

Señor  
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES  
E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_



Re: **PI.-ASTRAZENECA AB y DAINIPPON SUMITOMO PHARMA CO.  
LTD.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para  
"IMIDAZOQUINOLINAS CON PROPIEDADES INMUNO-  
MODULADORAS".-Clase C07D 471/04.-Expediente número 09-  
118.667.-**

1. Me refiero al Oficio No. **14353** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista del 11 de Diciembre de 2009.

2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito manifestar a ese Despacho que no se anexa recibo correspondiente al pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada, por cuanto el solicitante ha presentado una modificación al capítulo reivindicatorio, junto con el memorial radicado ante ese Despacho el 26 de Enero de 2010, quedando el capítulo reivindicatorio conformado por 15 reivindicaciones, razón por la cual no se anexa recibo.

En consecuencia se anexa el juego de 15 reivindicaciones que se debe tener en cuenta para el estudio de fondo de la presente solicitud.

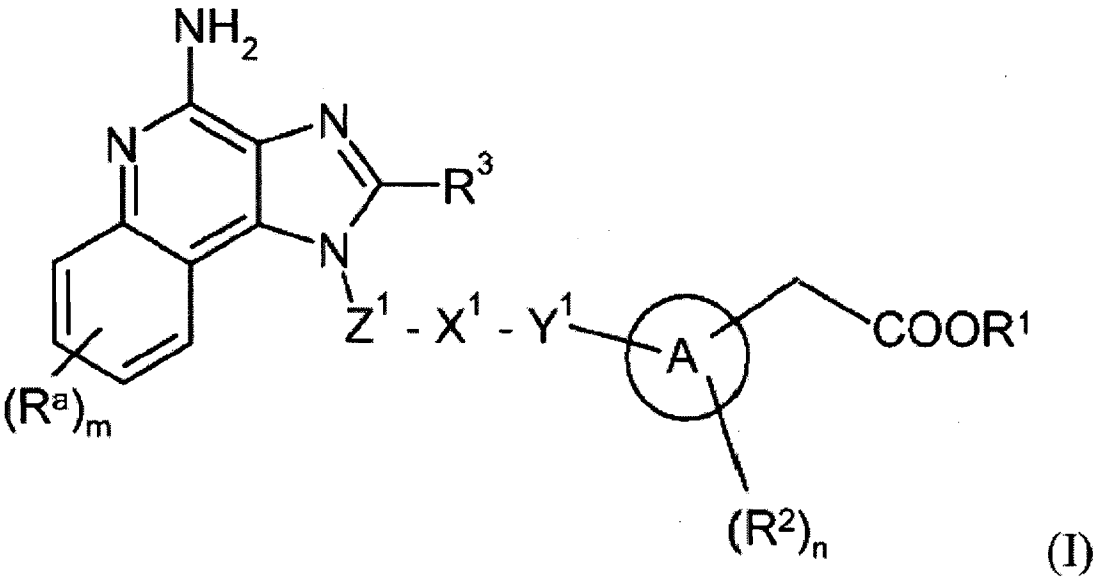
3. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,

  
ALICIA LLOREDA RICAURTE  
T.P. 53.215

**REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto de formula (I)



en donde

R<sup>1</sup> representa una cadena lineal alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, opcionalmente sustituida por uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, hidroxilo y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

Z<sup>1</sup> representa un grupo alquilenos C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilenos C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>;

X<sup>1</sup> representa NR<sup>5</sup>, >N-COR<sup>5</sup>, CONR<sup>5</sup>, NR<sup>5</sup>CO, SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>, >N-SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>, NR<sup>5</sup>CONR<sup>6</sup> o NR<sup>6</sup>CONR<sup>5</sup>, S(O)<sub>p</sub> u O;

Y<sup>1</sup> representa un enlace sencillo o alquilenos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

cada  $R^2$  se selecciona independientemente de halógeno, ciano, hidroxil, tiol, alquilo  $C_1-C_3$ , hidroxialquilo  $C_1-C_3$ , haloalquilo  $C_1-C_3$ , alcoxi  $C_1-C_3$ , haloalcoxi  $C_1-C_3$ , alquiltio  $C_{1-3}$ , alquilsulfonilo  $C_{1-3}$  y alquilsulfinilo  $C_{1-3}$ ;

$R^3$  representa alquilo  $C_{1-6}$  sustituido opcionalmente por alcoxi  $C_{1-6}$ ;

cada  $R^a$  se selecciona independientemente de halógeno, ciano, hidroxil, tiol, alquilo  $C_1-C_3$ , hidroxialquilo  $C_1-C_3$ , haloalquilo  $C_1-C_3$ , alcoxi  $C_1-C_3$ , haloalcoxi  $C_1-C_3$ , alquiltio  $C_1-C_3$ , alquilsulfonilo  $C_{1-3}$  y alquilsulfinilo  $C_{1-3}$ ;

