

333¹¹⁵
328

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS
A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94-76 - Of. 305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tels: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 00-097143-00011-0000

Rec: 2007-01-19 15:33:32 Dep. 2020 NUEVACREACIONES

TR. 2 PATENTES

Evo: 1 REQUERIMIENTO

Act 444 RESOLUTIVO FOLIO: 10

2407/P

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Re: Expediente No. 00.097.143
Solicitud de patente a nombre de **Ortho McNeil**
Pharmaceutical, Inc

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 94-76, Of. 305, obrando como apoderada de la sociedad **Ortho McNeil Pharmaceutical, Inc** domiciliada en Raritan, New Jersey, Estados Unidos de América, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 12657 notificado por fijación en lista el 2 de noviembre de 2006, relacionado con el concepto técnico de fondo No. 697, me permito manifestar:

1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial de nuevo el capítulo reivindicatorio, que reemplazan el texto originalmente presentado, en el que se han realizado las siguientes modificaciones:

1.1. En la reivindicación 1 se definieron los sustituyentes "alquilo", "acilo", "alcoxi", "arilo", "heteroarilo" y "halógeno" o "halo" de la siguiente forma:

◦Alquilo como "*alquilo de 1 a 8 átomos de carbono*" de acuerdo a como se establece en la página 5 líneas 7 a 13 de la solicitud.

◦ Acilo como “acilo de 2 a 6 átomos de carbono” con base en lo enunciado de la página 5 líneas 20 a 23.

◦ Alcoxi como “alcoxi de 1 a 8 átomos de carbono” según lo estipulado en la página 5, líneas 13 a 15.

◦ Arilo, para delimitar este grupo sustituyente, se tubo en cuenta las aclaraciones dadas por el examinador en su concepto técnico 1697: “Se debe tomar la definición específica que se encuentra enteramente sustentada en la descripción, folio 9, renglones diez a trece, definición inequívoca de arilo y renglones tres a nueve, definición de los sustituyentes del arilo.”, de acuerdo a lo anterior, la definición para arilo es:

“Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.

◦ Así mismo Heteroaril se definió mediante la expresión

“Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-

(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina.”. Teniendo su sustento en la descripción en las páginas 6 y 7 último y primer párrafos respectivamente.

◦Halógeno o halo se precisó mediante la expresión: “El prefijo Halo o halógeno es flúor, cloro, bromo y yodo”, dada en la página 5 líneas 25 a 28.

- 1.2. En las reivindicaciones 4 y 8 se incluyó la expresión “...alquilo de 1 a 8 átomos de carbono” para definir el radical alquilo.
- 1.3. En la reivindicación 6 se definió el sustituyente heteroarilo incluyendo la expresión “Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina.”.
- 1.4. En la reivindicación 7 se definieron los sustituyentes alquilo, arilo y heteroarilo, incluyendo las expresiones

“Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente

de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.

“...alquilo de 1 a 8 átomos de carbono”

Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina”.

- 1.5 Se eliminaron las reivindicaciones 20 a 25 y se reenumeraron las restantes.
- 1.6 En la reivindicación 20 se incluyeron las expresiones “alquilo de 1 a 8 átomos de carbono” para definir el radical alquilo y “alcoxi de 1 a 8 átomos de carbono” para definir el radical alcoxi.
- 1.7 En la reivindicación 21 se incluyeron las expresiones ““Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3

átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.”.

“Halo o halógeno es flúor, cloro, bromo y yodo”.

○ El examinador podrá notar que las anteriores modificaciones no amplían el alcance de la presente invención, únicamente se realizaron con el fin de brindar un texto mejor redactado y dar cabal cumplimiento a las objeciones de claridad de la presente solicitud, señaladas en su concepto técnico 1697.

Para este efecto, me permito acompañar el recibo No. 06-94,841 de 12 diciembre de 2006, con lo cual queda cubierta la tasa correspondiente a la modificación de una solicitud de patente en cuanto a sus reivindicaciones.

2. Claridad de la solicitud

○ Analizando el nuevo capítulo reivindicatorio modificado, es posible afirmar que las reivindicaciones 1, 4, 6, 7, 20 y 21 contienen ahora en forma clara y definida los sustituyentes “alquilo”, “acilo”, “alcoxi”, “arilo”, “heteroarilo” y “halógeno” o “halo”.

Sobre el particular, queremos dejar en claro que el término alquilarilo se define ahora como “aril-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono” según lo descrito en la página 6 líneas 14 a 21.

