituídos de una a tres veces con alquilo de cadena
lineal o ramificada, alcoxi de cadena lineal o ramificada,
alcoxialcoxi de cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo

5 de cadena lineal o ramificada o alqueno de
cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 4
átomos de carbono, F, Cl, Br, I, CN, SCH₃, OCF₃, NO₂, NR⁸R⁹ o
NR¹⁴COR¹⁷,

10 en la que

R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8
átomos de carbono,

15 y

R¹⁷ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 12 átomos de carbono, alqueno de
cadena lineal o ramificada con hasta 12 átomos de carbono,
20 arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo
aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3
heteroátomos de la serie S, N, y/o O o cicloalquilo con
3 a 8 átomos de carbono, los cuales a su vez pueden estar
sustituídos con F, Cl, Br, hidroxí, metilo, etilo, n-

5 propilo, i-propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo,
metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO_2 , CF_3 , OCF_3 o CN

y/o los restos cíclicos pueden estar condensados
con un carbociclo aromático o saturado con 1 a 10 átomos de
10 carbono o un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9
átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N
y/o O.

R³ es hidrógeno o flúor

15

m es un número entero de 1 a 4,

w es CH_2 , $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}=\text{CHCH}_2$,

20

u es $-\text{CH}_2-$,

A es fenilo, piridilo, tienilo o tiazolilo, que
eventualmente puede estar sustituido de una a tres veces
con metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-

5 butilo, s-butilo, t-butilo, CF_3 , metoxi, etoxi, F, Cl,
Br,

R^2 es COOR^{24} ,

10 en la que

R^{24} es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono,

15 X es alquileo de cadena lineal o ramificada con
hasta 8 átomos de carbono o alquendíilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 8 átomos de carbono, pudiendo contener
cada uno, de uno a tres grupos seleccionado entre fenilo,
feniloxi, O, CO o CONR^{30} ,

20 en la que

R^{30} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 6 átomos de carbono o
cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

5

n es 1 ó 2;

R¹ es COOR³⁵,

10

en la que

R³⁵ es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono.

15 4. Compuestos según la reivindicación 1,

en los que

V es 0,

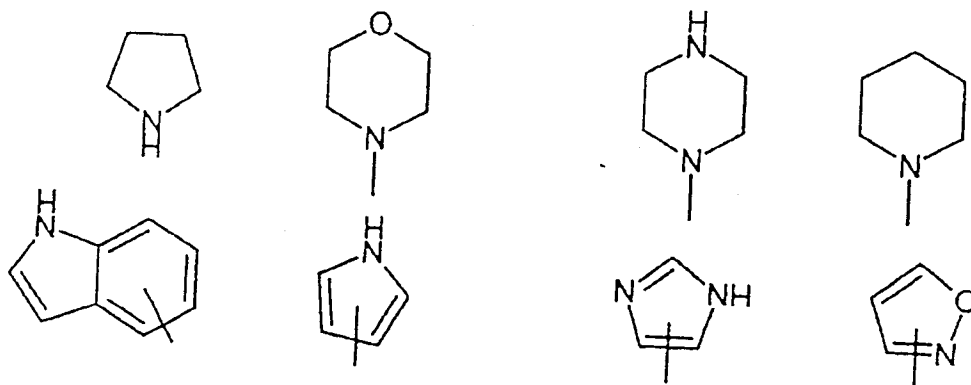
20

Q es alquilenos de cadena lineal o ramificada con hasta 9 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o ramificada o alquindiilo de cadena lineal o ramificada con

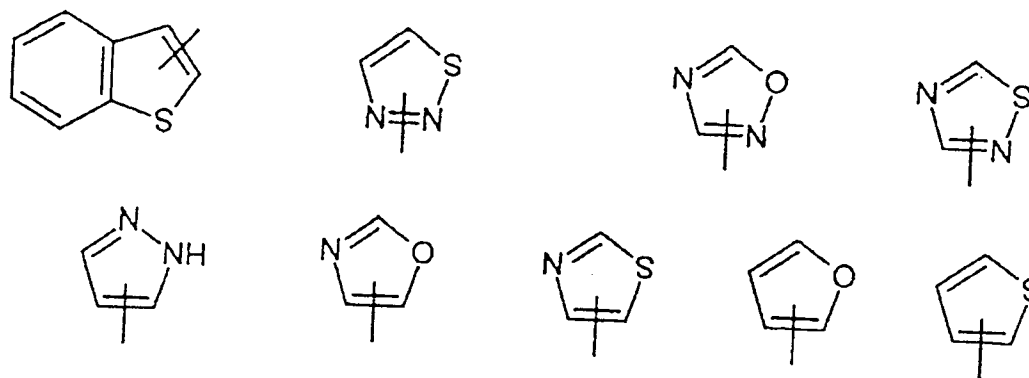
5 hasta 4 átomos de carbono, pudiendo estar sustituido una vez con halógeno,

y es H, ciclohexilo, fenilo o un heterociclo del grupo ,

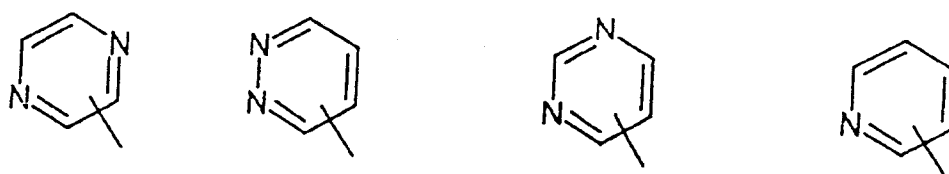
10



15



20



pudiendo estar sustituido cada uno de los restos cíclicos una a tres veces con alquilo de cadena lineal o ramificada, alquenilo de cadena lineal o

5 ramificada, alquínilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi
de cadena lineal o ramificada, alcoxialcoxi de cadena
lineal o ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o
ramificada, halógenoalcoxi de cadena lineal o ramificada,
cada uno con hasta 4 átomos de carbono o cicloalquilo de
10 cadena lineal o ramificada con 3 a 6 átomos de carbono, F,
Cl, Br, I, NO₂, SR⁶, NR⁸R⁹, NR⁷COR¹⁰ o CONR¹¹R¹²

en la que

15 R⁶ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono o
halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada con
hasta 4 átomos de carbono,

20 R⁷ es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono,

R⁸, R⁹, R¹¹ y R¹² son, independientemente unos de otros
hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta

5 4 átomos de carbono o fenilo, donde el resto de fenilo
puede estar sustituido una a tres veces con F, Cl, Br,
hidroxi, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, s-
butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino,
acetilamino, NO₂, CF₃, OCF₃ o CN,

