

55317

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radiacion : 03112613 00000003 Folios: 32
Fecha (AMB): 2004-03-16 16:26:30
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 444 RESPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: Expediente No. 03 112613

Solicitud de patente PCT fase nacional.

Solicitud internacional No. PCT/EP02/05669

Solicitantes: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT

Yo, GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, vecino de Bogotá D.C., portador de la tarjeta profesional No. 5903, obrando como apoderado en este negocio, manifiesto a usted que doy respuesta al oficio No. 00730 notificado en enero 23 de 2004, sobre la solicitud de patente de la referencia, en los siguientes términos:

- ☐ Acompaño la traducción de las Reivindicaciones, tal como fueron presentadas con la solicitud.
- ☐ Adjunto el documento en el cual consta la cesión del derecho a la patente de los inventores al solicitante, debidamente traducido y legalizado.

En vista de lo anterior, solicito se sirvan continuar con el trámite de esta solicitud.

Señor Superintendente,


GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

C.C. No. 2.878.023 de Bogotá

T.P. No. 5903

mm.

**DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT**

Los suscritos,
(We, the undersigned)

THOMAS BRUMBY
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

ROLF JAUTELAT
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

OLAF PRIEN
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

MARTINA SCHÄFER
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

GERHARD SIEMEISTER
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

ULRICH LÜCKING
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

CHRISTOPH HUWE
con domicilio en Berlin, Alemania
(domiciled in)

declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título
(declare that we are the inventors of the invention titled)

**CDK INHIBITING PYRIMIDINES, PRODUCTION THEREOF AND THEIR USE AS
MEDICAMENTS**

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los
privilegios

(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its
privileges)

y anexidades a favor de
(and attachments, to)

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT
Berlin, Alemania

- 1) *Thy*
- 2) *P. fouda cat*
- 3) *Ok*
- 4) *Gravel 5005*
- 5) *Flud for 6*
- 6) *u. uel*
- 7) *Any This*

Urkundenrolle-Nr. R 544/2003

Ich habe das Mitwirkungsverbot nach § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG erläutert. Meine Frage, ob eine Vorbefassung im Sinne der Vorschrift vorliege, wurde verneint.

Die vor mir geleisteten Unterschriften

des Herrn Dr. Rolf **J a u t e l a t**,
geboren am 8. Dezember 1969,

des Herrn Olaf **P r i e n**,
geboren am 23. Februar 1966,

des Herrn Dr. Gerhard **S i e m e i s t e r**,
geboren am 24. März 1959,

des Herrn Dr. Ulrich **L ü c k i n g**,
geboren am 31. Januar 1970,

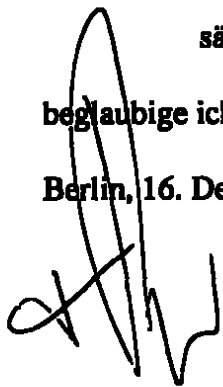
und des Herrn Christoph **H u w e**,
geboren am 24. April 1969,

- alle von Person bekannt -

sämtlichst geschäftsansässig in 13353 Berlin, Müllerstraße 178,

beglaubige ich.

Berlin, 16. Dezember 2003



Notar

Kostenberechnung gem. §§ 141, 154 KostO

Geschäftswert: 12.000,00 €

Beglaubigungsgebühr §§ 32, 45 I

Wegegebühr gem. § 58

Schreibauslagen §§ 136, 152

Postauslagen §§ 137, 152

16 % Mehrwertsteuer

15,00 €

15,00 €

1,50 €

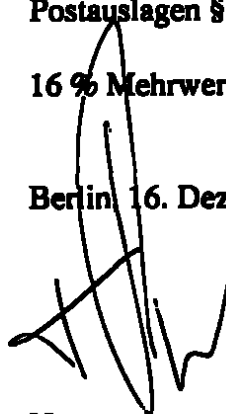
1,44 €

32,94 €

5,27 €

38,21 €

Berlin 16. Dezember 2003



Notar

Urkundenrolle-Nr. R 9/2004

Ich habe das Mitwirkungsverbot nach § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG erläutert. Meine Frage, ob eine Vorbefassung im Sinne der Vorschrift vorliege, wurde verneint.

Die vor mir geleisteten Unterschriften

des Herrn Dr. Thomas **B r u m b y**
geboren am 19. Mai 1956,

der Frau Dr. Martina **S c h ä f e r**,
geboren am 10. Oktober 1965,

- beide von Person bekannt -

beide geschäftsansässig in 13353 Berlin, Müllerstraße 178,

beglaubige ich.

Berlin, 15. Januar 2004

Notar

Kostenberechnung gem. §§ 141, 154 KostO

Geschäftswert: 12.000,00 €

Beglaubigungsgebühr §§ 32, 45 I

Wegegebühr gem. § 58

Schreibauslagen §§ 136, 152

Postauslagen §§ 137, 152

16 % Mehrwertsteuer

15,00 €

15,00 €

2,00 €

1,44 €

33,44 €

5,35 €

38,79 €

Berlin, 15. Januar 2004

Notar

Apostille
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von Dimitri R e m p e n

3. in seiner Eigenschaft als Notar

4. sie ist versehen mit den Siegeln
des Notars

Bestätigt

5. in Berlin

6. am 22. Januar 2004

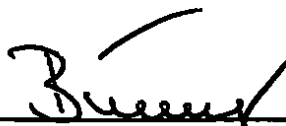
7. durch den Präsidenten des Landgerichts in Berlin

8. unter Nr. 9101 a E - F. 271/2004

9. Siegel

10. Unterschrift

Im Auftrage


(Bünning)

Vorsitzende Richterin am Landgericht



612 / 6
601

TRADUCCION OFICIAL DEL ALEMAN de las autenticaciones de firmas, las notas de gastos y la apostilla adjuntas al documento de cesión suscrito entre los inventores Thomas Brumby, Rolf Jautelat, Olaf Prien, Martina Schäfer, Gerhard Siemeister, Ulrich Lücking y Christoph Huwe y la compañía SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT domiciliada en Berlín, Alemania.

Registro Notarial No. R 544/2003

El Notario confirma que él explicó la prohibición de participación conforme al Artículo 3 inciso 1 numeral 7 de la Ley de Notarización. La pregunta acerca de algún eventual impedimento según dicha disposición fue contestada negativamente.

Autentico las firmas que aparecen anteriormente, ejecutadas en mi presencia por

Señor Dr. Rolf Jautelat,
nacido el 8 de Diciembre de 1969;

Señor Olaf Prien,
nacido el 23 de Febrero de 1966;

Señor Dr. Gerhard Siemeister,
nacido el 24 de Marzo de 1959;

Señor Dr. Ulrich Lücking,
nacido el 31 de Enero de 1970;

y Señor Dr. Christoph Huwe,
nacido el 24 de Abril de 1969;

todos ellos conocidos personalmente por el suscrito Notario y con domicilio comercial en 13353 Berlín, Müllerstraße 178.