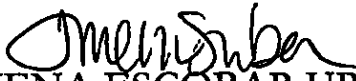
3. Excepciones de patentabilidad

Las reivindicaciones 20 a 25 fueron eliminadas del capítulo reivindicatorio puesto que reclaman métodos terapéuticos y éstos constituyen materia no patentable.

338
333

En vista de todo lo anterior, es decir de las modificaciones realizadas a esta solicitud, ruego a ese despacho conceder el privilegio de patente de invención.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C.39.779.452 de Usaquén
T.P. 68228
Cód. 5376

3339
334

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 94,841
FECHA : DICIEMBRE 12 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	53371124	12/12/2006	7,284,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	75,000.00
		TOTAL :	75,000.00

SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

340
335

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 07 - 886
FECHA : ENERO 4 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	50962790	04/01/2007	7,113,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	4,000.00
		TOTAL :	4,000.00

CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

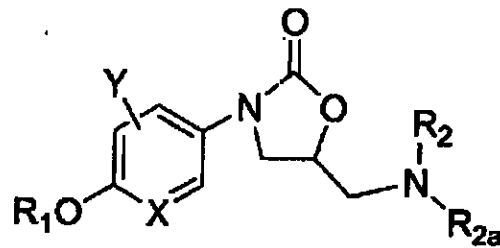
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN OPORTO

REIVINDICACIONES

Habiendo así especialmente descrito y determinado la naturaleza de la presente invención y la forma como la misma ha de ser llevada a la práctica, se declara reivindicar como de propiedad y derecho exclusivo:

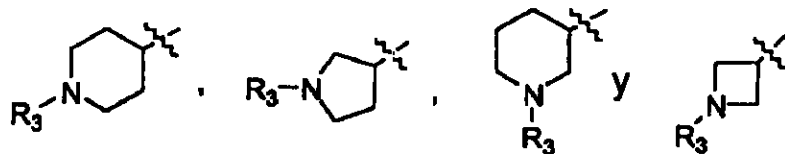
1. Un compuesto de Formula I:



Formula I

en donde

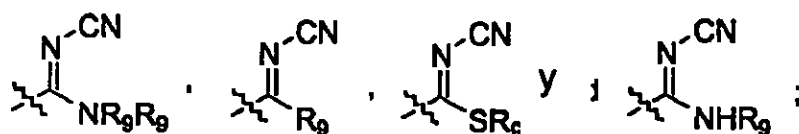
R1 se selecciona entre



en donde

- R₃ se selecciona entre H, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -COR₄, -(CH₂)_theteroarilo, -CHR₅R₆, -(CH₂)_t arilo, -SO₂NR₅R₆, y -SO₂R₉;
- R₄ se selecciona entre H, -OR₅, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, aril-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -(CH₂)_t arilo, -(CH₂)_t heteroarilo, -(CH₂)_t OR₅, -(CH₂)_tNR₇R₈, -CHR₅R₆ y -NR₅R₆, opcionalmente formando un derivado amino cíclico;
- R₅ y R₆ se seleccionan independientemente entre H, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, aril-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, haloarilo, -(CH₂)_t arilo, -(CH₂)_t heteroarilo, y acilo de 2 a 6 átomos de carbono;
- R₇ y R₈ se seleccionan independientemente entre H, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -COR₉, -SO₂R₉ y -CO₂R₉; y
- R₉ se selecciona entre H, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, arilo y aril-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono;

R₂ se selecciona entre C(O)R₉, C(O)OR₉



341

R_{2a} es H o acilo de 2 a 6 átomos de carbono, con la condición que cuando R_3 se selecciona entre alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, $-(CH_2)_t$ arilo, $-(CH_2)_t$ heteroarilo y $-CHR_5R_6$, R_{2a} es H;

337

X es N o CH;

Y se selecciona entre H, halógeno, alcoxi de 1 a 8 átomos de carbono, y alquilo de 1 a 8 átomos de carbono;

t es un numero entero entre 0 a 4;

o un isómero óptico, enantiómero, diastereómero, racemato o mezcla racémica de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, en donde

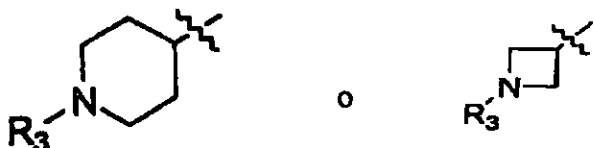
Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente

Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.