10

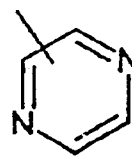
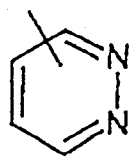
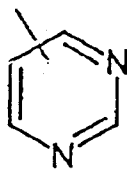
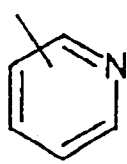
o dos sustituyentes seleccionados entre R⁸ y R⁹ o R¹¹ y
R¹² pueden estar unidos entre sí formando un anillo de cinco
o seis elementos, que puede contener O o N,

15 R¹⁰ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 4 átomos de carbono o fenilo, donde el resto de
fenilo puede estar sustituido de una a tres veces con F,
Cl, Br, hidroxi, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-
butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino,
20 acetilamino, NO₂, CF₃, OCF₃ o CN;

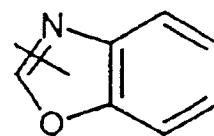
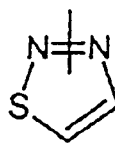
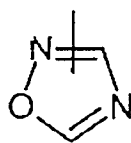
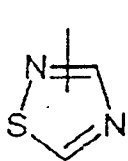
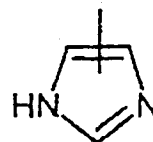
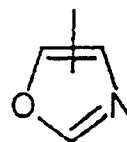
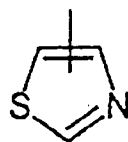
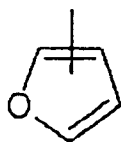
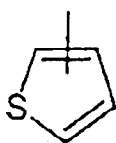
y/o los restos cíclicos pueden estar sustituidos cada
uno de ellos de una a tres veces con fenilo o un
heterociclo del grupo

728
772

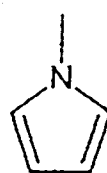
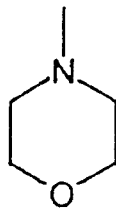
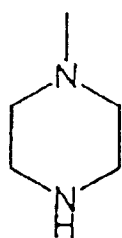
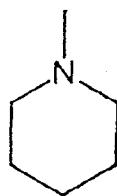
5



10



15



los cuales pueden estar unidos directamente o mediante un grupo seleccionados entre O, S, SO, SO₂, alquilenos de cadena lineal o ramificada, alquendiilo de cadena lineal o ramificada, alquiloxi de cadena lineal o ramificada, oxialquiloxi de cadena lineal o ramificada, sulfonilalquilo de cadena lineal o ramificada, tioalquilo de cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 4 átomos de carbono, pudiendo estar sustituidos de una a tres veces

5 con alquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de
cadena lineal o ramificada, alcoxialcoxi de cadena lineal o
ramificada, halógenoalquilo: de cadena lineal o
ramificada o alqueno de cadena lineal o ramificada,
cada uno con hasta 4 átomos de carbono, F, Cl, Br, I,
10 CN, SCH₃, OCF₃, NO₂, NR⁸R⁹ o NR¹⁴COR¹⁷,

en la que

R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
15 ramificada con hasta 6 átomos de carbono o cicloalquilo
con 3 a 6 átomos de carbono,

y

R¹⁷ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
20 ramificada con hasta 6 átomos de carbono, alqueno de
cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de
carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un
heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y
hasta 3 heteroátomos de la serie S, N, y/o O o

5 cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, los cuales a su vez pueden estar sustituidos con F, Cl, Br, hidroxí, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO₂, CF₃, OCF₃ o CN,

10

y/o los restos cíclicos pueden estar condensados con un carbociclo aromático saturado con 1 a 10 átomos de carbono o un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3

15

heteroátomos de la serie S, N y/o O.

R³ es hidrógeno o flúor

m es un número entero de 1 a 2,

20

w es -CH₂, o -CH₂ CH₂,

u es -CH₂-,

A es fenilo, que eventualmente puede estar sustituido de una a tres veces con metilo, etilo, n-propilo, i-

5 propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, CF_3 ,
metoxi, etoxi, F, Cl, Br,

R^2 es COOR^{24} ,

10 En la que

R^{24} es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono,

15 X es alquileo de cadena lineal o ramificada con
hasta 6 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 6 átomos de carbono, pudiendo contener
cada uno, de uno a tres grupos seleccionados entre fenilo,
feniloxi, O, CO o CONR^{3n} ,

20

en la que

5 R^{30} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 6 átomos de carbono o
cícloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

n es 1 ó 2;

10

R^1 es $COOR^{35}$,

en la que

15

R^{35} es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono.