$R^5$  representa hidrógeno, un anillo heterocíclico saturado de 3 a 8 miembros que comprende un grupo de anillo O,  $S(O)_p$  o  $NR^{10}$ , un grupo alquilo  $C_1-C_6$  o grupo cicloalquilo  $C_3-C_6$ , estando los últimos dos grupos opcionalmente sustituidos por uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de  $NR^7R^8$  o  $R^9$ ,

o  $R^5$  es un alquilenos  $C_1-C_6$  que puede estar enlazado a un átomo de carbono dentro de un grupo alquilenos  $C_2-C_6$   $Z^1$  con el fin de formar un anillo saturado que contiene nitrógeno, de 4-7 miembros;

siempre que cuando  $X^1$  es  $>N-SO_2R^5$ ,  $R^5$  no representa hidrógeno;

$R^7$  y  $R^8$  cada uno representa independientemente hidrógeno, un anillo heterocíclico saturado de 3 a 8 miembros que comprende un grupo de anillo O,  $S(O)_p$  o  $NR^{10a}$ , alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$ , estando los últimos dos grupos sustituidos opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de halógeno, ciano,  $S(O)_qR^{11}$ ,  $OR^{12}$ ,  $CO_2R^{12}$ ,  $OC(O)R^{12}$ ,  $SO_2NR^{12}R^{13}$ ,  $CONR^{12}R^{13}$ ,  $NR^{12}R^{13}$ ,  $NR^{12}SO_2R^{14}$ ,  $NR^{12}COR^{13}$ , o un anillo heterocíclico saturado de 3 a 8 miembros que comprende un grupo de anillo O,  $S(O)_p$  o  $NR^{10b}$ ,

o  $R^7$  y  $R^8$  junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado de 3 a 8 miembros que comprende un átomo de nitrógeno en el anillo y opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales seleccionados independientemente de nitrógeno, oxígeno, azufre, y sulfonilo, estando el anillo heterocíclico opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano,  $S(O)_qR^{15}$ ,  $OR^{15}$ ,  $CO_2R^{15}$ ,  $COR^{15}$ ,  $OC(O)R^{15}$ ,  $SO_2NR^{15}R^{16}$ ,  $CONR^{15}R^{16}$ ,  $NR^{15}R^{16}$ ,  $NR^{15}SO_2R^{17}$ ,  $NR^{15}COR^{16}$ ,  $NR^{15}CO_2R^{16}$ , heteroarilo, haloalquilo  $C_1$ - $C_6$ , cicloalquilo  $C_3$ - $C_8$  y alquilo  $C_1$ - $C_6$ , estando los últimos dos grupos sustituidos opcionalmente por uno o más grupos seleccionados independientemente de ciano,  $S(O)_qR^{18}$ ,  $OR^{18}$ ,  $CO_2R^{18}$ ,  $SO_2NR^{18}R^{19}$ ,  $CONR^{18}R^{19}$  o  $NR^{18}R^{19}$ ,

$R^9$  representa halógeno, ciano,  $CO_2R^{20}$ ,  $S(O)_qR^{20}$ ,  $OR^{20}$ ,  $SO_2NR^{20}R^{22}$ ,  $CONR^{20}R^{22}$ ,  $NR^{20}SO_2R^{21}$ ,  $NR^{20}CO_2R^{21}$ ,  $NR^{20}COR^{22}$ , o un anillo heterocíclico saturado de 3 a 8 miembros que comprende un grupo de anillo  $NR^{10c}$ ,

$R^{10}$ ,  $R^{10a}$ ,  $R^{10b}$  y  $R^{10c}$  representa independientemente hidrógeno,  $CO_2R^{23}$ ,  $S(O)_qR^{23}$ ,  $COR^{24}$ , o un grupo alquilo  $C_1$ - $C_6$ , alquenilo  $C_2$ - $C_6$ , alquinilo  $C_2$ - $C_6$  o cicloalquilo  $C_3$ - $C_8$ , cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido por uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano,  $OR^{25}$  o  $NR^{25}R^{26}$ ,

$R^6$ ,  $R^{11}$ ,  $R^{12}$ ,  $R^{13}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$  y  $R^{26}$  cada uno representa independientemente hidrógeno, alquilo  $C_1$ - $C_6$  o cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ ;

$R^{14}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{21}$  y  $R^{23}$  cada uno representa independientemente alquilo  $C_1$ - $C_6$  o cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ ;

$m, n, p$  y  $q$  cada uno representa independientemente un entero 0, 1 o 2; y

A representa un arilo C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> monocíclico o bicíclico o un grupo heteroarilo C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub> monocíclico o bicíclico que contiene 1-3 heteroátomos; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R<sup>1</sup> es metilo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o reivindicación 2, en donde Z<sup>1</sup> es n-propileno.

