

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

ABOGADOS

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

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E.

S.

D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-052262- -00004-0000

Fecha: 2011-07-28 17:55:06

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 444 RESPUESTAREQUE

Folios: 9

Re: PI.-NUCITEC S.A. DE C.V.-Solicitud de Patente de Invención en Fase
Nacional PCT para "β-HIDROXI-y-AMINOFOSFONATOS Y
MÉTODOS PARA LA PREPARACIÓN Y USO DE LOS MISMOS".-
Clase A01N 57/18.-Expediente número 11-052.262.-

1. Me refiero al Oficio No. **08898** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 3 de Junio de 2011.

2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar el recibo de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 11 a 22, las cuales deberán ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Recibo número 11-0071415, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa mencionada; y

(b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por **22** reivindicaciones.

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

Señor Superintendente,

ALICIA LLORED A RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

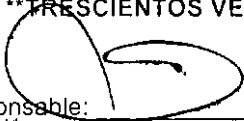
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 11 - 0071415
		Bogotá D.C., Julio 25 de 2011 - 16:32:59

RECIBIDO DE : LLOREDA & CIA. S.A.	NI 830.022.145
-----------------------------------	----------------

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	414999911	25/07/2011	19.197.000.00

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. LINDITARIO	Vr. CONCEPTO
12 50005-01-01	SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	27.000.00	324.000.00
				\$324.000.00

SON: **TRESIENTOS VEINTICUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: 

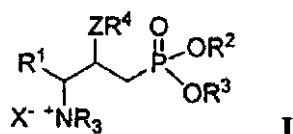
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-052262- -00004-0000
Fecha: 2011-07-28 17:55:06 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

REIVINDICACIONES:

1. Un compuesto de Formula I



en donde:

R se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo inferior;

R¹ se selecciona del grupo que consiste de alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, y heterociclo opcionalmente sustituido;

R² y R³ se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, arilo opcionalmente sustituido, y catión monovalente farmacéuticamente aceptable, o tomados juntos R² y R³ representan un catión divalente farmacéuticamente aceptable;

R⁴ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, y COR⁵;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste de alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, arilo

opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, y heterociclo opcionalmente sustituido;

X^- es un anión farmacéuticamente aceptable, o X^- y R^2 están ausentes y el compuesto de Formula I es un zwitterión;

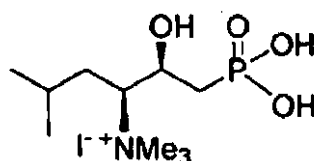
Z se selecciona del grupo que consiste de O y NR^{10} ; y

R^{10} se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alqueno opcionalmente sustituido, alquino opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, y heterociclo opcionalmente sustituido;

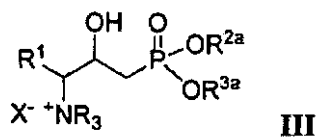
o un hidrato farmacéuticamente aceptable, forma cristalina o forma amarga del mismo, o un estereoisómero o mezcla de estereoisómeros del mismo.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R es metilo.
3. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^1 se selecciona del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, ter-butilo, bencilo, y fenilo.
4. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^1 es isobutilo.
5. El compuesto de la reivindicación 1, en donde Z es O.
6. El compuesto de la reivindicación 5, en donde R^4 es hidrógeno.

7. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^2 y R^3 son hidrógeno.
8. El compuesto de la reivindicación 1, en donde X^- se selecciona del grupo que consiste de hidróxido, cloruro, bromuro, yoduro, sulfato, nitrato, fosfato, formiato, acetato, maleato, fumarato, citrato, oxalato, succinato, tartrato, malato, mandelato, lactato, gluconato, trifluoroacetato, metanosulfonato, besilato y p-toluensulfonato.
9. El compuesto de la reivindicación 2, en donde R^1 se selecciona del grupo que consiste de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, ter-butilo, bencilo, y fenilo, R^2 y R^3 se seleccionan independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, ter-butilo, isopenilo, bencilo, y fenilo, y R^4 y R^{10} son hidrógeno.
10. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto de Formula I está en la forma isomérica 2R,3S.
11. El compuesto de la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es:



12. Un proceso para preparar un compuesto de Formula III:



en donde:

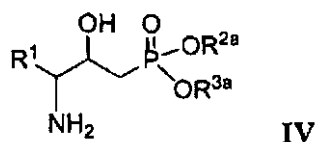
R se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y alquilo inferior;

R¹ se selecciona del grupo que consiste de alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido y heterociclo opcionalmente sustituido;

R^{2a} y R^{3a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste de alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo y arilo opcionalmente sustituido; y

X⁻ es un anión farmacéuticamente aceptable;
dicho método comprende:

(a) la reacción de un compuesto de Formula IV:



con RX, para dar dicho compuesto de Formula III, y

(b) aislar dicho compuesto de Formula III.