5. Compuestos según la reivindicación 1,

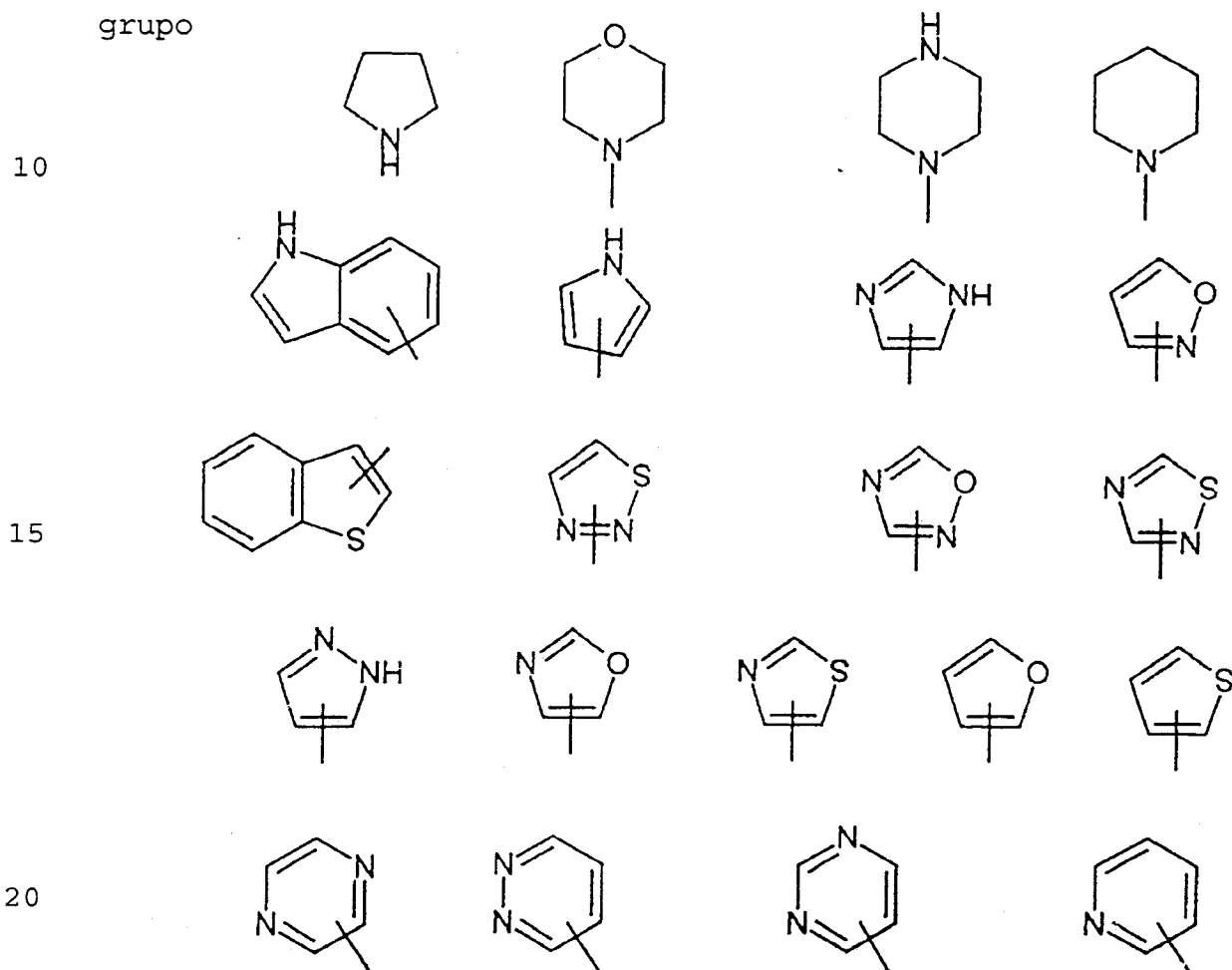
20 en los que

V es 0,

Q es alquileno de cadena lineal o ramificada con
hasta 9 átomos de carbono o alquendiilo de cadena lineal o
ramificada o alquindiilo de cadena lineal o ramificada con

5 hasta 4 átomos de carbono, pudiendo estar sustituido una vez con halógeno,

Y es H, ciclohexilo, fenilo o un heterociclo del grupo



pudiendo estar sustituido cada uno de los estos cíclicos una a tres veces con alquilo de cadena lineal o ramificada, alqueno de cadena lineal o ramificada,

5 alquínilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de cadena
lineal o ramificada, alcoxialcoxi de cadena lineal o
ramificada, halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada,
halógenoalcoxi de cadena lineal o ramificada, cada uno
con hasta 4 átomos de carbono o cicloalquilo de cadena
10 lineal o ramificada con 3 a 6 átomos de carbono, F, Cl, Br,
I, NO₂, SR⁶, NR⁸R⁹, NR⁷COR¹⁰ o CONR¹¹R¹²,

en la que

15 R⁶ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono o
halógenoalquilo de cadena lineal o ramificada
con hasta 4 átomos de carbono,

20 R⁷ es hidrógeno o alquilo de cadena lineal o
ramificada con hasta 4 átomos de carbono,

5 R^8 , R^9 , R^{11} y R^{12} son, independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono o fenilo,

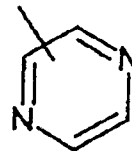
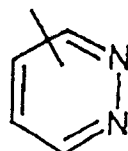
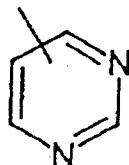
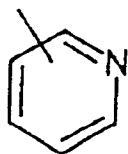
donde el resto de fenilo puede estar sustituido una a tres veces con F, Cl, Br, hidroxí, metilo, etilo, n-
10 propilo, i-propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , CN, o dos sustituyentes seleccionados entre R^8 y R^9 o R^{11} y R^{12} pueden estar unidos entre sí formando un anillo de cinco o seis elementos, que puede contener O o N,

15

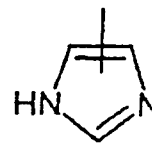
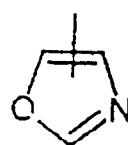
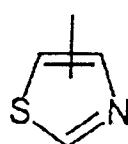
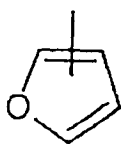
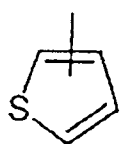
R^{10} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 4 átomos de carbono o fenilo, donde el resto de fenilo puede estar sustituido de una a tres veces con F, Cl, Br, hidroxí, metilo, etilo, n- propilo, i-
20 propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO_2 , CF_3 , OCF_3 o CN;

- 5 y/o los restos cíclicos pueden estar sustituidos cada uno de ellos de una a tres veces con fenilo o un heterociclo del grupo

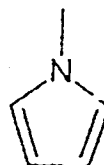
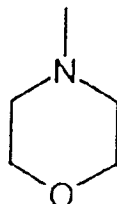
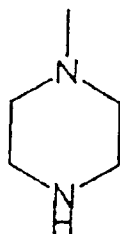
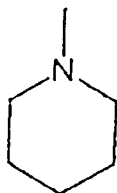
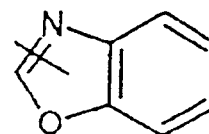
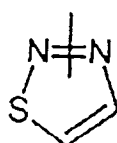
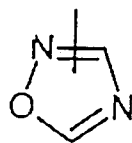
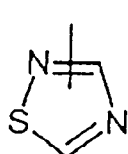
10



15



20



los cuales pueden estar unidos directamente o mediante un grupo seleccionados entre O, S, SO, SO₂, alquilenos de cadena lineal o ramificada, alquendiilo de

5 cadena lineal o ramificada, alquiloxi de cadena lineal o
ramificada, oxialquiloxi de cadena lineal o ramificada,
sulfonilalquilo de cadena lineal o ramificada, tioalquilo
de cadena lineal o ramificada, cada uno con hasta 4 átomos
de carbono, pudiendo estar sustituidos de o una a tres
10 veces con alquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi de
cadena lineal o ramificada, alcoxialcoxi de
cadena lineal o ramificada, halógenoalquilo de
cadena lineal o ramificada o alqueno de cadena
lineal o ramificada, cada uno con hasta 4 átomos de
15 carbono, F, Cl, Br, I, CN, SCH₃, OCF₃, NO₂, NR⁶R⁹ o NR¹⁴COR¹⁷

en la que

R¹⁴ es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o
20 ramificada con hasta 6 átomos de carbono o cicloalquilo con
3 a 6 átomos de carbono,

y

5 R^{17} es hidrógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono, alquenilo de cadena lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono, arilo con 6 a 10 átomos de carbono, un heterociclo aromático con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, N, 10 y/o 0 o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, los cuales a su vez pueden estar sustituidos con F, Cl, Br, hidroxilo, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, s-butilo, i-butilo, t-butilo, metoxi, etoxi, amino, acetilamino, NO_2 , CF_3 , OCF_3 o CN,

15

y/o los restos cíclicos pueden estar condensados con un carbociclo aromático o saturado con 1 a 10 átomos de carbono o un heterociclo aromático o saturado con 1 a 9 átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos de la serie S, 20 N y/o 0.

