

175
n 2001

Señora

Alix Carmenza Céspedes de Vergel

Jefe de División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-078810- -00003-0000

Fee: 2006-12-15 17:07:52 Dep. 2020 NUECREACIONES

Tra. 11 PATENTE/II

Eve: 378 FASENACIONAL

Act 444 RESPUESTAREQUE

Folios: 32

Referencia: Expediente No. 06.078.810

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Intermediarios de quinolina como inhibidores de receptores de tirosina quinasas y la síntesis de los mismos"

Solicitante: Wyeth

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FLIACIÓN EN LISTA No. 372**DEL 27 DE OCTUBRE DE 2006, OFICIO No. 12385 (EXAMEN DE FORMA)**

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término legal:

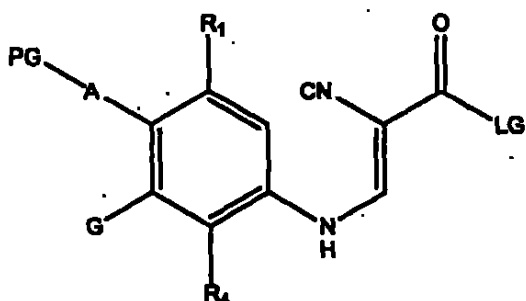
Solicita su Despacho aclarar el número de reivindicaciones presentadas en la solicitud por cuanto difieren de las presentadas en la fase internacional. Como respuesta a su solicitud presento nuevo capítulo reivindicatorio el cual contiene las mismas 25 reivindicaciones presentadas en la solicitud internacional. De hecho el capítulo reivindicatorio presentado también contenía 25 reivindicaciones pero se presentó un error en las últimas reivindicaciones que aparecían como 23 y 24 siendo en realidad 24 y 25. En el nuevo capítulo reivindicatorio se corrige dicho error.

Atentamente,


ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281Anexos: Formulario de modificación
Recibo

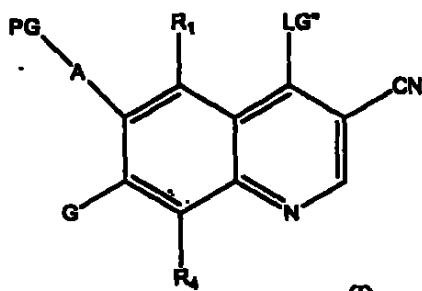
REIVINDICACIONES:

1. Un método de preparación de un compuesto quinolina 4-sustituida **CARACTERIZADO PORQUE** comprende el paso de hacer reaccionar un compuesto de la siguiente fórmula (II):



(II)

con un reactivo de fórmula POLG'_3 , donde LG' es halo, para proveer un compuesto de la siguiente fórmula (I):



(I)

donde;

LG es un grupo saliente seleccionado del grupo formado por morfolino, o-mesilo, o-tosilo, triflato;

LG'' es un grupo saliente seleccionado del grupo formado por morfolino, o-mesilo, o-tosilo, triflato y halógeno;

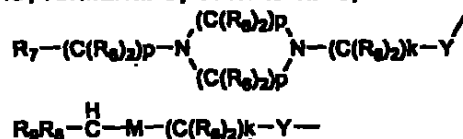
PG es un grupo protector seleccionado del grupo formado por acilo, $\text{CH}_3\text{OC}(\text{O})-$, $\text{EtOC}(\text{O})-$, Fmoc, trifluoroacetamida, Troc, Fenoc, benzamida,

Teoc, ftalimida, maleimida y 2,5-dimetilpirrol;

A es O, NR o S;

R es H, alquilo, alquenilo o alquinilo; y

G, R₁ y R₄ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2-6 átomos de carbono, alquiniloxi de 2-6 átomos de carbono, hidroximetilo, halometilo, alcanoliloxi de 1-6 átomos de carbono, alquenoliloxi de 3-8 átomos de carbono, alquinoliloxi de 3-8 átomos de carbono, alcanoliloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquenoliloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alquinoliloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonamida de 1-6 átomos de carbono, alquenilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, alquinilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano, nitro, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, ftalimida, fenilo, tofenoxi, bencilo, amino, hidroxiamino, alcoxi-amino de 1-4 átomos de carbono, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, N-alquilcarbamolilo, N,N-dialquilcarbamolilo, N-alquil-N-alquenilamino de 4 a 12 átomos de carbono, N,N-dialquenilamino de 6-12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino,