El prefijo Halo o halógeno es flúor, cloro, bromo y yodo.

342
338

2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde X es CH.
3. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R_2 es $-C(O)R_9$, en donde R_9 es como se reivindica en la reivindicación 1.
4. El compuesto de la reivindicación 3, en donde R_9 es H o alquilo de 1 a 8 átomos de carbono.
5. El compuesto de la reivindicación 1, donde R_1 es



En donde R_3 es como se reivindica en la reivindicación 1.

6. El compuesto de la reivindicación 5, en donde R_{2a} es H, y R_3 se selecciona entre $-COR_4$, $-SO_2R_9$ y $-(CH_2)_t$ heteroarilo, en donde R_4 , R_9 y t son como se reivindican en la reivindicación 1,

donde

Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, - COR_5 , $-COOR_5$, $-CONHR_5$, $-CONR_5R_6$, $-SOR_5$, $-SO_2R_5$, $-SO_2NHR_5$, $-SO_2NR_5R_6$, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina en donde R_5 y R_6 son como se definió anteriormente.

7. El compuesto de la reivindicación 5, en donde R_4 se selecciona entre $-OR_5$, $-(CH_2)_tOR_5$, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, $-(CH_2)_t$ arilo, y $-(CH_2)_t$ heteroarilo, en donde R_5 y t son como se reivindica en la reivindicación 1,

en donde

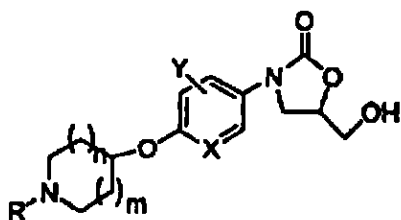
Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos

de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.

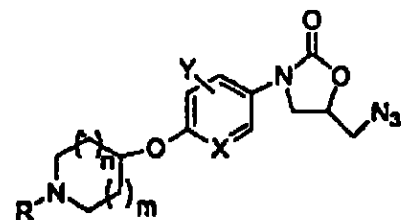
Heteroarilo es un radical aromático cíclico que tiene desde 5 a 10 átomos de anillo, de los cuales un átomo de anillo se selecciona entre S, O y N; 0-2 átomos de anillo son heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre S, O y N; los átomos restantes son carbono. El grupo heteroarilo puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-CONH, o carboxamida, o con un mono-oxo, para dar 4-oxo-1H-quinolina en donde R₅ y R₆ son como se definió anteriormente.

8. El compuesto de la reivindicación 7 en donde R₅ es alquilo de 1 a 8 átomos de carbono y R₆ es H o alquilo de 1 a 8 átomos de carbono.
9. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(benciloxiacetil) piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
10. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(α-hidroxiacetil) piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
11. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(metanosulfonil) piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
12. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(metoxycarbonil)piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.

13. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(2-pirimidinil)piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
14. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(3-cianobenzoi)piperidinil-4-oxi} fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
15. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(5-ciano-2-piridil)piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
16. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(2-tienilcarbonil)piperidinil-4-oxi}fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
17. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-fluoro-4-{N-(α -hidroxiacetil)piperidinil-3-oxi} fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil] acetamida.
18. Un compuesto de la reivindicación 1 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es (S)-N-[[3-[3-Fluoro-4-{N-(benciloxiacetil)pirrolidinil-3-oxi} fenil]-2-oxo-5-oxazolidinil] metil]acetamida.
19. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la reivindicación 1 y un portador farmacéuticamente aceptable.
20. Un intermediario de la Formula e o f



e



f

en donde

R es Boc, -CH(Ph)₂ o -COCH₂OCH₂Ph;

X es N o CH;

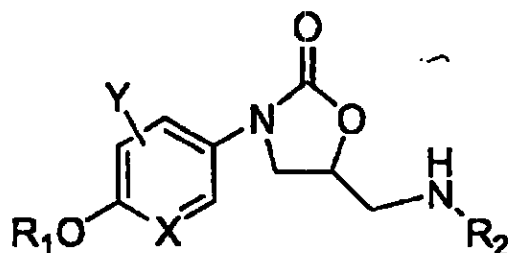
Y se selecciona entre H, halógeno, alcoxi de 1 a 8 átomos de carbono, y alquil de 1 a 8 átomos de carbono;

n es 0, 1 o 2; y

m es 0 o 1.