R^3 es hidrógeno o flúor

m es un número entero de 1 a 2,

5

W es $-\text{CH}_2-$, o $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$,

U es $-\text{CH}_2-$,

A es fenilo, que eventualmente puede estar
sustituido de una a tres veces con metilo, etilo, n-
10 propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-
butilo,

CF_3 , metoxi, etoxi, F, Cl, Br,

R² es COOH ,

15

X es alquileo de cadena lineal o ramificada con
hasta 6 átomos de carbono o alquendiilo de cadena
lineal o ramificada con hasta 6 átomos de carbono,
pudiendo contener cada uno, de uno a tres grupos
20 seleccionados entre feniloxi, O, CO o CONR^{30} ,
en la que

n es 1 ó 2;

6. Compuestos según la reivindicación 1,

15

v es 0,

Q es CH_2 ,

20 Y es fenilo, sustituido con un resto seleccionado del grupo constituido por 2-feniletilo, ciclohexilo, 4-clorofenilo, 4-metoxifenilo, 4-trifluorometilfenilo, 4-cianofenilo, 4-clorofenoxi, 4-metoxifenoxi, 4-trifluorometilfenoxi, 4-cianofenoxi, 4-metilfenilo,

5

R^3 es hidrógeno o flúor

m es un número entero de 1 a 2,

W es $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$,

U es $-\text{CH}_2-$,

10

A es fenilo,

R^2 es COOH , estando R^4 en la posición 4 respecto a U ,

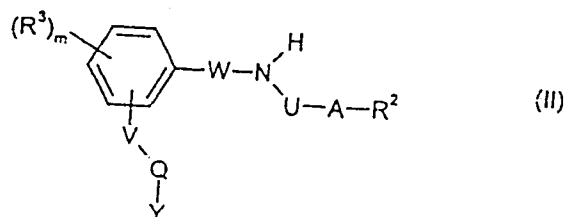
15

X es $(\text{CH}_2)_4$

R^1 es COOH .

7. Procedimiento para la producción de compuestos de
fórmula general (I), caracterizado porque

[A] Los compuestos de fórmula (II) reaccionan



5

10 con compuestos de fórmula (III)



en la que

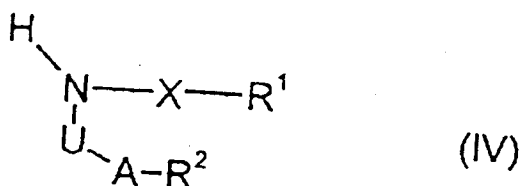
15

R^1 , R^2 , R^3 , V, Q, Y, W, X, U, A y m tienen los mismos significados que en la reivindicación 1,

E es un grupo nucleófilo que en presencia de una base está sustituido o es una función hidroxil eventualment
20 activada;

o

[B] Los compuestos de fórmula (IV) reaccionan

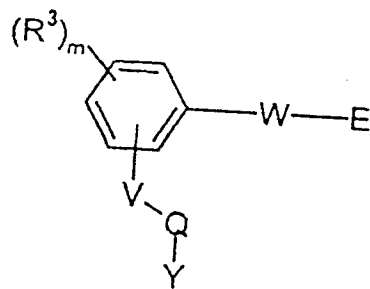


5

10

con compuestos de fórmula (V)

15



(V)

en la que

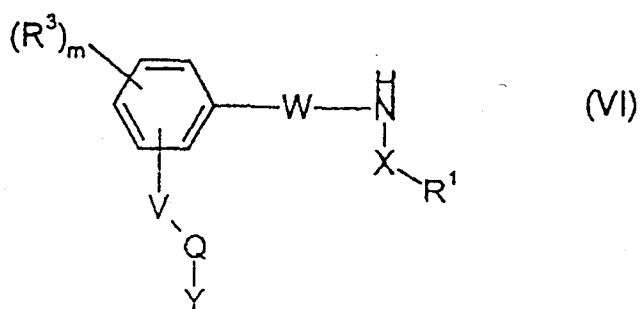
20

R^1 , R^2 , R^3 , V , Q , Y , W , X , U , A y m tienen los mismos significados que en la reivindicación 1,

5 E es un grupo nucleófilo que en presencia de una base está sustituido o es una función hidroxil eventualmente activada;

[C] Los compuestos de fórmula (VI) reaccionan

10



15

con compuestos de fórmula (VII)

E-U-A-R² (VII)

en la que

20

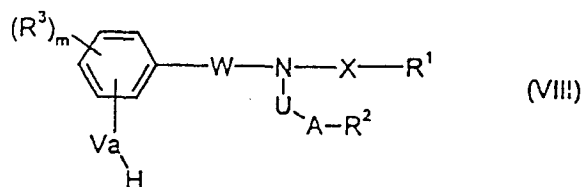
R¹, R², R³, V, Q, Y, W, X, U, A y m tienen los mismos significados que en la reivindicación 1,

5 E es un grupo nucleófilo que en presencia de una base
está sustituido o es una función hidroxil eventualmente
activada;

o

10

[D] Los compuestos de fórmula (VIII)



15

en la que

20

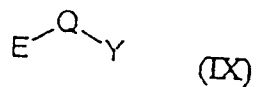
Va es O o S y

en la que

5 R^1 , R^2 , R^3 , Y, Q, W, U, A, X y m tienen los mismos
significados que en la reivindicación 1,

reaccionan con compuestos de fórmula (IX)

10



en la que

15

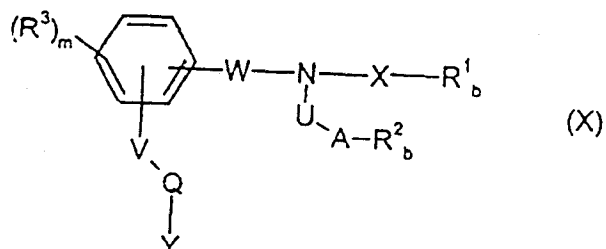
Q, Y tienen los mismos significados que en la
reivindicación 1,

E es un grupo nucleófilo que en presencia de una
20 base está sustituido o es una función hidroxil eventualmente
activada;

o

747
751

5 [E] Los compuestos de fórmula (X)



en la que

15 R³, V, Q, Y, W, X, U, A y m tienen los mismos significados que en la reivindicación 1,

R^{1b} y R^{2b} son cada uno independientemente CN o COOAlq, donde Alq es un resto alquilo de cadena lineal o ramificada
20 con hasta 6 átomos de carbono, con soluciones acuosas de ácidos fuertes o bases fuertes se transforman en los correspondientes ácidos carboxílicos libres.