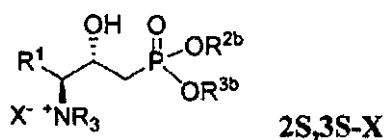
13. El proceso de la reivindicación 12, en donde dicho compuesto de Formula III es el isómero 3S y dicho compuesto de Formula IV es el isómero 3S.

14. El proceso de la reivindicación 13 que comprende además:

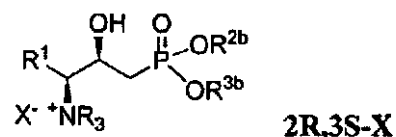
- (c) aislar el isómero 2S,3S sustancialmente libre del isómero 2R,3S,
o
- (d) aislar el isómero 2R,3S sustancialmente libre del isómero 2S,3S.

15. El proceso de la reivindicación 14 que comprende además:

- (e) remover R^{2a} y R^{3a} de dicho isómero 2S,3S, para dar un compuesto de Formula 2S,3S-X:

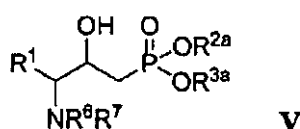


- o, (f) remover R^{2a} y R^{3a} de dicho isómero 2R,3S, para dar un compuesto de Formula 2R,3S-X:



en donde R^{2b} y R^{3b} son seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno y catión monovalente farmacéuticamente aceptable, o tomados juntos R^{2b} y R^{3b} representan un catión divalente farmacéuticamente aceptable, o X^- y R^{2b} están ausentes.

16. El proceso de la reivindicación 12, en donde dicho proceso comprende remover R^6 , o R^6 y R^7 , de un compuesto de Formula V:

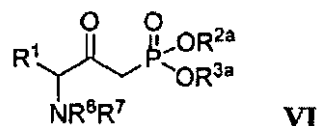


en donde:

R^6 es un grupo protector de amina; y

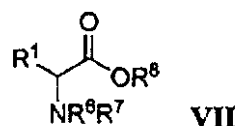
R^7 se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno y grupo protector de amina, o R^6 y R^7 tomados juntos representan un grupo protector de amina, para dar dicho compuesto de Formula IV.

17. El proceso de la reivindicación 16, en donde dicho proceso comprende la reducción de un compuesto de Formula VI:

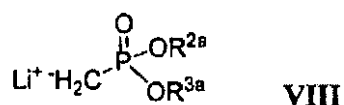


para dar dicho compuesto de Formula V.

18. El proceso de la reivindicación 17, en donde dicho proceso comprende condensar un compuesto de Formula VII:



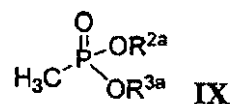
con un compuesto de Formula VIII:



para dar dicho compuesto de Formula VI, en donde:

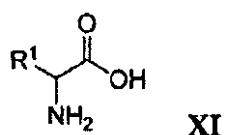
R^8 se selecciona del grupo que consiste de alquilo opcionalmente sustituido, aralquilo, y arilo opcionalmente sustituido.

19. El proceso de la reivindicación 18, en donde dicho proceso comprende condensar un compuesto de Formula IX:



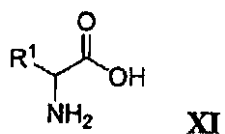
con LiR^9 , para dar dicho compuesto de Formula VIII, en donde R^9 se selecciona del grupo que consiste de alquilo inferior y arilo.

20. El proceso de la reivindicación 18, en donde dicho proceso comprende:
- (a) proteger la amina; y
 - (b) esterificar el ácido carboxílico de un amino ácido de Formula XI:



para dar dicho compuesto de Formula VII.

21. El proceso de la reivindicación 12, en donde dicho compuesto de Formula III se obtiene mediante un proceso de un recipiente único a partir de un compuesto de Formula XI:



22. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de la reivindicación 1 y un vehículo farmacéuticamente aceptable.