

Señor

SUPERINTENDENTE DELEGADO PARA LA PROPIEDAD INDUSTRIAL
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-PHARMACIA & UPJOHN COMPANY.-Expediente
número 00-083.532.-

1. Me refiero al asunto de la referencia.
2. Por medio del presente, atentamente me permito manifestar que hubo un **cambio** de apoderado para todos los asuntos de la Propiedad Industrial en Bogotá de la sociedad **PHARMACIA & UPJOHN COMPANY**.
3. En consecuencia, atentamente solicito a ese Despacho reconocirme personería en este asunto, de conformidad con la sustitución de poder adjunta, otorgada a favor de la SUSCRITA.
4. Por lo tanto, ruego a usted notificarme de las providencias expedidas dentro de este expediente y notificadas al anterior apoderado, que actualmente se encuentran pendientes de cumplimiento o de respuesta.
5. Solicito a ese Despacho proceder de conformidad.

Atentamente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

Código 231

70
66

Señor
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. _____ S. _____ D. _____

Ref: P1.- PHARMACIA & UPJOHN COMPANY - Expediente No.00-083.532.-

Yo, **JOSE ANTONIO LLOREDA**, mayor de edad y vecino de esta ciudad, abogado titulado e inscrito, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando en mi carácter de Representante Legal en Bogotá para asuntos relacionados con la propiedad industrial de **PHARMACIA & UPJOHN COMPANY**, sociedad organizada y existente de conformidad con las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América, domiciliada en Kalamazoo, Michigan, Estados Unidos de América, tal y como consta en este expediente, atentamente manifiesto a usted que **SUSTITUYO** el poder a mi conferido a la doctora **ALICIA LLOREDA RICAURTE**, abogada titulada e inscrita, identificada con la cédula de ciudadanía No. 39.690.713 de Usaquén y Tarjeta Profesional N° 53.215 para que continúe representando a la mencionada sociedad en el expediente de la referencia.

De conformidad con el artículo 66 del C.P.C., manifiesto bajo la gravedad de juramento que los demás apoderados citados en el documento otorgado a mi favor no desean ejercer el poder a ellos conferido.

El mencionado apoderado tendrá las mismas facultades a mi conferidas, en especial, renunciar, recibir, sustituir, desistir, presentar recursos, conciliar, transigir, y en fin, para todo lo que se encamine a la correcta defensa de los intereses de la sociedad en cuyo nombre hablo.

Atentamente, **JOSE ANTONIO LLOREDA**
F.P. 10784

Quien (os) exhibió(eron) la(s) C.C.
17.159.681 Código 231
T.P. 10784
El que aparece(n)
en (sur) (on) la(s) suya (en y
cierto.
a diligencia y se imprime

JOSE ANTONIO LLOREDA
C.C. No. 17.159.681 de Bogotá



Handwritten signature/initials

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 00-83532

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION FUE PUBLICADO

EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 526, DE FECHA 31 DE MARZO DE 2003, EL

TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA LEY EXPIRA EL 01 DE JULIO DE 2003.

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI

NO **X**

72
68

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020/
Bogotá, D.C.,

Doctora
Alicia Lloreda
Apoderada

Oficio N°
2865

REFERENCIA	Radicación	00 83532
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Folios	014

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 00 83532, realizado según el artículo 45 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica:

Documentos estudiados:

- . Descripción: folios 6-14
- . Ejemplos: folios 14-20
- . Capítulo reivindicatorio estudiado: folios 21-23
- . Se reivindica prioridad, presentada en Estados Unidos el 04.11.99, bajo el número 60/163537

Objeto de la Invención

Según las reivindicaciones 1 a 17 de la presente solicitud, se refiere a compuestos derivados de oxazolidinonas derivadas de sultanas y sultonas de fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables que son útiles como agentes antibióticos.

Clasificación Internacional de patentes A 61 K 31/39

Excepciones a la patentabilidad

El artículo 20d de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina establece que:
"No serán patentables los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales"

Teniendo en cuenta lo anterior, el contenido de las reivindicaciones 12-16, que trata de "Un método para tratar infecciones microbianas...", no es patentable.