Berlín, 16 de Diciembre del 2003

Dimitri Rempen, Notario en Berlín
(Firma y Sello Oficial)

----- (continúa en la 2ª página) -----

Nota de gastos según artículos 141, 154 Disp. Impuestos:

Valor del negocio: 12.000,00 EUROS

Impuesto Artículos 32, 45 I	15,00 EUROS
Impuesto Artículo 58	15,00 EUROS
Impuesto Artículos 136, 152	1,50 EUROS
Impuesto Artículos 137, 152	1,44 EUROS
16% I.V.A.	5,27 EUROS
Total:	38,21 EUROS

Berlín, 16 de Diciembre del 2003

Dimitri Rempen, Notario (firma)

Registro Notarial No. R 9/2004

El Notario confirma que él explicó la prohibición de participación conforme al Artículo 3 inciso 1 numeral 7 de la Ley de Notarización. La pregunta acerca de algún eventual impedimento según dicha disposición fue contestada negativamente.

Autentico las firmas que aparecen anteriormente, las cuales fueron ejecutadas en mi presencia por

Señor Dr. Thomas Brumby,,
nacido el 19 de Mayo de 1956;

Señora Dra. Martina Schäfer,
nacida el 10 de Octubre de 1965;

ambos conocidos personalmente por el suscrito Notario y con domicilio comercial 13353 Berlín, Müllerstraße 178,

Berlín, 15 de Enero del 2004

Dimitri Rempen, Notario en Berlín
(Firma y Sello Oficial)

------(continúa en la 3ª página)-----

614-8
603Nota de gastos según artículos 141, 154 Disp. Impuestos:

Valor del negocio: 12.000,00 EUROS

Impuesto Artículos 32, 45 I	15,00 EUROS
Impuesto Artículo 58	15,00 EUROS
Impuesto Artículos 136, 152	2,00 EUROS
Impuesto Artículos 137, 152	1,44 EUROS
16% I.V.A.	5,35 EUROS
Total:	38,79 EUROS

Berlín, 15 de Enero del 2004

Dimitri Rempen, Notario (firma)

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por: Dimitri Rempen
3. En su calidad de: Notario
4. Y lleva el sello oficial del: Notario

Confirmado

5. En: Berlín
6. El día: 22 de Enero del 2004
7. Por: El Presidente del Tribunal Regional en Berlín
8. Bajo el No.: 9101 a E-F. 271/2004
9. Sello: EL PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN BERLIN
10. Firma: por encargo: Bünning,
Jueza Presidenta en el Tribunal Regional



ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia

RECEIVED
HUNTSVILLE
ALABAMA

Adolf Watzke

CITY OF HUNTSVILLE
ALABAMA
HUNTSVILLE
ALABAMA

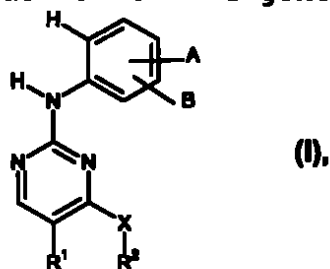
19 SE
HUNTSVILLE
ALABAMA

19

LEGAT
HUNTSVILLE
ALABAMA

REIVINDICACIONES

1-Compuestos de la fórmula general I

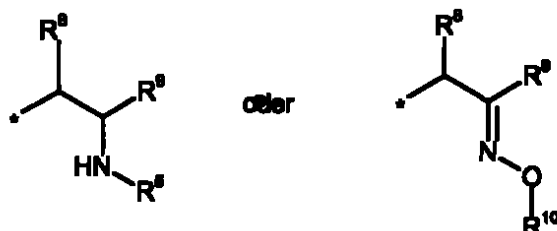


donde

- R^1 es hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 , nitro o es el grupo $-COR^5$, $-OCF_3$, $-(CH_2)_nR^5$, $-S-CF_3$ o $-SO_2CF_3$,
- R^2 es alquilo- C_1-C_{10} , alqueno- C_2-C_{10} , alquino- C_2-C_{10} o cicloalquilo- C_3-C_{10} o es alquilo- C_1-C_{10} , alqueno- C_2-C_{10} , alquino- C_2-C_{10} o cicloalquilo- C_3-C_{10} mono o polisustituido de manera igual o diferente por hidroxilo, halógeno, C_1-C_6 -alcoxi, alquiltio- C_1-C_6 , amino, ciano, alquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- $NH-(CH_2)_n-C_3-C_{10}$, cicloalquilo- C_3-C_{10} , hidroxialquilo- C_1-C_6 , alqueno- C_2-C_6 , alquino- C_2-C_6 , C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , $-NHC_1-C_6$ -alquilo, $-N(C_1-C_6$ -alquilo) $_2$, $-SO(C_1-C_6$ -alquilo), $-SO_2(C_1-C_6$ -alquilo), alcanoilo- C_1-C_6 , $-CONR^3R^4$, $-COR^5$, alquilo C_1-C_6OAc , carboxi, arilo, heteroarilo, $-(CH_2)_n$ -arilo, $-(CH_2)_n$ -heteroarilo, fenil- $(CH_2)_n-R^5$, $-(CH_2)_nPO_3(R^5)_2$ o por el grupo $-R^6$ o $-NR^3R^4$ y el propio fenilo, cicloalquilo- C_3-C_{10} , arilo, heteroarilo, $-(CH_2)_n$ -arilo y $-(CH_2)_n$ -heteroarilo puede estar opcionalmente mono o polisustituido de manera igual o di-

ferente por halógeno, hidroxí, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, heteroarilo, benzoxi o por el grupo -CF₃ o -OCF₃, y el anillo del cicloalquilo-C₃-C₁₀ y el alquilo-C₁-C₁₀ puede estar interrumpido opcionalmente por uno o varios átomos de nitrógeno, oxígeno y/o de azufre y/o por uno o varios grupos =C=O y/o opcionalmente el anillo puede contener una o varias uniones dobles, o

R² es el grupo



X es oxígeno o es el grupo -NH-, -N(C₁-C₃-alquilo) o es -OC₃-C₁₀ -cicloalquilo, el que puede estar mono o polisustituido, de manera igual o diferente por un heteroaromáticos

o

X y R² forman juntos un anillo cicloalquilo-C₃-C₁₀, que opcionalmente puede contener uno o varios heteroátomos y opcionalmente puede estar mono o polisustituido por hidroxí, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o halógeno,

A y B son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, hidroxí, alquilo-C₁-C₃, C₁-C₆-alcoxi o son el grupo -SR⁷, -S(O)R⁷, -SO₂R⁷, -NHSO₂R⁷, -CH(OH)R⁷, -CR⁷(OH)-R⁷,