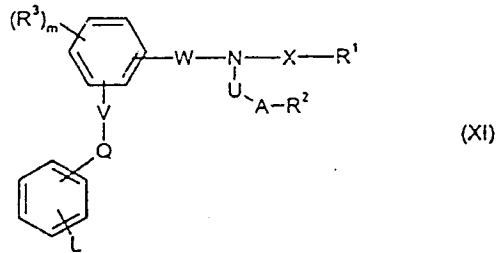
o

748
752

5

[F] Los compuestos de fórmula (XI)

10



en la que

15 R1, R2, R3, V, Q, X, W, U, A y m tienen los mismos
significados que en la reivindicación 1,

L es Br, I o el grupo $\text{CF}_3\text{SO}_2\text{-O}$,

20 reaccionan con los compuestos de fórmula (XII)

M-Z (XII)

en la que

5 M es un resto arilo o heteroarilo, un resto alquilo, alquenilo o alquinilo o un resto cicloalquilo o un resto arilalquilo, un arilalquenilo o un resto arilalquinilo,

10 Z es el grupo $-B(OH)_2$, $-CH=CH$, $-CH=CH$, o $-Sn(nBu)_3$

en presencia de un compuesto de paladio, eventualmente lo adicionalmente en presencia de un agente reductor y otros adyuvantes y en presencia de una base;

15

o

[G] Los compuestos de fórmula (XIII)

20



(XIII)

5

en la que

Ar es un resto arilo o heteroarilo,

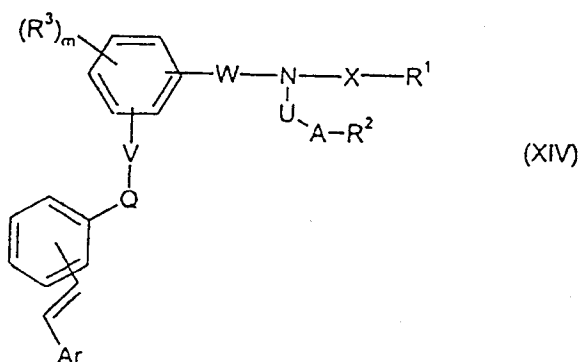
E es un grupo nucleóforo, que en presencia de una

10 base

está sustituido

reaccionan según el procedimiento D con compuestos de
fórmula (VIII) y los compuestos así obtenidos de fórmula

15 (XIV)



20

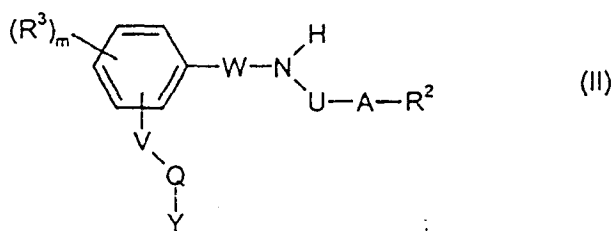
se hidrogenan con hidrógeno en presencia de un
catalizador.

755
755

5

8. Compuestos de fórmula (II)

10



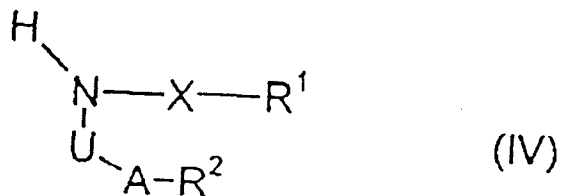
15

en la que

V, Q, Y, R³, m, W, N, U, A y R² tienen el significado citado en la reivindicación 1.

20

9. Compuestos de fórmula (IV)



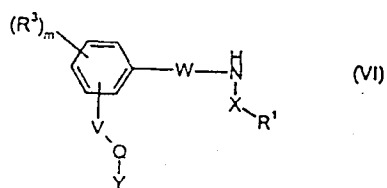
5

en la que

U, A, X, R¹ y R² tienen el significado citado en la
10 reivindicación 1.

10. Compuestos de fórmula (VI)

15



en la que

20

V, Q, Y, R³, m, W, X y R¹ tienen el significado de la
reivindicación 1.

5 11. Compuestos los cuales también son capaces de estimular la
guanilato ciclasa soluble independientemente de la existencia
de un grupo hemo en la enzima, para la preparación de
medicamentos para el tratamiento de enfermedades cardíacas y
del sistema circulatorio como angina de pecho, isquemias e
10 insuficiencia cardiaca.

12. Compuestos los cuales son también capaces de estimular la
guanilato ciclasa soluble independientemente de la existencia
de un grupo hemo en la enzima, para la preparación de
15 medicamentos para el tratamiento de arteriosclerosis,
hipertensión, enfermedades tromboembólicas, enfermedades
venenosas y enfermedades fibróticas, particularmente la
fibrosis hepática.

20 13. Medicamento que contiene al menos un compuesto de
fórmula general (I) según una de las reivindicaciones
anteriores.

754-
758

5 14. Compuestos de fórmula (I) según una de las anteriores reivindicaciones utilizados en la preparación de un medicamento para el tratamiento de enfermedades cardíacas y del sistema circulatorio.

10 15. Compuestos de fórmula (I) según una de las anteriores reivindicaciones utilizados en la preparación de medicamentos para el tratamiento de la angina de pecho, isquemias e insuficiencia cardíaca.

15 16. Compuestos de fórmula (I) según una de las anteriores reivindicaciones utilizados en la preparación de medicamentos para el tratamiento de hipertensión, enfermedades tromboembólicas, arteriosclerosis y enfermedades venosas.

20

17. Uso de compuestos de fórmula (I) según una de las anteriores reivindicaciones utilizados en la preparación de medicamentos para el tratamiento de enfermedades fibróticas.

755
759

5

18. Compuestos según la reivindicación 17, caracterizado porque la enfermedad fibrótica es la fibrosis hepática.

COLO 00698-801-125-7

10

JJC-ID-912

15



760
765

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacon : 00068921 00000001

Folios: 87

Fecha (AMD): 2001-01-09 17:03:17

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NOT : 00010000-2

RECIBO OFICIAL DE CASA : 540
FECHA : ENERO 5 DE 2001

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUCURUL	CUENTA	Nº. PAGO	VL. PAGO
CAVELIER ASSOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	000000	050 00110 4	1770040	1,152,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005 01 03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12	CARGAS Y LEYAS COMERCIALES	60,000.00
	TOTAL :	60,000.00

CON: CIENTO Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CASA APLICADO AL EXPEDIENTE Nº. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

763
761

NIT : 000176007 2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 72,983
FECHA : NOVIEMBRE 27 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00063921 00000001 Folios: 87
Fecha (AMD): 2001-01-09 17:03:17
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

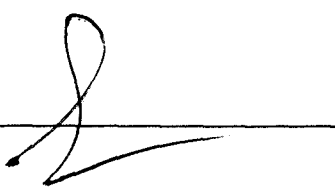
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2025223	40,929,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	DETALLADO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-07	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I 45 CAUCIONES	140,000.00
TOTAL :			\$ 140,000.00

SON: CIENTO CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N°. _____

Colo al 2-3-2001



762
764

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00068921 00000001

Folios: 87

Fecha (AMD): 2001-01-09 17:05:17

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 000171000 2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 70,100
FECHA : DICIEMBRE 01 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUCURRAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vº. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	1700646	14,000,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005 01 04	PRESENTACION DE OBSERVACIONES	
		12- MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	170,000.00
		TOTAL :	\$ 170,000.00