73
69

Determinación del estado de la técnica:

Consultadas las fuentes de información con que cuenta este despacho, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de presentación de la presente solicitud - 04.11.99-, relacionados con la materia de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
1	WO 9709328	"Feniloxazolidinonas que tienen un enlace C-C a anillos heterocíclicos de 4-8 miembros"	13.03.97
2	WO 9929688	"S-óxidos y S,S-dióxidos de tetrahidroliopirano feniloxazolidinonas"	17.06.99
3	WO 9730995	"Derivados de oxazolidinonas antibióticos"	28.08.97
4	WO 9910342	"Derivados de oxazolidinonas antibióticos"	04.03.99
5	WO 9854161	"Agentes de oxazolidinona antibacteriales que tienen funcionalidad tiocarbonilo"	03.12.98

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

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

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

Evaluación del NIVEL INVENTIVO

El artículo 18 de la decisión 486 establece 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"*

Los documentos WO 9709328, WO 9929688, WO 9930995, WO 9910342 y WO 9854161 se relacionan con derivados de oxazolidinona 3,5-disustituida que tienen actividad antibacterial. De tales documentos se observa que el sustituyente fenilo en la posición 3 de los derivados de oxazolidinona 3,5-disustituida puede ser sustituido en la posición 4 por varios sustituyentes con la retención de la actividad antibiótica.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proveer compuestos derivados de oxazolidinina 3,5-disustituida, es una derivación evidente del estado de la técnica ya que los documentos citados enseñan compuestos similares que tienen la misma actividad terapéutica.

74
20

Un técnico con sus conocimientos y las enseñanzas de los documentos citados llegaría a sintetizar los compuestos que se pretenden proteger.

Finalmente no se demuestra un resultado sorprendente o mejorado de los compuestos de la presente solicitud en relación con los descritos en el estado de la técnica.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Relvindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	WO 9709328	1-11, 17	Nivel Inventivo
2	WO 9929688	1-11, 17	Nivel Inventivo
3	WO 9730995	1-11, 17	Nivel Inventivo
4	WO 9910342	1-11, 17	Nivel Inventivo
5	WO 9854161	1-11, 17	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 sesenta días contados a partir de la fecha de la 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 5 del título primero de la Circular Única Nº 10 de 2001


Álex Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

09 MAR. 2006

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO Número 0314	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202024
---------------------------------	-------------------------------------

PCT

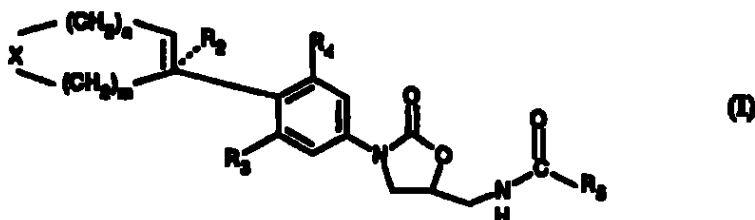
WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : C07D 413/10, A61K 31/42, C07D 417/14		A1	(11) International Publication Number: WO 97/09328
			(43) International Publication Date: 13 March 1997 (13.03.97)
(21) International Application Number: PCT/US96/12766		Michael, Robert [US/US]; 1216 Miles Avenue, Kalamazoo, MI 49001 (US). BRICKNER, Steven, J. [US/US]; 9 Fargo Drive, Ledyard, CT 06339 (US). ANDERSON, David, J. [GB/US]; 3809 Middlebury, Kalamazoo, MI 49006 (US). (74) Agent: YANG, Lucy, X.; Pharmacia & Upjohn Company, Intellectual Property Law, 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US). (81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GR, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LB, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, ARIPO patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), Brazilian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, NG, TD, TO).	
(22) International Filing Date: 13 August 1996 (13.08.96)			
(30) Priority Data: 60/003,149 1 September 1995 (01.09.95) US			
(60) Parent Application or Grant (65) Related by Continuation US 60/003,149 (CIP) Filed on 1 September 1995 (01.09.95)			
(71) Applicant (for all designated States except US): PHARMACIA & UPJOHN COMPANY [US/US]; 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US).			
(72) Inventors; and (73) Inventors/Applicants (for US only): HUTCHINSON, Douglas, K. [US/US]; 5641 Whitmore Drive, Kalamazoo, MI 49001 (US). ENNIS, Michael, D. [US/US]; 2416 Deep Forest Court, Portage, MI 49002 (US). HOFFMAN, Robert, L. [US/US]; 1523 Eganston Avenue, Kalamazoo, MI 49008 (US). THOMAS, Richard, C. [US/US]; 2166 Wild Cherry Lane, Kalamazoo, MI 49009 (US). POHL, Toni-Jo [US/US]; 304 Anderson, Wayland, MI 49348 (US). BARBACHYN,			

Published

With international search report.