618 12
607 201

A y B forman juntos un anillo cicloalquilo-C₃-C₁₀ que puede estar interrumpido en el anillo opcionalmente por uno o varios átomos de nitrógeno, oxígeno y/o de azufre y/o por uno o varios grupos =C=O o =SO₂ y/o puede contener una o varias uniones dobles en el anillo y el anillo cicloalquilo-C₃-C₁₀ puede estar opcionalmente mono o polisustituido, de manera igual o diferente por hidroxilo, halógeno, alcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, amino, ciano, alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, cicloalquilo-C₃-C₁₀, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, -NHC₁-C₆-alquilo, -N(C₁-C₆-alquilo)₂, -SO(C₁-C₆-alquilo), -SO₂R⁷, alcanóilo-C₁-C₆, -CONR³R⁴, -COR⁵, alquilo-C₁-C₆OAc, fenilo, o por el grupo R⁶, donde el propio fenilo puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, hidroxilo, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, o por el grupo -CF₃ o -OCF₃

R³ y R⁴ son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, fenilo, benciloxi, alquilo-C₁-C₁₂, alcoxi-C₁-C₆, alqueniloxi-C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hidroxilo, hidroxilo-C₁-C₆-alquilo, dihidroxilo-C₁-C₆-alquilo, heteroarilo, heterociclo-C₃-C₁₀-alquilo, heteroaril-C₁-C₃-alquilo, opcionalmente por C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₃-alquilo sustituido por ciano, o son alquilo-C₁-C₆ opcionalmente mono o polisustituido de manera igual o diferente por fenilo, piridilo, feniloxi, cicloalqui-

lo-C₃-C₆, alquilo-C₁-C₆ o C₁-C₆-alcoxi, donde el propio fenilo puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o por el grupo -SO₂NR³R⁴, o son el grupo - (CH₂)_nNR³R⁴, -CNHNH₂ o - NR³R⁴

o

R³ y R⁴ forman juntos un anillo cicloalquilo-C₃-C₁₀ que puede estar interrumpido en el anillo opcionalmente por uno o varios átomos de nitrógeno, oxígeno y/o azufre y/o por uno o varios grupos =C=O y/o puede contener en el anillo opcionalmente una o varias uniones dobles,

R⁵ es hidroxil, fenilo, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, benzoxil, alquiltio-C₁-C₆ o alcoxi-C₁-C₆,

R⁶ es un anillo heteroarilo o cicloalquilo-C₃-C₁₀, donde el anillo tiene el significado indicado anteriormente,

R⁷ es halógeno, hidroxil, fenilo, alquilo-C₁-C₆, alqueni-
lo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, cicloalquilo-C₃-C₁₀ con el
significado indicado más arriba, o es el grupo -NR³R⁴,
o es alquilo-C₁-C₁₀, alqueni-
lo-C₂-C₁₀, alquinilo-C₂-C₁₀ o
cicloalquilo-C₃-C₁₀ mono o polisustituido de manera
igual o diferente por hidroxil, alcoxi-C₁-C₆, halógeno,
fenilo, -NR³R⁴ o fenilo, que a su vez puede estar mono
o polisustituido de manera igual o diferente por haló-
geno, hidroxil, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, halo-

alquilo-C₁-C₆, halo-alcoxi-C₁-C₆, o es fenilo, el que a su vez puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, hidroxilo, alquilo-C₁-C₆ o alcoxi-C₁-C₆, halo-alquilo-C₁-C₆, halo-alcoxi-C₁-C₆, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, hidroxilo, alquilo-C₁-C₁₀, alqueno-C₂-C₁₀, C₂-C₁₀-alquino, cicloalquilo-C₃-C₁₀, arilo, heteroarilo o son alquilo-C₁-C₁₀, alqueno-C₂-C₁₀, alquino-C₂-C₁₀ o cicloalquilo-C₃-C₁₀ mono o polisustituido de manera igual o diferente por hidroxilo, halógeno, alcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, amino, ciano, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo, -NH-(CH₂)_n-C₃-C₁₀, cicloalquilo-C₃-C₁₀, hidroxialquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, alquino-C₂-C₆, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo, -NHC₁-C₆-alquilo, -N(C₁-C₆-alquil)₂, -SO(C₁-C₆-alquilo), -SO₂(C₁-C₆-alquilo), alcanoílo-C₁-C₆, -CONR³R⁴, -COR⁵, alquilo-C₁-C₆OAc, carboxi, arilo, heteroarilo, -(CH₂)_n-arilo, -(CH₂)_n-heteroarilo, fenil-(CH₂)_n-R⁵, -(CH₂)_nPO₃(R⁵)₂ o por el grupo -R⁶ o -NR³R⁴ y el propio fenilo, cicloalquilo-C₃-C₁₀, arilo, heteroarilo, -(CH₂)_n-arilo y -(CH₂)_n-heteroarilo puede estar opcionalmente mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, hidroxilo, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, o por el grupo -CF₃ o -OCF₃, y el anillo del cicloalquilo-C₃-C₁₀ y el alquilo-C₁-C₁₀ puede estar

interrumpido opcionalmente en el anillo por uno o varios átomos de nitrógeno, oxígeno y/o azufre y/o por uno o varios grupos $=C=O$ y/o el anillo puede contener una o varias uniones dobles, y

n es 0 - 6,

y sus isómeros, diasterómeros, enantiómeros y sales

2. Compuestos de la fórmula general I, de acuerdo con la reivindicación 1,

donde

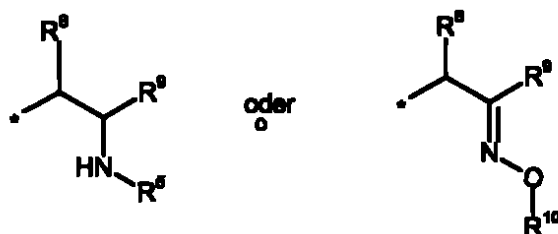
R^1 es hidrógeno, halógeno, alquilo- C_1-C_6 , nitro o es el grupo $-COR^5$, $-OCF_3$, $-(CH_2)_nR^5$, $-S-CF_3$ o $-SO_2CF_3$,

R^2 es alquilo- C_1-C_{10} , alquenilo- C_2-C_{10} , alquinilo- C_2-C_{10} o cicloalquilo- C_3-C_{10} o es alquilo- C_1-C_{10} , alquenilo- C_2-C_{10} , alquinilo- C_2-C_{10} o cicloalquilo- C_3-C_{10} mono o polisustituido de manera igual o diferente por hidroxilo, halógeno, alcoxi- C_1-C_6 , alquiltio- C_1-C_6 , amino, ciano, alquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- $NH-(CH_2)_n-C_3-C_{10}$, cicloalquilo- C_3-C_{10} , hidroxialquilo- C_1-C_6 , alquenilo- C_2-C_6 , alquinilo- C_2-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , $-NHC_1-C_6$ -alquilo, $-N(C_1-C_6$ -alquil) $_2$, $-SO(C_1-C_6$ -alquilo), $-SO_2(C_1-C_6$ -alquilo), alcanóilo- C_1-C_6 , $-CONR^3R^4$, $-COR^5$, alquilo- C_1-C_6OAc , carboxi, arilo, heteroarilo, $-(CH_2)_n$ -arilo, $-(CH_2)_n$ -heteroarilo, fenil- $(CH_2)_n-R^5$, $-(CH_2)_nPO_3(R^5)_2$ o por el grupo $-R^6$ o $-NR^3R^4$ y el propio fenilo, cicloalquilo- C_3 -