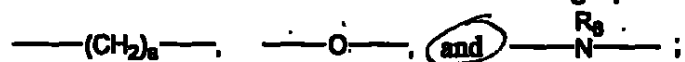
000096
~~00004~~
 178

$R_7-(C(R_8)_2)_r-Y-$, $R_7-(C(R_8)_2)_p-M-(C(R_8)_2)_k-Y-$ o $Het-(C(R_8)_2)_q-W-(C(R_8)_2)_z-Y-$;

o R_1 y R_4 son como se definieron precedentemente y G es R_2-NH- ;

o si cualquiera de los sustituyentes R_1 , R_4 o G están ubicados sobre átomos de carbono contiguos entonces se pueden tomar juntos como el radical divalente $-O-C(R_8)_2-O-$;

Y es un radical divalente seleccionado del grupo formado por

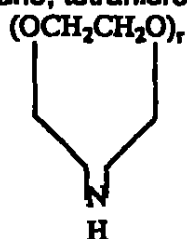


R_7 es $-NR_8R_8$, $-OR_8$, $-J$, $-N(R_8)_3^+$, o $-NR_8(OR_8)$;

M es $>NR_8$, $-O-$, $>N-(C(R_8)_2)_pNR_8R_8$, o $>N-(C(R_8)_2)_p-OR_8$;

W es $>NR_8$, $-O-$ o es un enlace;

Het se selecciona del grupo formado por morfolino, tiomorfolino, S-óxido de tiomorfolino, S,S-dióxido de tiomorfolino, piperidina, pirrolidina, aziridina, piridina, imidazol, 1,2,3-triazol, 1,2,4-triazol, tiazol, tiazolidina, tetrazol, piperazina, furano, tiofeno, tetrahidrotiofeno, tetrahidrofurano, dioxano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano, y



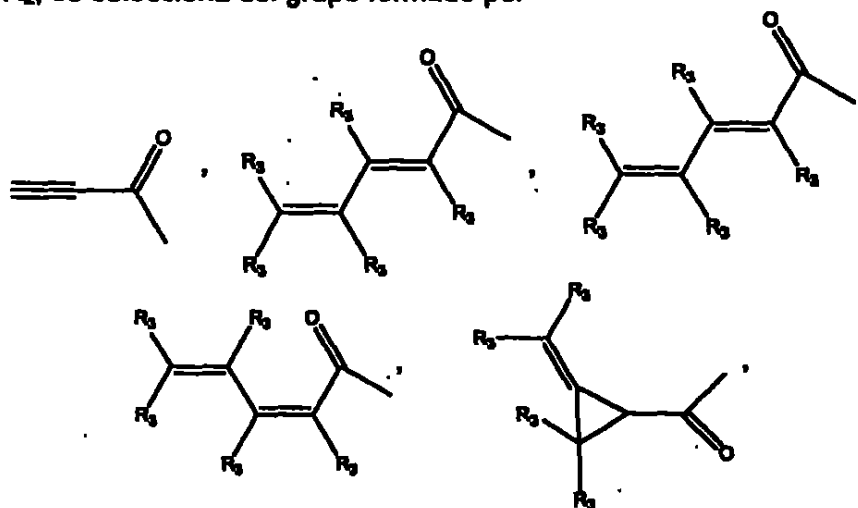
donde Het está opcionalmente mono- o di-sustituido en el carbono o nitrógeno con R_8 , opcionalmente mono- o di-sustituido en el carbono con hidroxilo, $-N(R_8)_2$, o $-OR_8$, opcionalmente mono o di-sustituido en el carbono con los radicales monovalentes

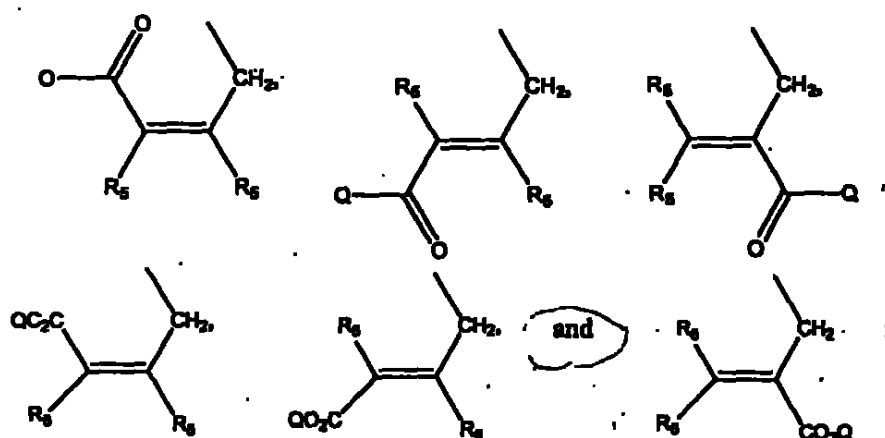
$-(C(R_8)_2)_s$, OR_8 o $-(C(R_8)_2)_s$, $N(R_8)_2$, y opcionalmente mono o di-sustituido en un carbono saturado con los radicales divalentes $-O-$ o $-$