(54) Title: **PHENYLOXAZOLIDINONES HAVING A C-C BOND TO 4-8 MEMBERED HETEROCYCLIC RINGS**

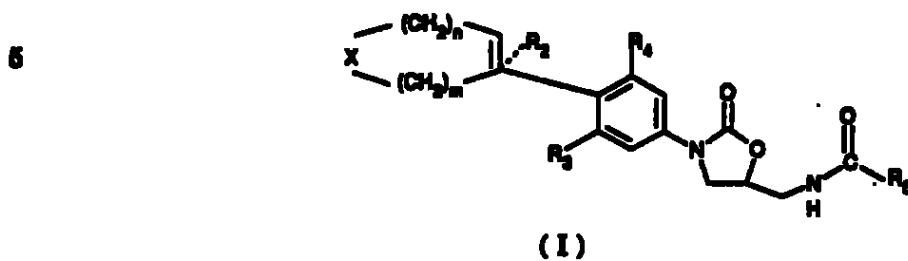
(57) Abstract

A compound of formula (I), or pharmaceutical acceptable salts thereof wherein X is NR₁, S(O)₂, or O; R₁ is H, C₁₋₄ alkyl optionally substituted with one or more OH, CN, or halo, or R₁ is -(CH₂)_n-aryl, -COR₁₋₁, -COOR₁₋₁, -CO-(CH₂)_n-COR₁₋₁, C₁₋₄ alkyl sulfonyl, SO₂-(CH₂)_n-aryl, or -(CO)₂-Het; R₂ is H, C₁₋₄ alkyl, -(CH₂)_n-aryl, or halo; R₃ and R₄ are the same or different and are H or halo; R₅ is H, C₁₋₁₂ alkyl optionally substituted with one or more halo, C₃₋₁₂ cycloalkyl, C₁₋₄ alkoxy. The compounds are useful antimicrobial agents.

76
72

We claim:

1. A compound of the formula I:



10 or pharmaceutical acceptable salts thereof wherein:

X is

- a) NR_1 ,
- b) S(O)_2 or
- c) O ;

15 R_1 is

- a) H ,
- b) C_{1-6} alkyl, optionally substituted with one or more OH, CN, or halo,
- c) $-(\text{CH}_2)_k\text{-aryl}$,
- d) $-\text{COR}_{1-1}$,
- 20 e) $-\text{COOR}_{1-2}$,
- f) $-\text{CO}-(\text{CH}_2)_k-\text{COR}_{1-1}$,
- g) $-\text{SO}_2-\text{C}_{1-6}$ alkyl,
- h) $-\text{SO}_2-(\text{CH}_2)_k\text{-aryl}$, or
- i) $-(\text{CO})_t\text{-Het}$;

25 R_{1-1} is

- a) H ,
- b) C_{1-6} alkyl, optionally substituted with one or more OH, CN, or halo,
- c) $-(\text{CH}_2)_k\text{-aryl}$, or
- d) $-(\text{CH}_2)_k\text{-OR}_{1-3}$;

30 R_{1-2} is

- a) C_{1-6} alkyl, optionally substituted with one or more OH, CN, or halo,
- b) $-(\text{CH}_2)_k\text{-aryl}$, or
- c) $-(\text{CH}_2)_k\text{-OR}_{1-3}$;

 R_{1-3} is

- 35 a) H ,
- b) C_{1-6} alkyl,

77
23

- e) $-(CH_2)_h$ -aryl, or
- d) $-CO(C_{1-6} \text{ alkyl})$;

R_2 is

- a) H,
- b) C_{1-6} alkyl,
- c) $-(CH_2)_h$ -aryl, or
- d) halo;

R_3 and R_4 are the same or different and are

- a) H, or
- b) halo;

R_5 is

- a) H,
- b) C_{1-12} alkyl, optionally substituted with one or more halo,
- c) C_{2-12} cycloalkyl,
- d) C_{1-6} alkoxy;

g is 0, 1, or 2;

h is 1, 2, 3, or 4;

i is 0 or 1;

m is 0, 1, 2, 3, 4, or 5;

n is 0, 1, 2, 3, 4, or 5;

and with the proviso that m and n taken together are 1, 2, 3, 4, or 5.