C₁₀, arilo, heteroarilo, -(CH₂)_n-arilo y -(CH₂)_n-heteroarilo opcionalmente puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, hidroxí, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, heteroarilo, benzoxi o por el grupo -CF₃ o -OCF₃ y el anillo del cicloalquilo-C₃-C₁₀ y el alquilo-C₁-C₁₀ puede estar interrumpido en el anillo opcionalmente por uno o varios átomos de nitrógeno-, oxígeno- y/o azufre y/o por uno o varios grupos =C=O y/o pueden estar contenidas opcionalmente una o varias uniones dobles en el anillo,

o

R² es el grupo



X es oxígeno o el grupo -NH-, -N(C₁-C₃-alquilo) o es -OC₃-C₁₀-cicloalquilo, el que puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por un heteroaromático,

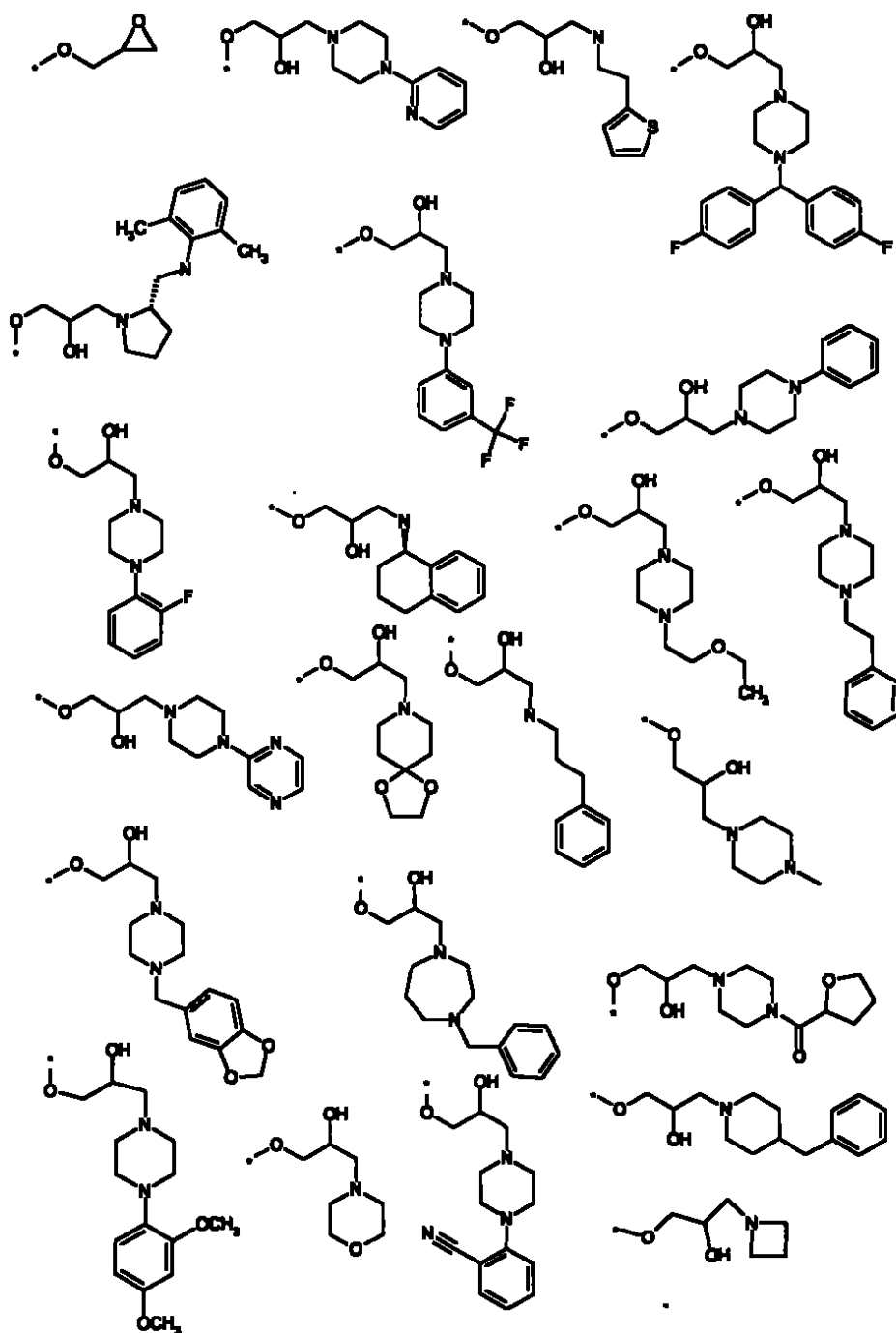
o

X y R² forman juntos un anillo cicloalquilo-C₃-C₁₀, que opcionalmente puede contener uno o varios heteroátomos y puede estar mono o polisustituido opcionalmente por

~~625~~ 17
~~206~~
612

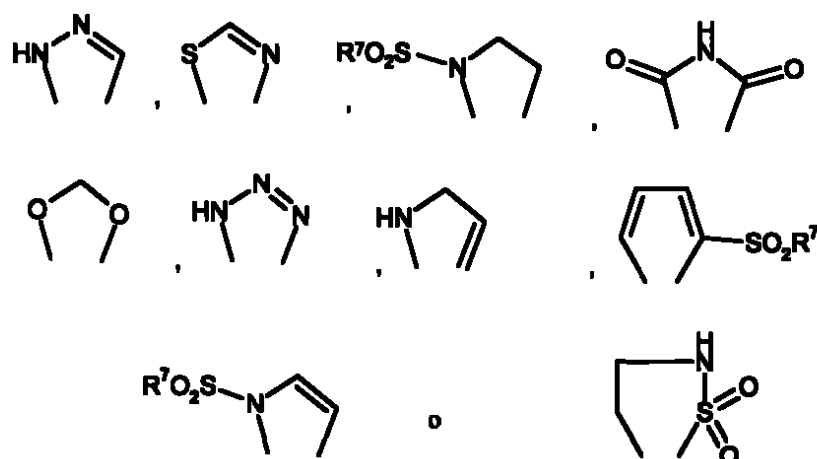
hidroxi, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o halógeno,

A y B son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, hidroxi, alquilo-C₁-C₃, alcoxi-C₁-C₆ o son el grupo
-S-CH₃, SO₂-C₂H₄-OH, -CO-CH₃, -S-CHF₂, -S-
(CH₂)_nCH(OH)CH₂N-R³R⁴, CH₂P(O)OR³OR⁴, S-CF₃, SO-CH₃,
SO₂CF₃, SO₂-(CH₂)_n-N-R³R⁴, SO₂-NR³R⁴, SO₂R⁷, CH-(OH)-CH₃ o
son