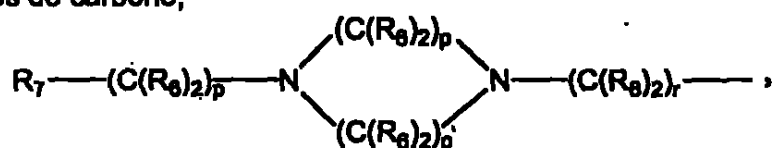
R_6 es hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alqueno de 2-6 átomos de carbono, alquino de 2-6 átomos de carbono, cicloalquilo de 1-6 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, carboxialquilo (2-7 átomos de carbono), fenilo o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más halógenos, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, trifluorometilo, amino, alquilamino de 1-3 átomos de carbono, dialquilamino de 2-6 átomos de carbono, nitró, ciano, azida, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanofloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, hidroxi, carboxilo, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzilo, bencilo, fenilamino, bencilamino, alcanoflamino de 1-6 átomos de carbono o alquilo de 1-6 átomos de carbono; con la condición que el grupo alqueno o alquino está unido a un átomo de nitrógeno u oxígeno a través de un átomo de carbono saturado;

R_2 , se selecciona del grupo formado por

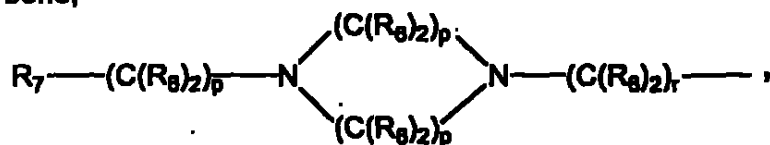




R_3 es independientemente hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, carboxi, carboalcoxi de 1-6 átomos de carbono, fenilo, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono,



R_5 es independientemente hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, carboxi, carboalcoxi de 1-6 átomos de carbono, fenilcarboalquilo de 2-7 átomos de carbono,



nnnnng

182



R_8 , y R_9 son cada uno, independientemente $-(\text{C}(\text{R}_8)_2)_r\text{NR}_8\text{R}_9$, o $-(\text{C}(\text{R}_8)_2)_r\text{OR}_8$;

J es independientemente hidrógeno, cloro, flúor o bromo;

Q es un alquilo de 1-6 átomos de carbono o hidrógeno;

a = 0 ó 1;

g = 1-6;

k = 0-4;

n es 0-1;

m es 0-3;

p = 2-4;

q = 0-4;

r = 1-4;

s = 1-6;

u = 0-4 y v = 0-4, donde la suma de u+v es 2-4;

x = 0-3;

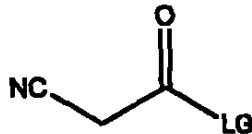
y = 0-1;

z = 0-3;

o una sal del mismo.

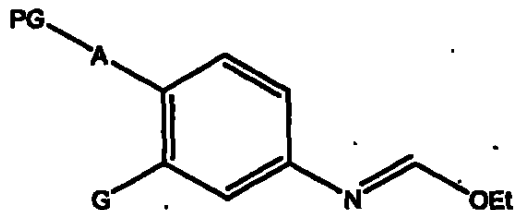
2. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE LG' es cloro.
3. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE además comprende el paso de sustituir el grupo LG'' en un compuesto de fórmula (I) con un nucleófilo.
4. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE además comprende el paso de formar el compuesto de fórmula (II) por condensación

de un compuesto metileno activo de fórmula (IV):



(IV)

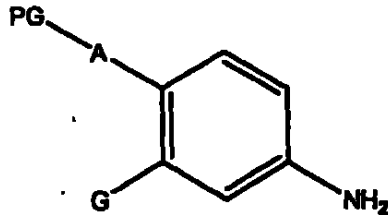
con un compuesto arilformimidato de fórmula (III):



(III)

, donde LG, PG, A y G son como se definieron previamente.

5. El método de la cláusula 4, CARACTERIZADO PORQUE LG es morfolino, PG es acilo, A es amino y G es etoxi.
6. El método de la cláusula 4, CARACTERIZADO PORQUE además comprende el paso de formar el arilformimidato por reacción de una arilamina de fórmula (V):



(V)

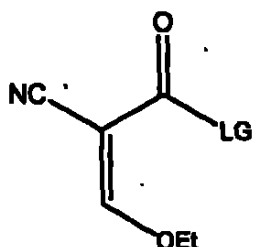
con ortoformiato, donde PG, A y G son como se definieron previamente.