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde X<sup>1</sup> es un grupo NR<sup>5</sup> o >NCOR<sup>5</sup>.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde X<sup>1</sup> es >NCOR<sup>5</sup>.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 o reivindicación 5, en donde R<sup>5</sup> es hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> opcionalmente sustituido por uno o más grupos NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup> donde R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son como se definieron en la reivindicación 1.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 o reivindicación 5, en donde R<sup>5</sup> es un alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que puede estar enlazado a un átomo de carbono dentro de un grupo alquileo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> Z<sup>1</sup> con el fin de formar un anillo saturado de 4-7 miembros que contiene nitrógeno.

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde Y<sup>1</sup> representa alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde A es fenilo.

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde n es 0.

11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde R<sup>3</sup> es n-butilo, metoxi etilo o etoxmetilo.

12. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde m es 0.

13. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado de:

Metil 2-(4-((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propilamino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propilamino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Sal de di-trifluoroacetato de metil 2-(3-((4-((4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)metil)piperidin-1-il)metil)fenil)acetato,

Metil [4-({[3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil][2-(dimetilamino)etil]amino}metil)fenil]acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-(etoximetil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(1-metilpiperidin-4-il)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(1-metilpiperidin-4-il)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metilpiperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(3-(dimetilamino)propil)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(3-morfolinopropil)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(3-(etil(metil)amino)propil)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(3-(4-metilpiperazin-1-il)propil)amino)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(metilsulfonil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-morfolinoacetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-((2-metoxietil)(metil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((2-(4-acetilpiperazin-1-il)-N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

(R)-Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(3-hidroxi-pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(pirimidin-2-il)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Etil 4-(2-(((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(4-(2-metoxi-2-oxoetil)bencil)amino)-2-oxoetil)piperazin-1-carboxilato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(etilsulfonil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(*ter*-butoxicarbonilamino)piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(*ter*-butoxicarbonil(metil)amino)piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Etil 2-(1-(2-((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(4-(2-metoxi-2-oxoetil)bencil)amino)-2-oxoetil)piperidin-4-il)acetato,

Metil 1-(2-((3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(4-(2-metoxi-2-oxoetil)bencil)amino)-2-oxoetil)piperidin-4-carboxilato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de sacarina,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-((2-metoxietil)(metil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-3-(piperidin-1-il)propanamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-(((3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)(3-morfolinopropil)amino)metil)fenil)acetato,

(S)-Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(2-(metoximetil)pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de disacarina,

(R)-Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(2-(metoximetil)pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de disacarina,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de disacarina,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-((2-hidroxietil)(metil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de disacarina,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-((2-metoxietil)(metil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(butil(metil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dipropilamino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(bis(2-hidroxietil)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(metil(tetrahidro-2H-piran-4-il)amino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(azetidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(3-hidroxiacetidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(3-hidroxi-pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

(R)-Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(3-hidroxi-pirrolidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-hidroxi-piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metoxipiperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(dimetilcarbamoil)piperidin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-morfolinoacetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-((2S,6R)-2,6-dimetilmorfolino)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metilpiperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(2-hidroxietil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(2-metoxietil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((2-(4-acetilpiperazin-1-il)-N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(metilsulfonil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(azepan-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(1,4-oxazepan-4-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metil-1,4-diazepan-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((2-(4-acetil-1,4-diazepan-1-il)-N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(etilcarbamoil)-1,4-diazepan-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(metilsulfonil)-1,4-diazepan-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(2-metoxietil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((2-(4-acetil-1,4-diazepan-1-il)-N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(metilsulfonil)-1,4-diazepan-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((2-((1-acetilpiperidin-4-il)(metil)amino)-N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de ácido dimetano sulfónico,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de monosacarina,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de disacarina,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de ácido di-1-hidroxi-2-naftóico,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de ácido dibenceno sulfónico,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de ácido mandélico,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-butil-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(dimetilamino)acetamido)metil)fenil)acetato, sal de ácido fumárico,

Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metilpiperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