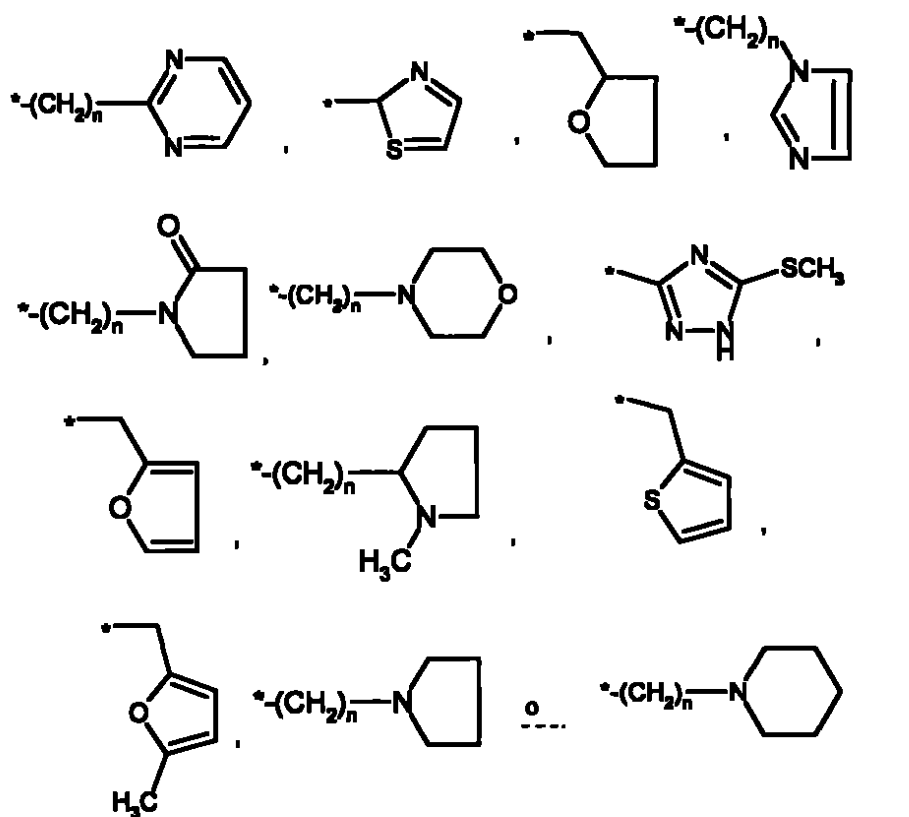
o

A y B pueden formar juntos un grupo



R^3 y R^4 son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, fenilo, benciloxi, alquilo- C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 , alqueniloxi- C_2-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , hidroxilo, hidroxilo- C_1-C_6 -alquilo, dihidroxilo- C_1-C_6 -alquilo, heteroarilo, heterociclo- C_3-C_{10} -alquilo, heteroaril- C_1-C_3 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquil- C_1-C_3 -alquilo opcionalmente sustituido por ciano, o son alquilo C_1-C_6 opcionalmente mono o polisustituido de manera igual o diferente por fenilo, piridilo, feniloxi, cicloalquilo- C_3-C_6 , alquilo- C_1-C_6 o alcoxi- C_1-C_6 , donde el propio fenilo puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, trifluorometilo, alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 o por el grupo $-SO_2NR^3R^4$, o son el grupo $-(CH_2)_nNR^3R^4$, $-CNHNH_2$ o $-NR^3R^4$ o son

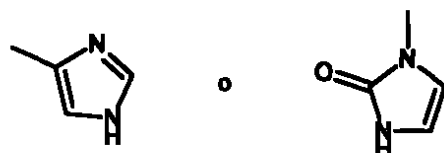
~~626~~ 20
615 309



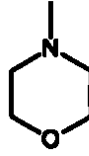
que opcionalmente pueden estar sustituidos por alquilo- C_1-C_6 ,

R^5 es hidroxilo, fenilo, alquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- C_3-C_6 , benzoxi, alquiltio- C_1-C_6 o alcoxi- C_1-C_6 ,

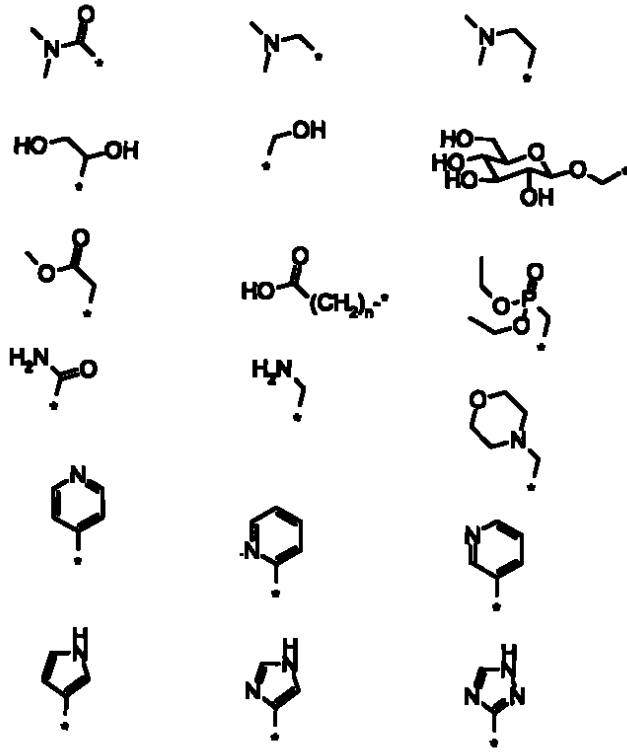
R^6 es el grupo



R^7 es halógeno, hidroxilo, fenilo, alquilo- C_1-C_6 , $-C_2H_4OH$, $-NR^3R^4$, o el grupo



R^8 , R^9 y R^{10} son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, hidroxilo, alquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- C_3-C_6 o son el grupo



y
n es 0 - 6 y sus isómeros, enantiómeros, diasterómeros y sales.