2. A compound of Claim 1 wherein R_1 is selected from the group consisting of H, fluoroethyl, cyanomethyl, methyl sulfinyl, formyl, hydroxyacetyl, acetyl,

methoxyacetyl, benzoyloxyacetyl, acetoxyacetyl, dichloroacetyl, methoxy carbonyl, tert-butoxy carbonyl, benzyloxy carbonyl, 3-hydroxypropionyl, 3-methoxypropionyl, 4-oxopentanoyl, 2-indole carbonyl, 5-isoxazole carbonyl, 5-nitro-2-thiazoyl, 4-oxo-2-thiazolinyl, and 5-methyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl.

3. A compound of Claim 1 wherein R_2 is H, F, or CH_3 .

4. A compound of Claim 1 wherein R_3 and R_4 are the same and different and are H or F.

5. A compound of Claim 1 wherein R_5 is methyl or methyl substituted with one or more F or Cl.



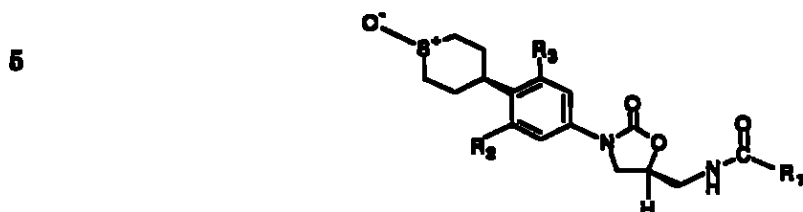
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6: C07D 413/10, A61K 31/38, 31/42	A1	(11) International Publication Number: WO 99/29688 (43) International Publication Date: 17 June 1999 (17.06.99)
(21) International Application Number: PCT/US98/24526 (22) International Filing Date: 23 November 1998 (23.11.98) (30) Priority Data: 60/067,830 5 December 1997 (05.12.97) US 60/089,498 16 June 1998 (16.06.98) US 60/100,185 14 September 1998 (14.09.98) US (71) Applicant (for all designated States except US): PHARMACIA & UPJOHN COMPANY [US/US]; 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US). (72) Inventors; and (73) Inventor/Applicants (for US only): POEL, Toni-Jo [US/US]; 304 Anderson, Wayland, MI 49348 (US). MARTIN, Joseph, P., Jr. [US/US]; 6749 North 32nd Street, Richland, MI 49093 (US). BARBACHYN, Michael, R. [US/US]; 32 Viola Drive, East Hampton, CT 06424 (US). (74) Agent: YANG, Lucy, X.; Pharmacia & Upjohn Company, Intellectual Property Legal Services, 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US).		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With international search report. Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of the receipt of amendments.
(54) Title: S-OXIDE AND S,S-DIOXIDE TETRAHYDROTHIOPYRAN PHENYLOXAZOLIDINONES (I) (II) (57) Abstract The present invention provides compounds of formula (I) and formula (II) useful as antimicrobial agents wherein R₁ is methyl, ethyl, cyclopropyl, or dichloromethyl; R₂ and R₃ are independently hydrogen or fluoro; R₄ is ethyl or dichloromethyl. The invention also relates to a novel assay for determining the inhibitory activity of coxolidinones to human monoamine oxidase.		

7A
75

CLAIMS

1. A compound of formula I



10

I

or pharmaceutically acceptable salts thereof wherein:

R₁ is

- a) methyl,
b) ethyl,
15 c) cyclopropyl, or
d) dichloromethyl;

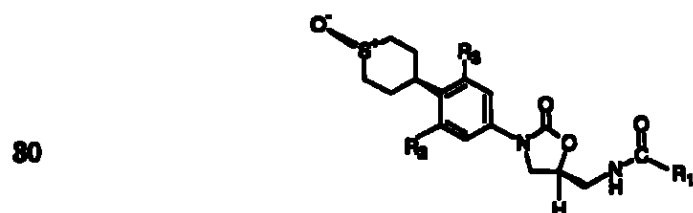
R₂ and R₃ are the same or different and are