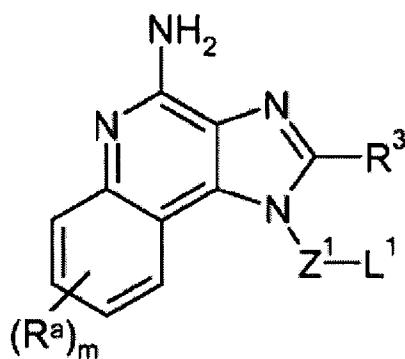
Metil 2-(4-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(2-metoxietil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-metilpiperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato, o

Metil 2-(3-((N-(3-(4-amino-2-(2-metoxietil)-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-1-il)propil)-2-(4-(2-metoxietil)piperazin-1-il)acetamido)metil)fenil)acetato,

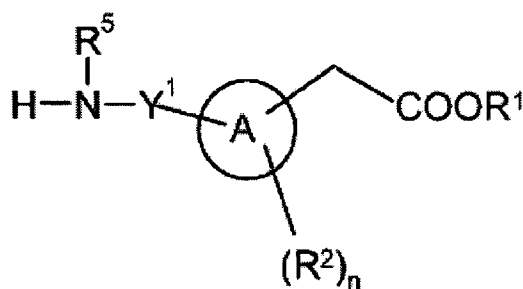
14. Un proceso para la preparación de un compuesto de formula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como se definió anteriormente, el cual comprende cualquiera de:

a) cuando  $X^1$  es un grupo  $NR^5$ , la reacción de un compuesto de formula (II)



(II)

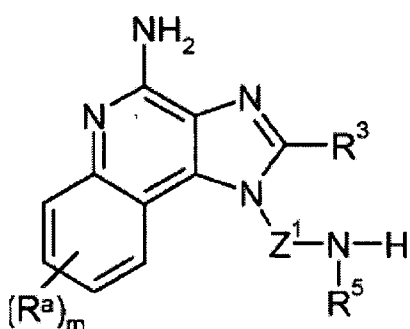
en donde  $Z^1$ ,  $R^3$ ,  $R^a$  y  $m$  son como se definieron en la formula (I) y  $L^1$  es un grupo saliente, con un compuesto de formula (III)



(III)

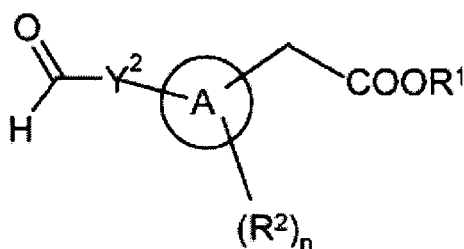
en donde  $Y^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^5$ ,  $A$  y  $n$  son como se definieron en la formula (I); o

(b) cuando  $X^1$  es un grupo  $NR^5$  y  $Y^1$  es alquileo  $C_1-C_6$ , la reacción de un compuesto de formula (IV)



(IV)

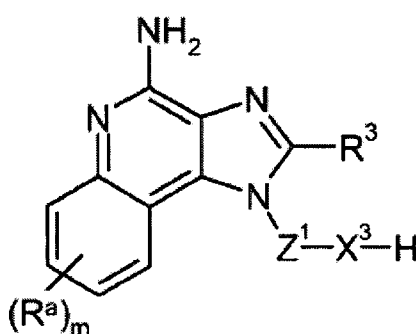
donde  $R^a$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $Z^1$  y  $m$  son como se definieron en la formula (I), con un compuesto de formula (V)



(V)

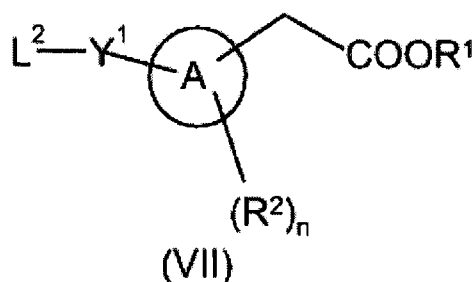
donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $A$  y  $n$  son como se definieron en la formula (I) y  $Y^2$  es un enlace o un grupo alquileo  $C_{1-5}$  en la presencia de un agente reductor adecuado (p.e., triacetoxiborohidruro de sodio); o

(c) cuando  $X^1$  es un grupo  $NR^5$ , O o S, la reacción de un compuesto de formula (VI)



(VI)

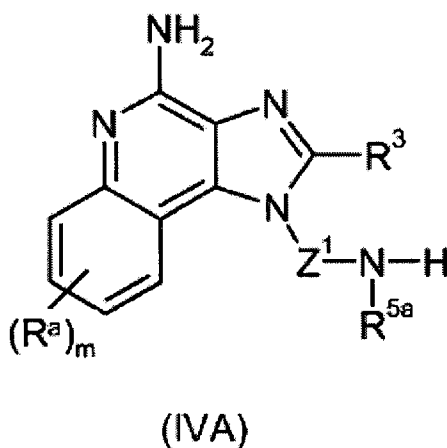
en donde  $X^3$  es un grupo  $NR^5$ , O o S, y  $Z^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^a$  y m son como se definieron en la formula (I), con un compuesto de formula (VII)