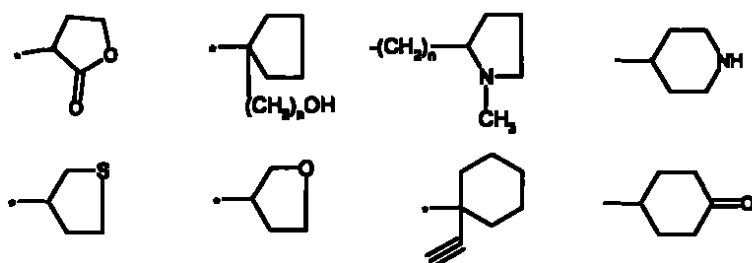
3. Compuestos de la fórmula general I, de acuerdo con las reivindicaciones 1 y 2, donde

625 22
617 24

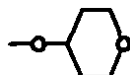
R^1 es hidrógeno, halógeno, C_1 - C_3 -alquilo o es el grupo $-(CH_2)_nR^5$,

R^2 es $-CH(CH_3)-(CH_2)_nR^5$, $-CH-(CH_2OH)_2$, $-(CH_2)_nR^7$, $-CH(C_3H_7)-(CH_2)_nR^5$, $-CH(C_2H_5)-(CH_2)_nR^5$, $-CH_2-CN$, $-CH(CH_3)COCH_3$, $-CH(CH_3)-C(OH)(CH_3)_2$, $-CH(CH(OH)CH_3)OCH_3$, $-CH(C_2H_5)CO-R^5$, alquilnilo- C_2-C_4 , $-(CH_2)_n-COR^5$, $-(CH_2)_n-CO-C_1-C_6$ -alquilo, $-(CH_2)_n-C(OH)(CH_3)$ -fenilo, $-CH(CH_3)-C(CH_3)-R^5$, $-CH(CH_3)-C(CH_3)(C_2H_5)-R^5$, $-CH(OCH_3)-CH_2-R^5$, $-CH_2-CH(OH)-R^5$, $-CH(OCH_3)-CHR^5-CH_3$, $-CH(CH_3)-CH(OH)-CH_2-CH=CH_2$, $-CH(C_2H_5)-CH(OH)-(CH_2)_n-CH_3$, $-CH(CH_3)-CH(OH)-(CH_2)_n-CH_3$, $-CH(CH_3)-CH(OH)-CH(CH_3)_2$, $(CH_2OAC)_2$, $-(CH_2)_n-R^6$, $-(CH_2)_n-(CF_2)_n-CF_3$, $-CH(CH_2)_n-R^5)_2$, $-CH(CH_3)-CO-NH_2$, $-CH(CH_2OH)$ -fenilo, $-CH(CH_2OH)-CH(OH)-(CH_2)_nR^5$, $-CH(CH_2OH)-CH(OH)$ -fenilo, $-CH(CH_2OH)-C_2H_4-R^5$, $-(CH_2)_n-C\equiv C-C(CH_3)=CH-COR^5$, $-CH(Ph)-(CH_2)_n-R^5$, $-(CH_2)_n-COR^5$, $-(CH_2)_nPO_3(R^5)_2$, $-(CH_2)_n-COR^5$, $-CH((CH_2)_nOR^5)CO-R^5$, $-(CH_2)_nCONHCH((CH_2)_nR^5)_2$, $-(CH_2)_nNH-COR^5$, $-CH(CH_2)_nR^5-(CH_2)_nC_3-C_{10}$ -cicloalquilo, $-(CH_2)_nC_3-C_{10}$ -cicloalquilo, cicloalquilo- C_3-C_{10} , o alquilo- C_1-C_6 , cicloalquilo- C_3-C_{10} , $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_n-R^5$, $-(CH_2)_n-NR^3R^4$, $-CH(C_3H_7)-(CH_2)_n-OC(O)-(CH_2)_n-CH_3$, $-(CH_2)_n-R^5$, $-C(CH_3)_2-(CH_2)_n-R^5$, $-C(CH_2)_n(CH_3)-(CH_2)_nR^5$, $-C(CH_2)_n-(CH_2)_nR^5$, $-CH(t-butyl)-(CH_2)_n-R^5$, $-CCH_3(C_3H_7)-(CH_2)_nR^5$, $-CH(C_3H_7)-(CH_2)_n-R^5$, $-CH(C_3H_7)-COR^5$, $-CH(C_3H_7)-(CH_2)_n-OC(O)-NH-Ph$, $-CH((CH_2)_n(C_3H_7))-(CH_2)_nR^5$, $-CH(C_3H_7)-(CH_2)_n-OC(O)-NH-$