CON: CIENTO OCHENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

763

NIT : 000170000-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 70,100
FECHA : DICIEMBRE 21 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUCURUL	CUENTA	Nº. PAGO	Vº. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050 00110-6	170046	14,000,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	CONCEPTO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005 01 04 PRESENTACION DE OBSERVACIONES	12	MARCAS Y LEAS COMERCIALES
			170,000.00
		TOTAL :	\$ 170,000.00

SON: OCHENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA RELIGADO AL EXPEDIENTE N°.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia



764
766

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 000174000-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00068921 00000001

Folios: 87

Fecha (AMD): 2001-01-09 17:05:17

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 78,450
FECHA : DICIEMBRE 26 DE 2000

**** CONSIGNACION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vº. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	350 00110-4	3117383	20,370,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT. DETECTADO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01 02 PROSECUCION Y RENOVACIONES	30 PROSECUCION Y RENOVACIONES
	TOTAL :	# 305,000.00

SON: TRESCIENTOS NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N°.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 688

Radicación no 00-68921

Concepto Técnico no 985

Clasificación Internacional de Patentes A61K 31/35//31/192

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- SI ☒ NO ☐ Contiene un resumen de la invención (Art.26-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción de la invención (Art.26-b).
- SI ☒ NO ☐ NO ES APLICABLE ☐ Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-i).
- SI ☐ NO ☒ La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-J).
- SI ☒ NO ☐ La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI ☒ NO ☐ **CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

- * Anexa nuevo capítulo reivindicatorio folios: 690 a 755.
- * Nuevo extracto para publicación folios: 757 a 761
- * Anexa Nueva tarjeta de archivo temático = folio 756.

EXAMINADOR TÉCNICO

202039

Bogotá D. C., Abril 23/02

2020
Bogotá, D.C.

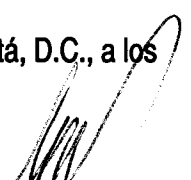
Doctor(a)
EMILIO FERRERO
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación No.	00-68921
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	1192
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la comunidad andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase

Dado en Bogotá, D.C., a los **28 JUL. 2002**


ALIX CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, D.C., El extracto de esta solicitud fue publicado en el número **522** de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha **28-11-02**. El término hábil señalado por la ley expiró el **25-02-03** y SI ☐ NO ☒ se presentaron oposiciones por parte de terceros.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

SISTEMA DE TRAMITES-CONSULTA DE TRÁMITES*

768

Martes 20 de Mayo de 2008



Datos del Trámite (PENDIENTE)

Radicación: [REDACTED] *Ctrl: * Cons Rad: 3 * Secu Even: 0 *
 Tipo Trámite: 2 PATENTES DE INVENCION *
 Tipo Evento: 001. REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO *
 Tipo Actuación: [REDACTED] *
 Dependencia Origen: [REDACTED] *
 Dependencia Destino: 2020. DIVISION DE NUEVAS CREACIONES *
 Solicitante/Destinatario: EMILIO FERRERO * Tipo: Contendida
 Identificación: NN . NO IDENTIFICADO Número: 780406.0
 Dirección:
 Tipo de Radicación: EN . ENTRADA * Folios: 2
 Fecha de Radicación: Día: 27 Mes: Mayo Año: 2008 17:17:47 Entrega: PRESENTACION PERSONAL
 Guía: fecha:
 Observaciones:

Otros Datos

[Documentos] [Recibos]

[Nueva Consulta](#)
[\[Cerrar Sesión\]](#)
[Regresar](#)

Registro : 4 / 5

Información adicional en la Oficina de Sistemas

Año	Número	Ctrl	Cons Rad	Sec Eve	Trámite	Evento	Actuación	Tipo	Fecha	Solicitante	Asigr Est Corresp
0	68921		0	0	PATENTES DE INVENCION	REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO	SOLICITUD	PI	2000-09-12 00:00:00	EMILIO FERRERO	
0	68921		1	0	PATENTES DE INVENCION	REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO	PRESENTACION	EN	2000-09-12 17:21:03	EMILIO FERRERO	
0	68921		2	0	PATENTES DE INVENCION	REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO	REPUESTA A REQUERIMIENTO DE INFORMACION	EN	2001-01-09 17:05:17	EMILIO FERRERO	
0	68921		3	0	PATENTES DE INVENCION	REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO	PETICION DE EXAMEN	EN	2003-05-27 17:17:47	EMILIO FERRERO	
0	68921		4	0	PATENTES DE INVENCION	REGISTRO/DEPOSITO/CONCESION/DEPOSITO	IMPULSO PROCESAL	EN	2005-08-01 16:40:07	EMILIO FERRERO	

19



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

11 Publication number:

**0 341 551
A1**

DL
769

12

EUROPEAN PATENT APPLICATION

21 Application number: 89107912.1

22 Date of filing: 02.05.89

51 Int. Cl. 4: **C07C 63/66 , C07C 65/28 ,
C07C 69/94 , C07F 9/28 ,
C07C 51/00 , C07C 67/00 ,
C07C 149/273 , A61K 31/19 ,
A61K 31/235**

30 Priority: 13.05.88 GB 8811423

43 Date of publication of application:
15.11.89 Bulletin 89/46

64 Designated Contracting States:
AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI NL SE

71 Applicant: **BAYER AG**

D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

72 Inventor: **Rosentreter, Ulrich, Dr.**
Kondorweg 23
D-5600 Wuppertal 1(DE)
Inventor: **Kluender, Harold, Dr.**
65 Ocean Ave
West Haven, CT 06516(US)
Inventor: **Abram, Trevor S., Dr.**
214 Marlow Bottom
Marlow Bucks(US)
Inventor: **Norman, Peter, Dr.**
4 St. Andrews Way Cippenham
Slough Berks, SL1 5NX(GB)
Inventor: **Tudhope, Stephen R., Dr.**
47 Kentons Lane
Windsor Berks, SL4 4JH(GB)

54 **Alkenoic acid derivatives.**

57 New alkenoic acid derivatives can be prepared by reaction of corresponding aldehydic esters with phosphorous compounds in inert solvents and in the presence of bases followed by hydrolysis of the intermediate esters. The new alkenoic acid derivatives can be used as active compounds in medicaments.

EP 0 341 551 A1

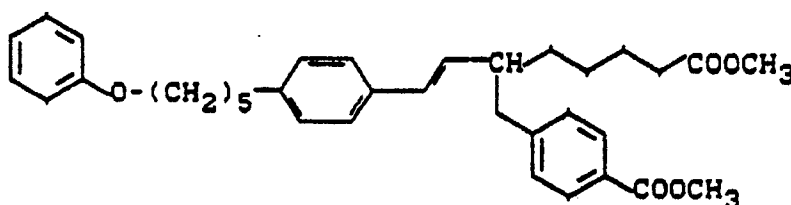
20 mg of the compound obtained in Example 112 (cis-isomer) are saponified following the same procedure as in Example 68. 16.5 mg of the product are thus obtained.