- a) hydrogen, or
b) fluoro.
20

2. A compound of claim 1 wherein R₁ is methyl.

3. A compound of claim 1 wherein R₂ is fluoro; R₃ is hydrogen.

- 25 4. A compound of formula I in claim 1 which is



5. A compound of formula I in claim 1 which is
35



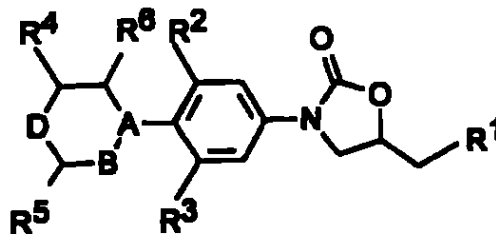
76

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : C07D 413/10, A61K 31/42, C07D 263/24, 263/18, 417/10 H (C07D 413/10, 309:00) (C07D 413/10, 211:00)		A1	(11) International Publication Number: WO 97/30995
			(43) International Publication Date: 28 August 1997 (28.08.97)
(21) International Application Number: PCT/GB97/00462		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GR, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(22) International Filing Date: 20 February 1997 (20.02.97)		Published With international search report. With amended claims.	
(30) Priority Data: 9603939.1 24 February 1996 (24.02.96) GB 9618404.9 4 September 1996 (04.09.96) GB			
(71) Applicant (for all designated States except US): ZENECA LIMITED (GB/GB); 15 Stanhope Gate, London W1Y 6LN (GB).			
(72) Inventor, and (73) Inventor/Applicant (for US only): GRAVESTOCK, Michael, Barry (GB/GB); Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB).			
(74) Agent: DENERLEY, Paul, Millington; Intellectual Property Dept., Zeneca Pharmaceuticals, Macclesfield, Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB).			
(54) Title: ANTIBIOTIC OXAZOLIDINONE DERIVATIVES			
(I)			
(57) Abstract			
The invention concerns a compound of formula (I) wherein, for example: R¹ is of the formula -NHC(O)R^b wherein R^b is, for example, (1-4C)alkyl; R² and R³ are hydrogen or fluoro; D is O, S, SO, SO₂ or NR⁷; R⁴ and R⁵ are hydrogen, AR-oxy-methy; R⁶ is hydrogen; >A-B- is of the formula >C-C(R⁹)-, >CHCH(R⁹)-, or >C(OH)CH(R⁹)- (> represents two single bonds) wherein R⁹ is hydrogen or (1-4C)alkyl; R⁷ is hydrogen, AR or of the formula R¹⁰CO-, R¹⁰SO₂-, R¹⁰CS-, R¹⁰OC(R⁹)-CH(C-O)-, R¹⁰C(O)C(O)-, R¹⁰N-C(R⁹)C(O)- or R¹⁰NHC(R⁹)-CHC(O)- or R¹⁰CH(R¹³)(CH₂)_m-; wherein, for example, R¹⁰ is AR; R⁴, R⁶, R⁷, R⁹, R¹³, R¹ and R^b are (1-6C)alkyl; m is 0 or 1, R¹³ is cyano, R¹⁴ is hydrogen or (1-4C)alkyl; AR is phenyl; and pharmaceutically-acceptable salts thereof; processes for their preparation; pharmaceutical compositions containing them and their use as antibacterial agents.			

CLAIMS

1. A compound of the formula (I):



(I)

wherein:

- 10 R¹ is hydroxy, chloro, fluoro, (1-4C)alkanesulfonyloxy, amino, azido, (1-4C)alkoxy, (1-4C)alkylthio, (1-4C)alkylaminocarbonyloxy;
or of the formula -NHC(=O)R^b wherein R^b is hydrogen, (1-4C)alkoxy, amino, chloromethyl, dichloromethyl, cyanomethyl, methoxymethyl, acetylmethyl, methylamino, dimethylamino or (1-4C)alkyl;
- 15 or R¹ is of the formula -NHS(O)_n(1-4C)alkyl wherein n is 0, 1 or 2;
R¹ and R³ are independently hydrogen or fluoro;
D is O, S, SO, SO₂ or NR⁷;
when D is O, R⁴ and R⁵ are independently hydroxy, bromo, oxo (=O), (1-4C)alkyl, (1-4C)alkanoylamino-(1-4C)alkyl, hydroxy-(1-4C)alkyl, carboxy, (1-4C)alkoxycarbonyl,
20 AR-oxymethyl, AR-thiomethyl (wherein AR is as defined hereinbelow) or independently as defined for R⁷ hereinbelow;
when D is S, SO, SO₂ or NR⁷, R⁴ and R⁵ are independently oxo (=O), (1-4C)alkyl, (1-4C)alkanoylamino-(1-4C)alkyl, hydroxy-(1-4C)alkyl, carboxy, (1-4C)alkoxycarbonyl, AR-oxymethyl, AR-thiomethyl (wherein AR is as defined
25 hereinbelow) or independently as defined for R⁷ hereinbelow;
R⁴ is hydrogen, (1-4C)alkyl, hydroxy, (1-4C)alkoxy or (2-4C)alkanoyloxy;
>A-B- is of the formula >C=C(R^a)-, >CHCHR^a-, or >C(OH)CHR^a- (> represents two single bonds) wherein R^a is hydrogen or (1-4C)alkyl;