~~630~~ ~~24~~
213
619

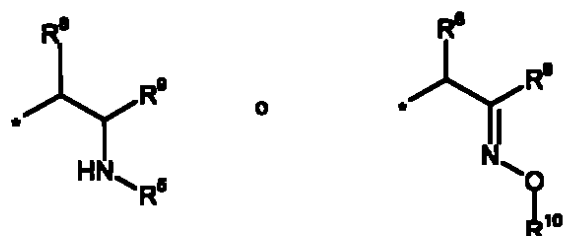


X es oxígeno o es el grupo -NH-, -N(C₁-C₃-alquil) o



o

R² es el grupo

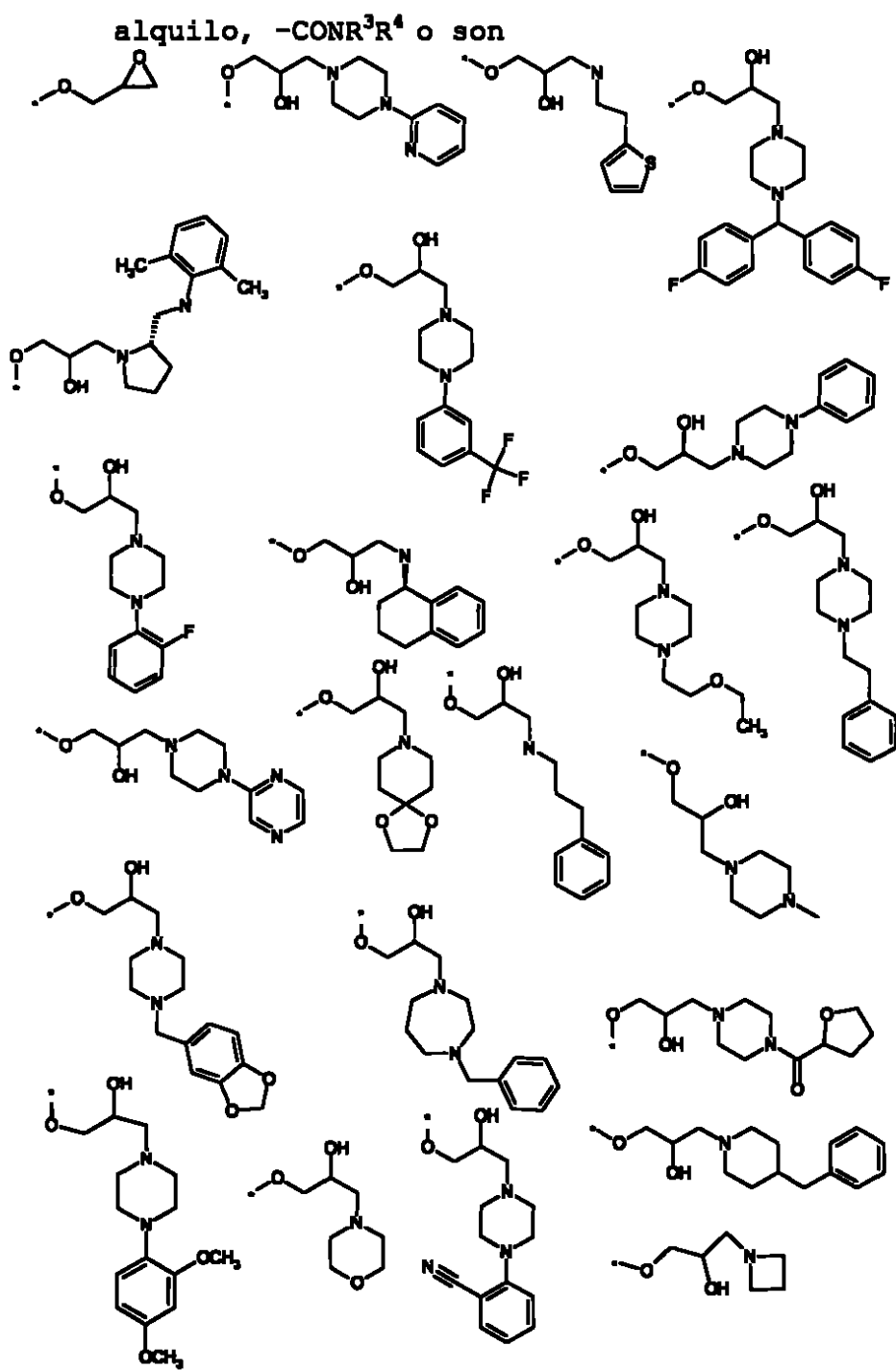


o

X y R² forman juntos un grupo

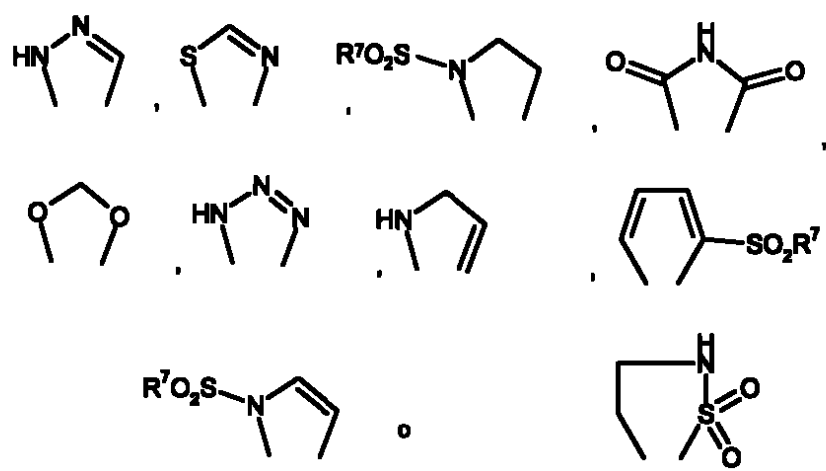


A y B son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, hidroxilo, alquilo-C₁-C₃, alcoxi-C₁-C₆ o son el grupo -S-CH₃, -SO₂-C₂H₄-OH, -CO-CH₃, -S-CHF₂, -S-(CH₂)_nCH(OH)CH₂N-R³R⁴, -CH₂PO(OC₂H₅)₂, -S-CF₃, -SO-CH₃, -SO₂CF₃, -SO₂-(CH₂)_n-n-R³R⁴, -SO₂-NR³R⁴, -SO₂R⁷, -CH(OH)-CH₃, -COOH, -CH((CH₂)_nR⁵)₂, -(CH₂)_nR⁵, -COO-C₁-C₆-

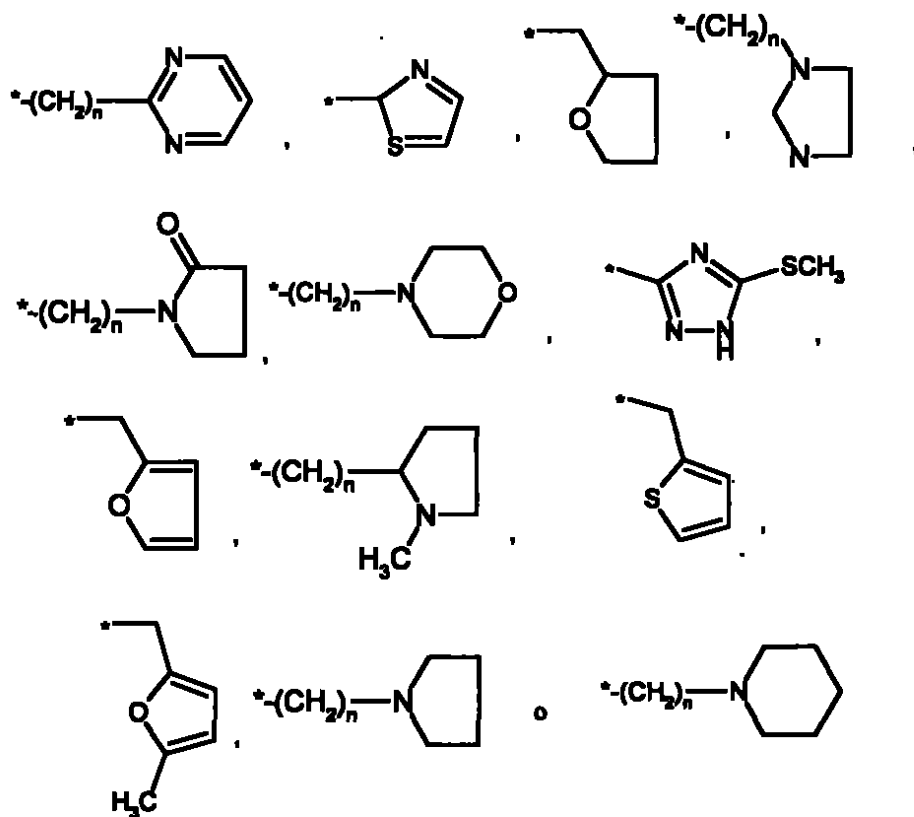


o

A y B pueden formar juntos un grupo



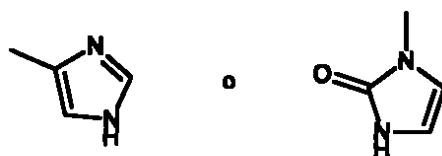
R^3 y R^4 son, en cada caso independientemente entre sí hidrógeno, fenilo, benciloxi, alquilo- C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 , alqueniloxi- C_2-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , hidroxilo, hidroxilo- C_1-C_6 -alquilo, dihidroxilo- C_1-C_6 -alquilo, heteroarilo, heterociclo- C_3-C_{10} -alquilo, heteroaril- C_1-C_3 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquil- C_1-C_3 -alquilo opcionalmente sustituido por ciano, o son alquilo- C_1-C_6 opcionalmente mono o polisustituido de manera igual o diferente por fenilo, piridilo, feniloxi, cicloalquilo- C_3-C_6 , alquilo- C_1-C_6 o alcoxi- C_1-C_6 , donde el propio fenilo puede estar mono o polisustituido de manera igual o diferente por halógeno, trifluorometilo, alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 o por el grupo $-SO_2NR^3R^4$, o son el grupo $-(CH_2)_nNR^3R^4$, $-CNHNH_2$ o $-NR^3R^4$ o son