Yield: 87% of theory

R_f-value: 0.67 (mobile solvent: organic phase of a vigorously shaken mixture of 44 ml of ethylacetate, 8 ml of glacial acetic acid, 20 ml of isooctane and 40 ml of water).

Example 115

6-(4-Methoxycarbonylbenzyl)-8-[4-(5-phenoxy-pentyl)phenyl]-7(E)-octenoic acid methyl ester



146.4 mg (0.25 mmol) of 4-(5-phenoxy-pent-1-yl)benzyltriphenylphosphonium bromide are reacted with 77.2 mg (0.25 mmol) of 6-formyl-7-(4-methoxycarbonylphenyl)heptanoic acid methyl ester and chromatographed following the same procedure as in Example 87 and 88. 27 mg of the trans-isomer are thus obtained as the product in addition to a very small amount of the cis-isomer, which was discarded.

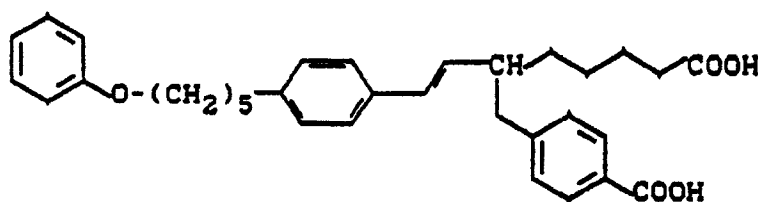
Yield: 21% of theory

R_f-value: 0.13 (n-hexane:ethyl acetate 88:12)

NMR (CDCl₃, 300 MHz): 1.2 - 1.7 [10] m, 1.8 [2] quintet, J = 8 Hz, 2.25 [2] tr, J = 8 Hz, 2.35 - 2.5 [1] m, 2.6 [2] tr, J = 8 Hz, 2.65 - 2.8 [2] m, 3.65 [3] s, 3.9 [3] s, 3.95 [2] tr, J = 8 Hz, 5.9 [1] dd, J = 14 Hz, J = 8 Hz, 6.2 [1] d, J = 14 Hz, 6.85 - 6.95 [3] m, 7.1 [2] d, J = 8 Hz, 7.2 - 7.35 [6] m, 7.95 [2] d, J = 8 Hz.

Example 116

6-(4-Carboxybenzyl)-8-[4-(5-phenoxy-pentyl)phenyl]-7(E)-octenoic acid



15.3 mg of the compound obtained in Example 115 are saponified following the same procedure as in Example 68. 15.4 mg of the product are thus obtained.

Yield: 100% of theory

R_f-value: 0.67 (mobile solvent: organic phase of a vigorously shaken mixture of 44 ml of ethyl acetate, 8 ml of glacial acetic acid, 20 ml of isooctane and 40 ml of water).

Example 117

6-(4-Carboxybenzyl)-5-thia-7(E), 9(E), 11(z), 14(z)-eicosatetraenoic acid 5,5-dioxide

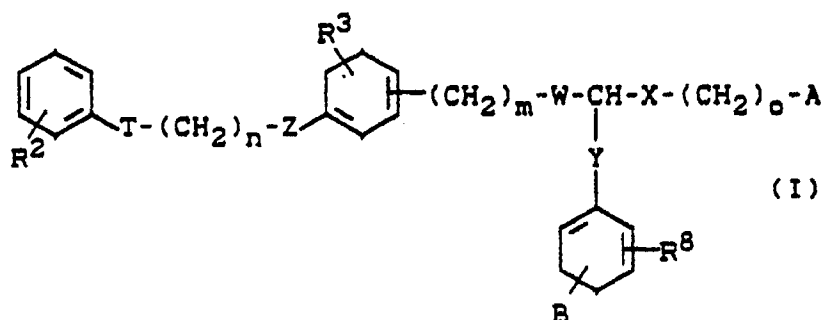
-NaCl 137, MgCl₂ 2.1, KCl 2.7, NaH₂DO₄ 0.5, CaCl₂ 2.4, NaHCO₃ 11.9, D-glucose 9.2.

Results

Contractions were normalised to the histamine-induced maximum for each preparation. The responses to analogue, LTD₄ and LTD₄ plus analogue were then expressed as a percentage of the maximum LTD₄ response in the appropriate control preparation. EC₅₀ (that concentration required to induce a 50% maximal LTD₄ response) values for 'test' and control tissues were calculated using a least squares linear regression program. These values were used to calculate a pK_B to qualify the degree of antagonism where appropriate.

Claims

1. Alkenoic acid derivatives of the general formula



in which

X and Y are identical or different and represent sulfur, sulfoxide, sulfone, an alkylene chain, -SCH₂-, or oxygen or a direct bond,

W represents -CH=CH- or -CH₂-CH₂-

o represents a number 1 to 5

A and B are identical or different and represent carboxyl, carboxymethylene, tetrazolyl or tetrazolyl-methylene, or -CO₂R⁹ or -CH₂CO₂R⁹ or -CONR¹⁰R¹¹ or nitrile

n represents a number 1 to 10,

m represents a number 0 to 7,

T and Z are identical or different and represent oxygen or a direct bond and

R², R³, R⁸ are identical or different and represent hydrogen, alkyl, alkoxy, halogen, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, cyano or nitro

R⁹ is lower alkyl and R¹⁰ and R¹¹ are hydrogen, lower alkyl, alkylsulfonyl or arylsulfonyl or together are an alkylene chain to form a ring and their salts have been prepared.

2. Alkenoic acid derivatives according to claim 1, wherein

X and Y are identical or different and represent sulfur, sulfoxide, sulfone, a methylene group, -SCH₂-, oxygen, an ethylene group or a direct bond,

W represents -CH=CH- or -CH₂CH₂-

o represents a number 1 to 4,

n represents a number 1 to 7,

m represents a number 0 to 5,

T and Z are identical or different represent oxygen or a direct bond and

R², R³, R⁸ are identical or different and represent hydrogen, lower alkyl, lower alkoxy, fluorine, chlorine or trifluoromethyl and their salts.

772
772

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO
Apoderado

ASUNTO	Radicación	00-068921
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	Nº 4 6 2 3
	Folios	07

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

Convención de Paris

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios: 02 a 233 y 293 como se radicó inicialmente

Reivindicaciones: Folios 234 a 292 como se radicó inicialmente
Folios 628 a 684 prioridad
Folios 694 a 759 modificadas (estudiadas)

Prioridad: Folios: 1, 304 a 467
13/09/1999, DE, 19943635.5

2. Análisis de la Prioridad

- La fecha de prioridad del 13 de Septiembre de 1999 y su correspondiente documento, son aceptados para el estudio de patentabilidad.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Nuevos derivados del ácido aminodicarboxílico con propiedades farmacéuticas

El objeto de la presente solicitud de patente de invención: nuevos compuestos químicos que estimulan la guanilato ciclasa soluble, útiles en el tratamiento de enfermedades cardíacas y del sistema circulatorio.