7. El método de la cláusula 6, donde el compuesto arilamina es N-(4-

amino-2-etoxifenil)acetamida.

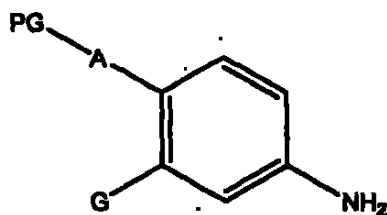
8. El método de la cláusula 6, CARACTERIZADO PORQUE el ortoformiato es ortoformiato de trietilo.

9. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE además comprende el paso de formar el compuesto de fórmula (II) por reacción de un compuesto alcoximetileno de fórmula (VI):



(VI)

con una ariamina de fórmula (V):

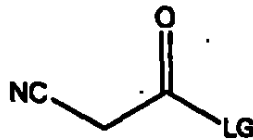


(V)

, donde LG, PG, A y G son como se definieron previamente.

10. El método de la cláusula 9, CARACTERIZADO PORQUE LG es morfollno, PG es acilo, A es amino y G es etoxi.

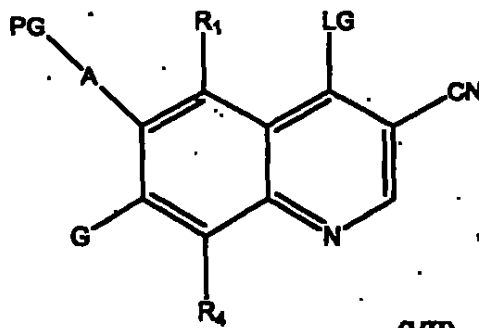
11. El método de la cláusula 9, CARACTERIZADO PORQUE además comprende el paso de formar el compuesto alcoximetileno por condensación de un compuesto metileno activo de fórmula (IV):



(IV)

con ortoformiato, donde LG es como se definió previamente.

12. El método de la cláusula 11, CARACTERIZADO PORQUE el compuesto metileno activo es morfolinoacetato.
13. El método de la cláusula 11, CARACTERIZADO PORQUE el ortoformiato es ortoformiato de trietilo.
14. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE el tratamiento del compuesto de fórmula (II) con cloruro de fosforilo tiene lugar a una temperatura en el rango de 60 a 100 °C.
15. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE un compuesto de la siguiente fórmula (VII):

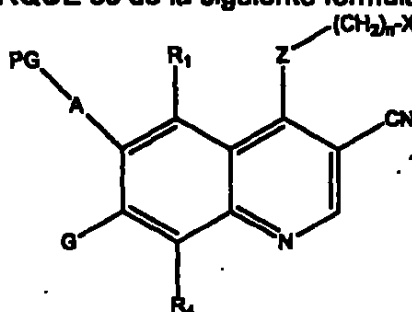


(VII)

es un intermediario que se formó luego de la reacción de un compuesto de fórmula (II) con POLG's, pero antes de la formación de un compuesto de fórmula (I), donde LG, LG', PG, A, G, R₁ y R₄ son como se definieron previamente.

000104
186

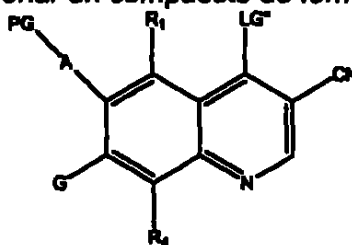
16. El método de la cláusula 15, CARACTERIZADO PORQUE LG es morfolino.
17. El método de la cláusula 16, CARACTERIZADO PORQUE el compuesto de fórmula (VII) es N-[3-ciano-7-etoxi-4-(4-morfolinil)-6-quinolinil]acetamida.
18. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE el compuesto de fórmula (I) es N-[4-cloro-3-ciano-7-hidroxi-6-quinolinil]acetamida.
19. El método de la cláusula 1, CARACTERIZADO PORQUE el compuesto de fórmula (II) es morfolincianoenamina.
20. Un método de preparación de un compuesto quinolina 4-sustituida CARACTERIZADO PORQUE es de la siguiente fórmula (VIII):



(VIII),

donde dicho método comprende los pasos de:

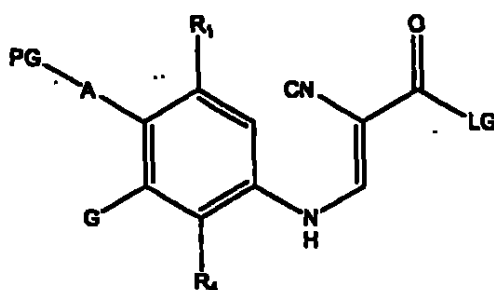
- a. hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I):