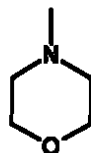
los que opcionalmente pueden estar sustituidos por alquilo- C_1-C_6 ,

R^5 es hidroxilo, fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , benzoxi, alquiltio C_1-C_6 o alcoxi- C_1-C_6 ,

R^6 es el grupo



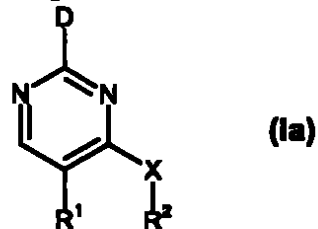
R^7 es halógeno, hidroxilo, fenilo, alquilo- C_1-C_6 , $-(CH_2)_nOH$, $-NR^3R^4$ o el grupo



~~633~~ ~~23~~
~~211~~
623

R^8 , R^9 y R^{10} son hidrógeno, hidroxilo, alquilo- C_1-C_6 o son el grupo $-(CH_2)_n-COOH$, y n es 0 - 6 y sus isómeros, diastereoisómeros, enantiómeros y sales.

4. Uso de los compuestos de la fórmula general Ia



donde

D es halógeno y X, R^1 , y R^2 tienen los significados indicados en la fórmula general (I), como productos intermedios para la obtención de los compuestos de la fórmula general I.

5. Uso de los compuestos de la fórmula general Ia, de acuerdo con la reivindicación 4, donde D es cloro y X, R^1 y R^2 tienen los significados indicados en la fórmula general.

6. Productos farmacéuticos que comprenden un compuesto de la fórmula general I

donde

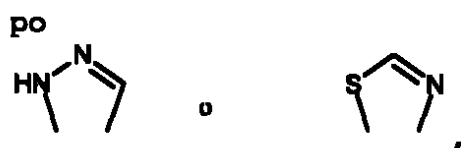
R^1 es halógeno o alquilo- C_1-C_3

X es oxígeno o $-NH$,

A es hidrógeno

B es hidroxilo, $-CO$ -alquilo- R^7 , $-S-CHF_2$, $-S(CH_2)_nCH(OH)CH_2N-R^3R^4$, $-S-CF_3$, o $-CH(OH)-CH_3$, o

A y B pueden formar independientemente entre sí, un gru-



R^2 , R^3 , R^4 , R^7 y R^8 tienen los significados indicados en la fórmula general I, y sus isómeros, diasterómeros, enantiómeros y sales.

7. Uso de los compuestos de la fórmula general I, de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de cáncer, enfermedades autoinmunes, alopecia inducida por quimioterapéuticos y mucositis, enfermedades cardiovasculares, enfermedades infecciosas, enfermedades nefrológicas, enfermedades neurodegenerativas crónicas y agudas e infecciones virales.

8. Uso de acuerdo con la reivindicación 7, CARACTERIZADO PORQUE, se entiende por cáncer, tumores sólidos y leucemia, por enfermedades autoinmunes, psoriasis, alopecia y esclerosis múltiple, por enfermedades cardiovasculares, estenosis, arterioesclerosis y restenosis, por enfermedades infecciosas, las enfermedades producidas por parásitos unicelulares, por enfermedades nefrológicas, glomerulonefritis, por enfermedades neurodegenerativas crónicas, la enfermedad de Huntington, esclerosis lateral amiotrófica, mal de Parkinson, demencia por SIDA y enfermedad de Alzheimer, por enfermedades neurodegenerativas agudas, isquemias cerebrales y neurotraumatismos, y por infecciones virales, infecciones

625 30
219
625

con citomegalus, herpes, hepatitis B o C, y enfermedades HIV.

9. Medicamentos que contienen por lo menos un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3.

10. Medicamento de acuerdo con la reivindicación 9 para el tratamiento de cáncer, enfermedades autoinmunes, alopecia inducida por quimioterapéuticos y mucositis, enfermedades cardiovasculares, enfermedades infecciosas, enfermedades nefrológicas, enfermedades neurodegenerativas crónicas y agudas e infecciones virales.

11. Compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 y medicamentos de acuerdo con las reivindicaciones 6 a 7 con sustancias de formulación y vehículos apropiados.

12. Uso de los compuestos de la fórmula general I y de los productos farmacéuticos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 y 6, como inhibidores de quinasa dependiente de ciclina.

13. Uso de acuerdo con la reivindicación 12, CARACTERIZADO PORQUE la quinasa es CDK1, cDK2, cDK3, cDK4, cDK5, cDK6, cDK7, cDK8 o CDK9.

14. Uso de los compuestos de la fórmula general I y de los productos farmacéuticos de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 y 6 como inhibidores de la quinasa de glicogen-sintasa (GSK-3 β).

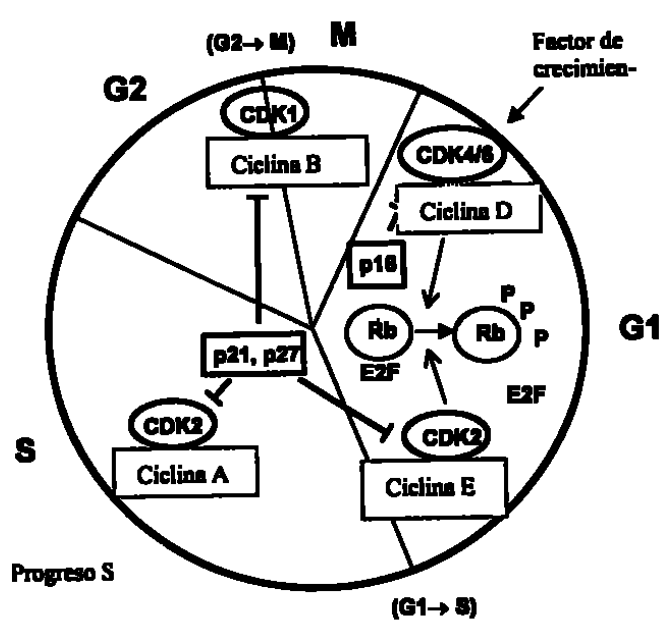
15. Uso de los compuestos de la fórmula general I, de

~~636~~ ~~21~~
~~626~~ ~~220~~

acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, en forma de un preparado farmacéutico para aplicación enteral, parenteral u oral.

16. Uso del producto de acuerdo con la reivindicación 6 en forma de un preparado para aplicación enteral, parenteral u oral.

Fig 1



2020
Bogotá D C

Doctor(a)
GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO.
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación N°	03-112613
	Solicitud internacional	PCT/EP02/05669.
	Fecha límite fase nacional	29/12/2003
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio N°	295
	Folios	001

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

Cúmplase
Dado en Bogotá D C, 23 MAYO 2005


DORIS ELENA POLO CORDOBA
Jefe División de Nuevas Creaciones (E).