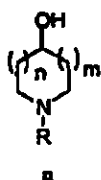
341 345

21. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula la



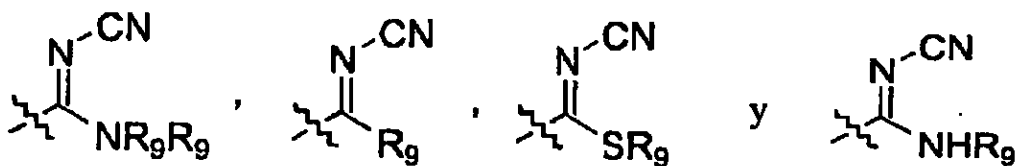
Fórmula Ia

En donde R_1 es una porción de fórmula:



en donde

R se selecciona entre Boc, $\text{CH}(\text{Ph})_2$ ó $-\text{COCH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$, n es 0, 1 ó 2, m es 0 ó 1, R_2 , se selecciona entre $\text{C}(\text{O})\text{R}_9$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}_9$.



En donde R_9 se selecciona entre H, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, arilo y aril-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono; X es N o CH;

Y se selecciona entre H, halógeno, alcoxi de 1 a 8 átomos de carbono, y alquilo de 1 a 8 átomos de carbono;

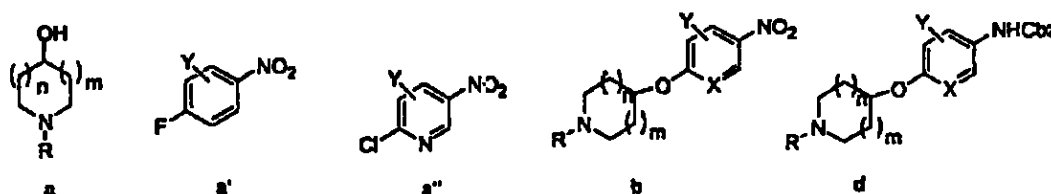
Arilo o Ar es un radical aromático carbocíclico como fenilo, naftilo, difenilo, fluorofenilo, difluorofenilo, bencilo, benzoiloxifenilo, carboetoxifenilo, acetilfenilo, etoxifenilo, fenoxifenilo, hidroxifenilo, carboxifenilo, trifluorometilfenilo, metoxietilfenilo, acetamidofenilo, tolilo, xililo, dimetilcarbamilfenilo, Ph o PH denota fenilo. El radical aromático carbocíclico puede ser sustituido por reemplazo independiente de 1 a 3 átomos de hidrógeno en el mismo con halógeno, -OH, -CN, mercapto, nitro, amino, amino sustituido, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -O-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -S-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, -N-(alquilo de 1 a 8 átomos de carbono)₂, (mono-, di-, tri- y per-)halo-alquilo de 1 a 8 átomos de carbono, formilo, -COR₅, -COOR₅, -CONHR₅, -CONR₅R₆, -SOR₅, -SO₂R₅, -SO₂NHR₅, -SO₂NR₅R₆, alquilo de 1 a 8 átomos de carbono-COO, alquilo de 1 a 8 átomos de

carbono-CONH, o carboxamida o un anillo arilo secundario, en donde R_5 y R_6 son como se definió anteriormente

El prefijo Halo o halógeno es flúor, cloro, bromo y yodo

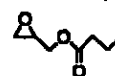
Cuyo proceso comprende:

(a) hacer reaccionar un compuesto de fórmula a con un compuesto de fórmula a' o a'' para formar un compuesto de fórmula b;

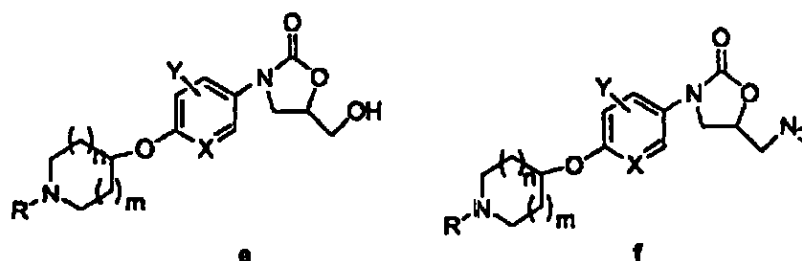


(b) Convertir el compuesto de Fórmula b en un compuesto de Fórmula d;