(I)

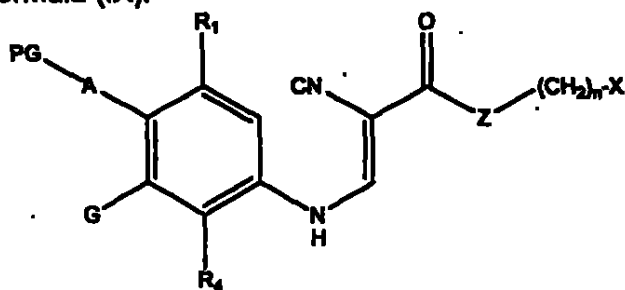
con un reactivo nucleofílico de fórmula HZ-(CH₂)_r-X; o

- b(i). hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II):



(II),

con un reactivo nucleofílico de fórmula $HZ-(CH_2)_n-X$ para formar un compuesto de fórmula (IX):



(IX); y

b(ii). ciclar el compuesto de fórmula (IX) con un reactivo de fórmula $POLG'$ para producir el compuesto de fórmula (VIII).

donde :

LG es un grupo saliente seleccionado del grupo formado por morfolino, o-mesilo, o-tosilo, triflato;

LG' es halo;

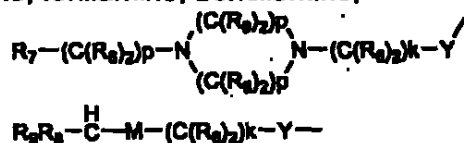
LG'' es un grupo saliente seleccionado del grupo formado por morfolino, o-mesilo, o-tosilo, triflato y halógeno;

PG es un grupo protector seleccionado del grupo formado por acilo, $CH_3OC(O)-$, $EtOC(O)-$, Fmoc, trifluoroacetamida, Troc, Fenoc, benzamida, Teoc e imidas cíclicas tal como ftalimida, maleimida y 2,5-dimetilpirrol;

A es O, NR o S;

R es H, alquilo, alquenilo o alquinilo; y

G, R₁ y R₄ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2-6 átomos de carbono, alquinioloxi de 2-6 átomos de carbono, hidroximetilo, halometilo, alcanoloxi de 1-6 átomos de carbono, alquenoloxi de 3-8 átomos de carbono, alquinioloxi de 3-8 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquenoloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alquinioloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonamida de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, alquilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano, nitró, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, ftalimida, fenilo, tiofenoxi, bencilo, amino, hidroxiamino, alcoxi-amino de 1-4 átomos de carbono, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, N-alquilcarbamilo, N,N-dialquilcarbamilo, N-alquil-N-alqueniilamino de 4 a 12 átomos de carbono, N,N-dialqueniilamino de 6-12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino,



R₇-(C(R₈)₂)_p-Y-, R₇-(C(R₈)₂)_p-M-(C(R₈)₂)_k-Y- o Het-(C(R₈)₂)_q-W-(C(R₈)₂)_z-Y-;

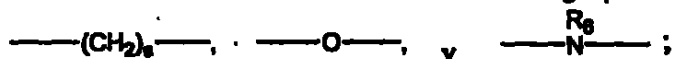
o R₁ y R₄ son como se definieron precedentemente y G es R₂-NH-;

o si cualquiera de los sustituyentes R₁, R₄ o G están ubicados sobre

00015
189

átomos de carbono contiguos entonces se pueden tomar juntos como un radical divalente $-\text{O}-\text{C}(\text{R}_6)_2-\text{O}-$:

Y es un radical divalente seleccionado del grupo formado por

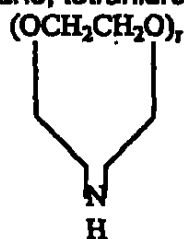


R_7 es $-\text{NR}_6\text{R}_6$, $-\text{OR}_6$, $-\text{J}$, $-\text{N}(\text{R}_6)_3^+$, o $-\text{NR}_6(\text{OR}_6)$;

M es $>\text{NR}_6$, $-\text{O}-$, $>\text{N}-(\text{C}(\text{R}_6)_2)_p\text{NR}_6\text{R}_6$, o $>\text{N}-(\text{C}(\text{R}_6)_2)_p-\text{OR}_6$;

W es $>\text{NR}_6$, $-\text{O}-$ o es un enlace;