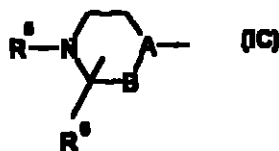
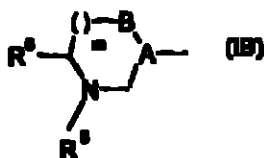
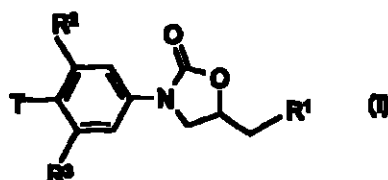
PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

SL
78

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 413/10, A61K 31/42, C07D 498/04, 513/04, 487/04, 471/04	A1	(11) International Publication Number: WO 99/10342 (43) International Publication Date: 4 March 1999 (04.03.99)
(21) International Application Number: PCT/GB98/02476 (22) International Filing Date: 18 August 1998 (18.08.98) (30) Priority Data: 9717807.3 22 August 1997 (22.08.97) GB (71) Applicant (for all designated States except US): ZENECA LIMITED [GB/GB]; 15 Stanhope Gate, London W1Y 6LN (GB). (72) Inventor; and (75) Inventor/Applicant (for US only): GRAVESTOCK, Michael, Barry [GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB). (74) Agent: DENBRIE, Paul, Millington; Zeneca Pharmaceuticals, Intellectual Property Dept., Macclesfield, Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB).	(81) Designated States: JP, US, European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Published With international search report.	

(54) Title: **ANTIBIOTIC OXAZOLIDINONE DERIVATIVES**

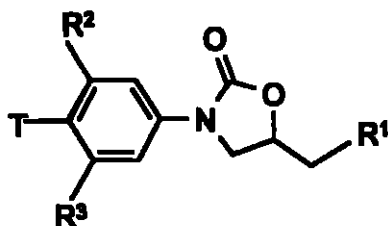
(57) Abstract

The invention concerns a compound of formula (I); wherein, for example: T is of formula (IA), (IB) or (IC); R¹ is of the formula -NHCO-O-R³ wherein R³ is (1-4C)alkyl; R² and R³ are hydrogen or fluoro; >A-B- is >C-CH- (but not when T is (IA)) or >CH-CH₂-; wherein when T is of formula (IA) or (IB); R⁶ is, for example, (1-4C)alkyl; R⁵ is hydrogen, R¹⁰CO-, R¹⁰SO₂- or R¹⁰CS- wherein R¹⁰ is, for example, optionally substituted phenyl, or (1-10C)alkyl; or when T is of formula (IA), (IB) or (IC); R² and R⁶ are linked to give a 5- or 6-membered ring which is fused to the ring shown in (IA), (IB) or (IC) so as to give an optionally substituted bicyclic ring; and pharmaceutically-acceptable salts thereof, processes for their preparation; pharmaceutical compositions containing them and their use as antibacterial agents.

SB
79

CLAIMS

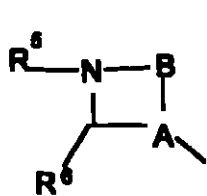
1. A compound of the formula (I),



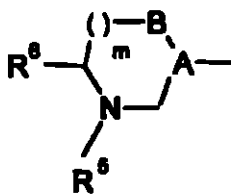
(I)

wherein:

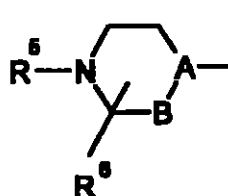
T is of the formula (IA), (IB) or (IC);



or



or



(IA)

(IB)

(IC)