(c) hacer reaccionar el compuesto de Fórmula d con

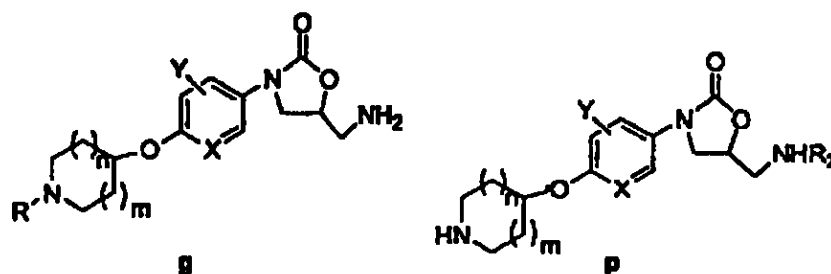


para formar un compuesto de Formula e;



(d) Convertir el compuesto de Formula e en un compuesto de Formula f;

(e) Convertir el compuesto de Formula f en un compuesto de Formula g;



(f) Convertir el compuesto de Formula g en un compuesto de Formula p; y

(g) Convertir el compuesto de Formula p en un compuesto de Formula la.

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

Radicación No.00-97143

Clasificación Internacional de Patentes: A61K31/421, 31/16

Concepto Técnico No.

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados:

- ◇Capítulo descriptivo, folios 04 a 97;
- ◇Capítulo reivindicatorio nuevamente modificado, folios 340 a 346;
- ◇1° examen de forma, folios 109;
- ◇Solicitudes de las cuales se reivindica prioridad, junto con su traducción, folios 121 a 302;
- ◇2° examen de forma, folio 310;
- ◇Solicitud del examen de patentabilidad 312 y 313;
- ◇Examen de patentabilidad, folios 315 y 316;
- ◇Respuesta técnica, folios 318 a 329;
- ◇Nuevo examen de patentabilidad, folios 330 a 332;
- ◇Respuesta técnica al examen de patentabilidad, folios 333 a 346.

Objeto de la invención:

El título de la invención es "ANTIBACTERIANOS DE PIPERIDINILOXI Y PIRROLIDINILOXI OXAZOLIDIN^{PA}Á, COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE LOS COMPRENDE Y PROCESO PARA SU PREPARACIÓN"

El objeto de la presente solicitud se refiere a derivados 5-(aminometil)-3-(6-heterociloxipiridin-2-yl)-1,3-oxazolidin-2-ona y 5-(aminometil)-3-(3-heterocicililoxyphe^{PA}nyl)-1,3-oxazolidin-2-ona y composiciones que los contienen; estos compuestos, son efectivo para el tratamiento de infecciones bacterianas.

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

El artículo 14 de la Decisión 486 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".

348

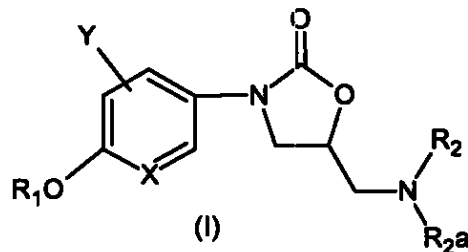
344

En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486, 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. Nuevas reivindicaciones 1 a 21 de los folios 340 a 346.

Evaluación de la novedad:

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina dispone que: *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica"*.

En la solicitud en estudio se reclaman compuestos que comprenden derivados de 5-(aminometil)-3-(6-heterociloxipyridin-2-yl)-1,3-oxazolidin-2-ona y 5-(aminometil)-3-(3-heterocicliloxypheñyl)-1,3-oxazolidin-2-ona y composiciones que los contienen, de fórmula (I).



No existe en el estado de la técnica en las bases de datos, a que tiene acceso esta oficina compuestos que caigan dentro del alcance de las reivindicaciones de la presente solicitud, por lo tanto se considera que tiene novedad.

Evaluación de Nivel Inventivo:

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina dispone que: *"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"*.

En la solicitud en estudio se reivindica los compuestos de fórmula I, ilustrados arriba se dice tienen actividad antibacteriana, por lo cual son apropiadas para tratamiento de infecciones bacterianas, por lo tanto para una persona versada en la materia, no sería obvio tomando las enseñanzas de anterioridades con compuestos de estructura parecida deducir la estructura de los compuestos

345
345

reclamados, entonces se considera por ello que la solicitud en estudio tiene nivel inventivo.