Het se selecciona del grupo formado por morfolino, tiomorfolino, S-óxido de tiomorfolino, S,S-dióxido de tiomorfolino, piperidina, pirrolidina, aziridina, piridina, imidazol, 1,2,3-triazol, 1,2,4-triazol, tiazol, tiazolidina, tetrazol, piperazina, furano, tiofeno, tetrahidrotiofeno, tetrahidrofurano, dioxano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano y



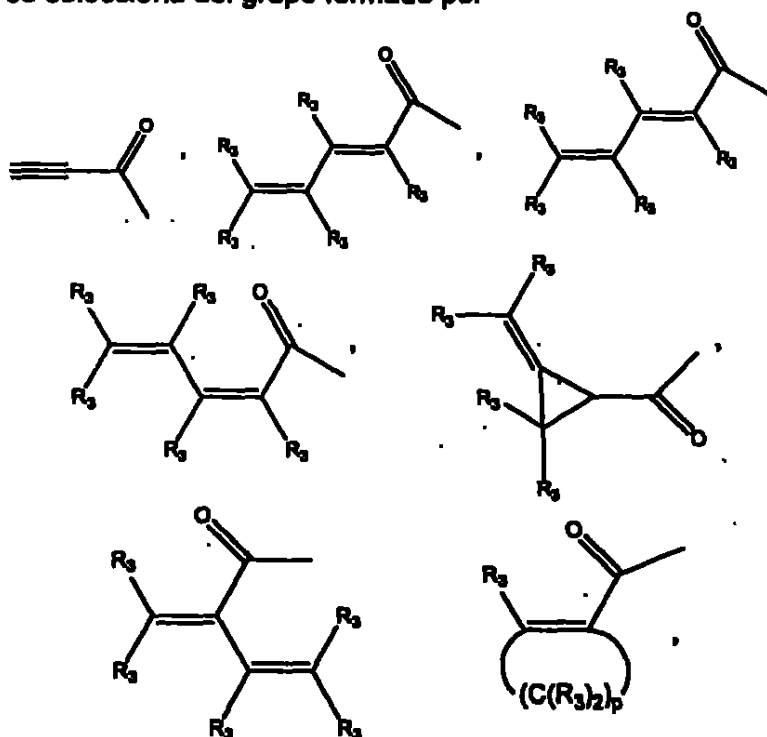
donde Het está opcionalmente mono- o di-sustituido en el carbono o nitrógeno con R_6 , opcionalmente mono- o di-sustituido en el carbono con hidroxil, $-\text{N}(\text{R}_6)_2$ o $-\text{OR}_6$, opcionalmente mono o di-sustituido en el carbono con los radicales monovalentes $-(\text{C}(\text{R}_6)_2)_n$, OR_6 o $-(\text{C}(\text{R}_6)_2)_n$, $\text{N}(\text{R}_6)_2$, y opcionalmente mono o di-sustituido en un carbono saturado con radicales divalentes $-\text{O}-$ o $-\text{O}(\text{C}(\text{R}_6)_2)_n-\text{O}-$;

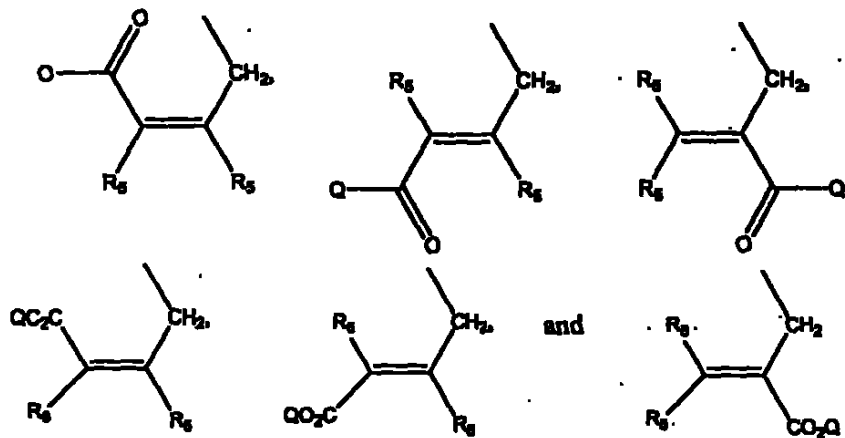
R_6 es hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, cicloalquilo de 1-6 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, carboxialquilo (2-7