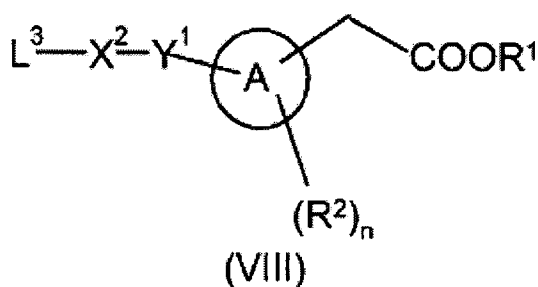
donde  $Y^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ , A y n son como se definieron en la formula (I) y  $L^2$  es un grupo saliente; o

(d) cuando  $X^1$  es un grupo  $S(O)_p$ , en donde p es 1 o 2, la oxidación de un compuesto de formula (I) donde  $X^1$  es S; o

(e) cuando  $X^1$  es un grupo  $NR^5CO$ ,  $NR^5SO_2$ ,  $NR^5CONR^6$  o  $NR^6CONR^5$ , la reacción de un compuesto de formula (IVA)

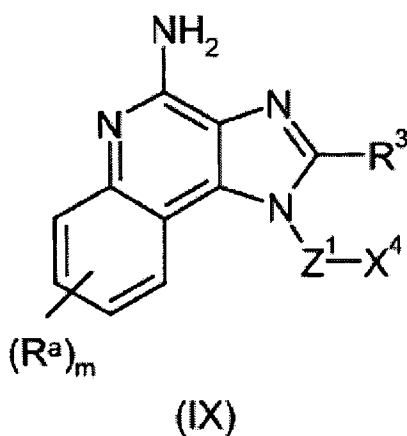


donde  $R^a$ ,  $R^3$ ,  $Z^1$  y m son como se definieron con relación a la formula (I) y  $R^{5a}$  es un grupo  $R^5$  o  $R^6$  como se definió con relación a la formula (I), con un compuesto de formula (VIII)



donde  $L^3$  es un grupo saliente tal como halo,  $X^2$  es un grupo CO,  $SO_2$ ,  $CONR^6$  o  $CONR^5$  respectivamente, y  $Y^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ , A y n son como se definieron con relación a la formula (I); o

(f) cuando  $X^1$  es  $CONR^5$  o  $SO_2NR^5$ , la reacción de un compuesto de formula (IX)



donde  $X^4$  es un ácido activado tal como un cloruro ácido o  $SO_2Cl$ ,  $R^a$ ,  $R^3$ ,  $Z^1$  y m son como se definieron en la formula (I), con un compuesto de formula (III) como se definió anteriormente; o

(h) cuando  $X^1$  es  $>N-COR^5$  o  $>N-SO_2R^5$ , la reacción de un compuesto de formula (I) cuando  $X^1$  es  $NR^5$ , donde  $R^5$  es hidrógeno, con un compuesto de formula (X) o (XI) respectivamente.



(X)



(XI)

donde  $L^4$  es un grupo saliente tal como halo, por ejemplo, cloro, y  $R^5$  se define con relación a la fórmula (I);

y posteriormente, si se desea o es necesario, realizar una o más de las siguientes etapas:

- convertir el compuesto obtenido a un compuesto adicional de fórmula (I)
- remover cualquier grupo protector
- formar una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto.

15. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo como se reivindicó en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 en asociación con un adyuvante, diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.



2020  
Bogotá D.C.,

Doctor(a)  
LLORED A RICAURTE ALICIA  
Apoderado(a) y/o Representante de  
ASTRAZENECA AB  
DAINIPPON SUMITOMO PHARMA CO., LTD

|            |                            |                   |
|------------|----------------------------|-------------------|
| REFERENCIA | Radicación No.             | 9 118667          |
|            | Solicitud internacional    | PCT/GB2008/050328 |
|            | Fecha inicio fase nacional | 08/12/2009        |
|            | Trámite                    | 11                |
|            | Evento                     | 378               |
|            | Actuación                  | 416               |
|            | Oficio No.                 | 11469             |
|            | Folios                     | 1                 |

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 la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase  
Dado en Bogotá DC,

24 NOV. 2010

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL  
Directora de Nuevas Creaciones (c)

adpall