Evaluación de la Aplicación Industrial:

El art. 19 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece:
"Se considerará que una invención es susceptible de aplicación industrial, cuando su objeto puede ser producido o utilizado en cualquier tipo de industria, entendiéndose por industria, la referida a cualquier actividad productiva, incluidos los servicios."

Los compuestos de la presente solicitud son susceptibles de la síntesis de los compuesto derivados de 5-(aminometil)-3-(6-hetericiloxipiridin-2-yl)-1,3-oxazolidin-2-ona y 5-(aminometil)-3-(3-heterocicliiloxyphenyl)-1,3-oxazolidin-2-ona que tienen las fórmula I, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que tiene aplicación industrial.

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** el privilegio solicitado para las 1 a 41, folios 333 a 346.

Bogotá, D. C., 09 de febrero de 2007.

CONCEPTO TÉCNICO No. 262	JEFE DE DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202012
------------------------------------	---	--

352

346



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 5705

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO 28670

Rad. N° 00-97143

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 00097143 del día 21 de diciembre 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 330 a 332 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 00-097143-00011-0000 del 19 de enero del 2007, atendió oportunamente el requerimiento formulado, presentando nuevos folios 340 a 346, 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 21 contenidas en los folios 340 a 346, razón por la cual este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas el privilegio solicitado.

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 3820840
Fax: 382 26 95. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

5705

353

347



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 5705

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

28670

Rad. N° 00-97143

RESUELVE:

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

**" ANTIBACTERIANOS DE PIPERIDINILOXI Y PIRROLIDINILOXI OXAZOLIDINONA,
COMPOSICION FARMACEUTICA QUE LOS COMPRENDE Y PROCESO PARA SU
PREPARACION "**

Clasificación IPC: A 61 K 31/421, 31/16.

Reivindicación(es): 1 a 21

Folio(s): 340 a 346.

Titular(es): ORTHO-McNEIL PHARMACEUTICAL, INC.

Domicilio(s): Raritan, New Jersey, Estados Unidos de América.

Inventor(es): Michele Well-Weidner, Christine Boggs, Dennis Hlasta y Eric Nelson.

Prioridad N°: 60/172,923 **Fecha:** 21 de diciembre de 1999 **País:** US.
09/729,342 12 de diciembre del 2000 US.

Vigente desde: 21 de diciembre del 2000 **Hasta:** 21 de diciembre 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.

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 3820840
Fax: 382 26 95. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

357

348



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION 5705

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

28670

Rad. N° 00-97143

ARTICULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución a la doctora Jimena Escobar Uribe, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderada de Ortho – McNeil Pharmaceutical, Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede 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

28 FEB. 2007

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,

JAIRO RUBIO ESCOBAR

Doctora
JIMENA ESCOBAR URIBE
Carrera 11 A N 94 - 76, Of. 305.
Bogotá, D.C.

202021

APORTE RECIBIDO POR VALOR DE
\$ 1/00 POR CONCEPTO
DE DERECHOS ADMINISTRATIVOS

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 3820840
Fax: 382 26 95. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

RADICACIÓN: 0-97143

EDICTO No. 5106

LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:

Que esta Superintendencia profirió Resolución No. 5705 de 28-FEB-2007. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

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

" ANTIBACTERIANOS DE PIPERIDINILOXI Y PIRROLIDINILOXI OXAZOLIDINONA,
COMPOSICION FARMACEUTICA QUE LOS COMPRENDE Y PROCESO PARA SU
PREPARACION "

Clasificación IPC: A 61 K 31/421, 31/16.

Reivindicación(es): 1 a 21 Folio(s): 340 a 346.

Titular(es): ORTHO-McNEIL PHARMACEUTICAL, INC.

Domicilio(s): Raritan, New Jersey, Estados Unidos de América.

Inventor(es): Michele Weil-Weidner, Christine Boggs, Dennis Hlasta y Eric Nelson.

Prioridad N°: 60/172,923 Fecha: 21 de diciembre de 1999 País: US.
09/729,342 12 de diciembre del 2000 US.

Vigente desde: 21 de diciembre del 2000 Hasta: 21 de diciembre 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 a la doctora Jimena Escobar Uribe, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderada de Ortho - McNeil Pharmaceutical, Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede 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

28 FEB. 2007

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 8:00 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc 20-MAR-2007
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 5106

Este edicto se desfija hoy 02-ABR-2007 a las 4:30 p.m.