El problema planteado en esta solicitud es obtener compuestos derivados aminodicarboxílico que estimulan la guanilato ciclasa soluble, útiles en el tratamiento de enfermedades cardíacas y del sistema circulatorio.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados aminodicarboxílico

- **Clasificación Internacional de Patentes (IPC):** A61K 7/34, A61K 7/38

4. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1 se refiere al sustituyente R^4 , no es claro cuando se refiere a "es independiente de otro resto R^4 eventualmente existente". Aclarar cuando se refiere a "ó 0, 1, 2" se refiere a las sustituciones de R^4 o del arilo.

El sustituyente V de la reivindicación puede ser =, el cual puede ser interpretado como: un doble enlace o el signo igual. No es claro.

El sustituyente R^2 de la reivindicación 1 no se encuentra definido.

Los sustituyentes R^4 , R^5 , Q, Y, W y A se encuentran de forma amplia y no se encuentran todas las sustituciones en los ejemplos de la descripción, presentando la mejor forma de realizar la invención.

La reivindicaciones 9 y 10 se encuentran de forma independiente de la reivindicación 1

Las reivindicaciones 11 y 12 se encuentran caracterizadas por la actividad y su uso.

La reivindicación 13 se encuentra enunciada por el término "al menos", el cual no se encuentra de forma precisa y sustentada mediante ejemplos en la descripción.

Las reivindicaciones 14 a 16 se encuentran caracterizadas por su uso

No se encuentran sustentadas todas las sustituciones planteadas en los compuestos de fórmula I, mediante ejemplos que describan la mejor forma de realizar la invención.

La reivindicación 18 se encuentra caracterizada por el uso del compuesto en una enfermedad.

Se le sugiere al solicitante revisar el título frente a las estructuras químicas de los compuestos que ha presentado y sus respectivas sustituciones, puesto que al realizar los reemplazos no se observa en todos los compuestos que sean derivados aminodicarboxílico.

6. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

La reivindicación 17, se refiere al uso del compuesto, la cual no es patentable de acuerdo a los artículos mencionados de la normatividad vigente.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: 13 de Septiembre de 1999

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 13/09/1999 se encontraron los siguientes documentos del estado de la técnica relacionados, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

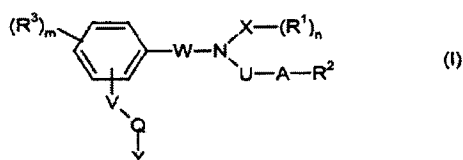
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	EP 0341551	Alkencic acid derivatives	02/05/1989

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

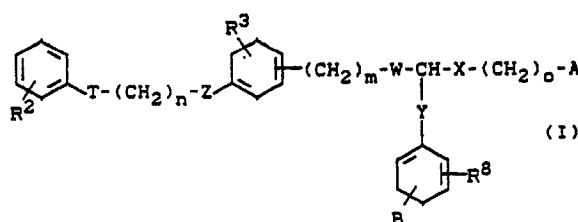
1) Respecto a la solicitud en estudio:

La reivindicación 1 se refiere a compuestos de fórmula general (I) en la que:

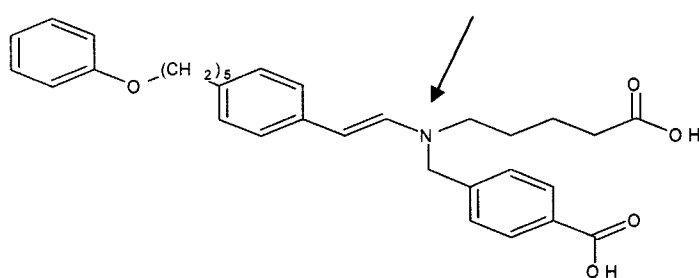
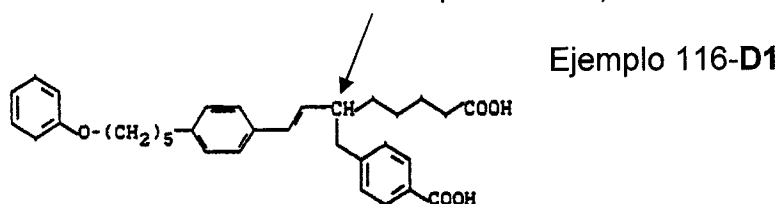


2) Respecto al estado de la Técnica:

D1 divulga previamente compuestos de fórmula (I)



Al realizar los reemplazos sugeridos en D1 (Ver reivindicación 1, página 78) y comparados con los compuestos de la solicitud presentada (W es alquendiilo hasta 6 carbonos, V falta, Q es alquilo de cadena lineal, pudiendo tener cada uno o varios grupos seleccionados entre O, Y es arilo, U es alquilo, A es arilo, X es un alquilenio, R¹ es COOR³⁰, donde R³⁰ es hidrógeno (Ver reivindicación 1-Solicitud presentada R² tomado del Folio 718-Solicitud presentada)



1) Estado de la Técnica más cercano: D1

La solicitud se diferencia de la anterioridad encontrada en el átomo de nitrógeno. D1 posee un átomo de carbono.

775

775

No se evidencia el efecto técnico superior e inesperado y su aporte a la tecnología anterior de los compuestos de la solicitud presentada en cuanto a sus resultados entre otros de acción vasodilatadora (Ver Folio 93-Solicitud), donde se registran valores significativamente diferentes en su actividad en nM (CI₅₀), como el ejemplo 37 con un valor de 830nM y el ejemplo 102 con un valor de 0.2nM.

Es evidente para el experto en la materia reemplazar el átomo de carbono por uno de nitrógeno teniendo en cuenta que el grupo farmacofórico ya se encontraba divulgado en el estado de la técnica, de acuerdo con los conceptos de bioisosteria, de forma tal que los compuestos de la solicitud presentada se derivan de forma obvia del estado de la técnica, careciendo por lo tanto de altura inventiva.

El problema técnico objetivo de la solicitud presentada el cual es **“obtener compuestos derivados aminodicarboxílico que estimulan la guanilato ciclasa soluble, útiles en el tratamiento de enfermedades cardíacas y del sistema circulatorio”**, queda resuelto comparativamente con lo previamente divulgado en el estado de la técnica, pues sería solucionado fácilmente por el experto en la materia con base en los compuestos divulgados en D1 reemplazando el átomo carbono por un análogo tal como el nitrógeno, de forma que este lo lograría fácil y obviamente sin necesidad de emplear habilidad Inventiva.

Por lo tanto las reivindicación 1 y sus dependientes carecen de nivel inventivo

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 0341551	1-16	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de 60 días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
 Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 23 ABR. 2009

CONCEPTO TÉCNICO No. 03536	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202070
-----------------------------------	--