000108
190

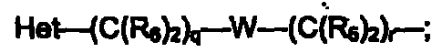
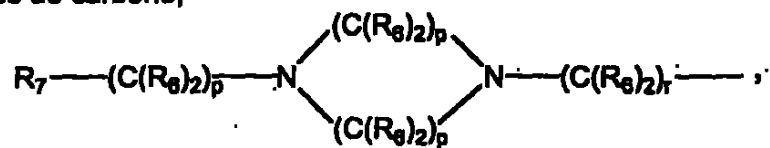
átomos de carbono), fenilo o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más entre halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, trifluorometilo, amino, alquilamino de 1-3 átomos de carbono, dialquilamino de 2-6 átomos de carbono, nitro, ciano, azida, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanolloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquilito de 1-6 átomos de carbono, hidroxil, carboxilo, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzofilo, bencilo, fenilamino, bencilamino, alcanolamino de 1-6 átomos de carbono o alquilo de 1-6 átomos de carbono; con la condición que el grupo alquenilo o alquinilo está unido a un átomo de nitrógeno u oxígeno a través de un átomo de carbono saturado;

R₂, se selecciona del grupo formado por

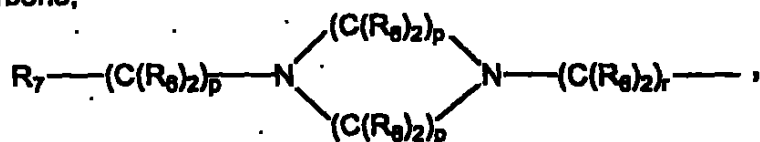




R_5 es independientemente hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, carboxi, carboalcoxi de 1-6 átomos de carbono, fenilo, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono,



R_8 es independientemente hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, carboxi, carboalcoxi de 1-6 átomos de carbono, fenilcarboalquilo de 2-7 átomos de carbono,





R_8 y R_9 son cada uno, independientemente $-(\text{C}(\text{R}_8)_2)_r\text{NR}_8\text{R}_9$ o $-(\text{C}(\text{R}_8)_2)_r\text{OR}_8$;

J es independientemente hidrógeno, cloro, flúor o bromo;

Q es un alquilo de 1-6 átomos de carbono o hidrógeno;

a = 0 ó 1;

g = 1-6;

k = 0-4;

n es 0-1;

m es 0-3;

p = 2-4;

q = 0-4;

r = 1-4;

s = 1-6;

u = 0-4 y v = 0-4, donde la suma de u+v es 2-4;

x = 0-3;

y = 0-1;

z = 0-3;

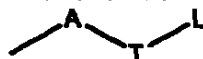
Z puede ser NR' , O o S;

n es 0 ó 1; y

X puede ser cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, que puede estar sustituido opcionalmente con uno o más grupos alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o es un anillo piridinilo, pirimidinilo o fenilo, donde dicho anillo piridinilo, pirimidinilo o fenilo puede estar opcionalmente mono-, di- o trisustituido con un sustituyente seleccionado del grupo formado por halógeno,

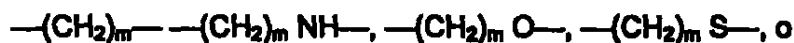
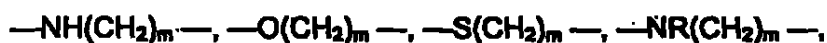
alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquénilo de 2-6 átomos de carbono, alquínilo de 2-6 átomos de carbono, azida, hidroxialquilo de 1-6 átomos de carbono, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo, clano, nítro, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzoiilo, bencilo, amino, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino; alcanollamino de 1-6 átomos de carbono, alquénollamino de 3-8 átomos de carbono, alquínollamino de 3-8 átomos de carbono, carboxialquilo de 2-7 átomos de carbono, carboalcoxialquilo de 3-8 átomos de carbono, aminoalquilo de 1-5 átomos de carbono, N-alquilaminoalquilo de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalquilo de 3-10 átomos de carbono, N-alquillaminoalcoxi de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalcoxi de 3-10 átomos de carbono, mercapto y benzollamino, o X puede ser un sistema de anillos arilo bicíclico o heteroarilo bicíclico de 8 a 12 átomos, donde el anillo heteroarilo bicíclico contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados entre N, O y S, con la condición que el anillo heteroarilo bicíclico no contenga enlaces O—O, S—S, o S—O y donde el anillo arilo bicíclico o heteroarilo bicíclico puede estar opcionalmente mono- di-, tri- o tetrasustituido con un sustituyente seleccionado del grupo formado por halógeno, oxo, tio, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquénilo de 2-6 átomos de carbono, alquínilo de 2-6 átomos de carbono, azida, hidroxialquilo de 1-6 átomos de carbono, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo,