10

(wherein the R⁶ group in (IC) may be in the 2- or 6-position relative to the ring nitrogen atom);

R¹ is chloro, fluoro, (1-4C)alkanesulfonyloxy, azido, (1-4C)alkoxy, (1-4C)alkylthio,

- 15 (1-4C)alkylaminocarbonyloxy, or of the formula -NHC(=O)R^b wherein R^b is hydrogen, (1-4C)alkoxy, amino, chloromethyl, dichloromethyl, cyanomethyl, methoxymethyl, acetylmethyl, methylamino, dimethylamino or (1-4C)alkyl, or of the formula -NHS(O)_n(1-4C)alkyl wherein n is 0, 1 or 2;

R² and R³ are independently hydrogen or fluoro;

20

>A-B- is >C=CH-, >C(R⁴)-CH₂-, >CH-CH₂-, >C=C(R⁴)-, >C(R⁴)-CH(R⁴)- or

>CH-CH(R⁴)- (wherein, herein and hereinafter, > represents two single bonds), provided that

>A-B- is not >C=CH-, >C=C(R⁴)-, >C(R⁴)-CH(R⁴)- or >CH-CH(R⁴)- when T is of the formula (IA); wherein R⁴ is hydrogen, hydroxy, halo, (1-4C)alkyl or (1-4C)alkanoyloxy;

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

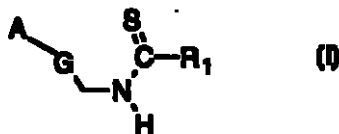


80

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : C07D 263/20, 417/12, 413/10, 413/04, A61K 31/42, C07D 261/04, 307/32, 471/10 // (C07D 471/10, 235:00, 221:00)		A1	(11) International Publication Number: WO 98/54161 (43) International Publication Date: 3 December 1998 (03.12.98)
(21) International Application Number: PCT/US98/09889 (22) International Filing Date: 18 May 1998 (18.05.98) (30) Priority Data: 60/048,342 30 May 1997 (30.05.97) US (71) Applicant (for all designated States except US): PHARMACIA & UPJOHN COMPANY [US/US]; 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US). (72) Inventors; and (73) Inventor/Applicants (for US only): HESTER, Jackson, B., Jr. [US/US]; 9219 East ML Avenue, Galesburg, MI 49053 (US). NIDY, Eldon, George [US/US]; 3103 Morgan Street, Kalamazoo, MI 49001 (US). FERRICONE, Salvatore, Charles [US/US]; 7011 Division Avenue, Delton, MI 49046 (US). POEL, Toni-Jo [US/US]; 304 Anderson, Wayland, MI 49348 (US). (74) Agent: YANG, Lucy, X.; Pharmacia & Upjohn Company, Intellectual Property Legal Services, 301 Henrietta Street, Kalamazoo, MI 49001 (US).		(51) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TO). Published With international search report.	

(54) Title: OXAZOLIDINONE ANTIBACTERIAL AGENTS HAVING A THIOCARBONYL FUNCTIONALITY



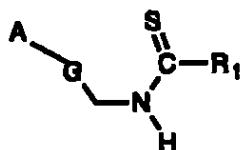
(57) Abstract

The present invention provides compounds of Formula (I) or pharmaceutical acceptable salts thereof wherein A, G and R₁ are as defined in the claims which are antibacterial agents.

WHAT IS CLAIMED:

1. A compound of the formula I

5



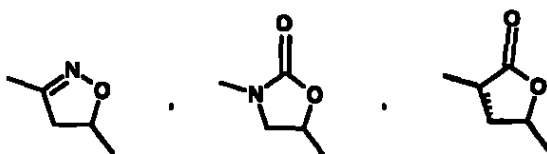
10

I

or pharmaceutical acceptable salts thereof wherein:

G is

15



R₁ is

- 20
- a) H,
 - b) NH₂,
 - c) NH-C₁₋₄ alkyl,
 - d) C₁₋₄ alkyl,
 - e) -OC₁₋₄ alkyl,
 - f) -S C₁₋₄ alkyl,
 - 25 g) C₁₋₄ alkyl substituted with 1-3 F, 1-2 Cl, CN or -COOC₁₋₄ alkyl,
 - h) C₃₋₆ cycloalkyl,
 - i) N(C₁₋₄) alkyl)₂ or
 - j) N(CH₂)₂₋₅;

A is

30