ciano, nitro, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzollo, bencilo, amino, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino, alcanollamino de 1-6 átomos de carbono, alquenollamino de 3-8 átomos de carbono, alquinollamino de 3-8 átomos de carbono, carboxialquilo de 2-7 átomos de carbono, carboalcoxialquilo de 3-8 átomos de carbono, aminoalquilo de 1-5 átomos de carbono, N-alquilaminoalquilo de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalquilo de 3-10 átomos de carbono, N-alquilaminoalcoxi de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalcoxi de 3-10 átomos de carbono, mercapto, y benzollamino, o X puede ser un radical de la siguiente fórmula:



donde A es un anillo piridinilo, pirimidinilo o fenilo; donde dicho anillo piridinilo, pirimidinilo o fenilo puede estar opcionalmente mono- o di-sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo formado por halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, azida, hidroxialquilo de 1-6 átomos de carbono, halometilo, alcóximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquililo de 1-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo, ciano, nitro, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzollo, bencilo, amino, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino, alcanollamino de 1-6 átomos de carbono, alquenollamino de 3-8 átomos de carbono, alquinollamino de 3-8 átomos de carbono, carboxialquilo de 2-7 átomos de carbono,

carboalcoxialquillo de 3-8 átomos de carbono, aminoalquillo de 1-5 átomos de carbono, N-alquilaminoalquillo de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalquillo de 3-10 átomos de carbono, N-alquilaminoalcoxi de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalcoxi de 3-10 átomos de carbono, mercapto, y benzollamino, T está unido a un carbono de A y es:

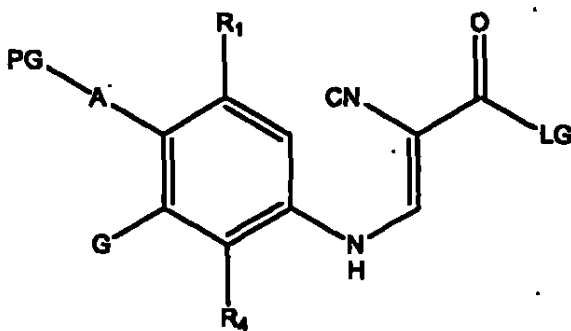


mono-, di-, o trisustituido con un sustituyente seleccionado del grupo formado por halógeno, alquillo de 1-6 átomos de carbono, alquenillo de 2-6 átomos de carbono, alquinillo de 2-6 átomos de carbono, azida, hidroxialquillo de 1-6 átomos de carbono, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanolloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, hidroxil, trifluorometilo, ciano, nitro, carboxil, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxil, benzollo, bencilo, amino, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino, alcanollamino de 1-6 átomos de carbono, alquenollamino de 3-8 átomos de carbono, alquinollamino de 3-8 átomos de carbono, carboxialquillo de 2-7 átomos de carbono, carboalcoxialquillo de 3-8 átomos de carbono, aminoalquillo de 1-5 átomos de carbono, N-alquilaminoalquillo de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalquillo de 3-10 átomos de carbono, N-alquilaminoalcoxi de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalcoxi de 3-10 átomos de carbono, mercapto y benzollamino, o L puede ser un anillo heteroarilo de 5 ó 6 miembros donde el anillo heteroarilo contiene 1 a 3 heteroátomos

seleccionados entre N, O, y S, con la condición que el anillo heteroarilo no contenga enlaces O—O, S—S, o S—O, y donde el anillo heteroarilo está opcionalmente mono- o di-sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo formado por halógeno, oxo, tio, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, azida, hidroxialquilo de 1-6 átomos de carbono, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, hidroxí, trifluorometilo, ciano, nitro, carboxi, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxi, fenilo, tiofenoxi, benzofilo, bencilo, amino, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino, alcanolamino de 1-6 átomos de carbono, alquenolamino de 3-8 átomos de carbono, alquinoxilamino de 3-8 átomos de carbono, carboxialquilo de 2-7 átomos de carbono, carboalcoxialquilo de 3-8 átomos de carbono, aminoalquilo de 1-5 átomos de carbono, N-alquilaminoalquilo de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalquilo de 3-10 átomos de carbono, N-alquilaminoalcoxi de 2-9 átomos de carbono, N,N-dialquilaminoalcoxi de 3-10 átomos de carbono, mercapto y benzolamino;

o una sal del mismo.

21. El método de la cláusula 20, CARACTERIZADO PORQUE LG' es cloro.
22. Un compuesto CARACTERIZADO PORQUE es de la siguiente fórmula (II):



(II)

donde;

LG es un grupo saliente seleccionado del grupo formado por morfolino, o-mesilo, o-tosilo o triflato; o

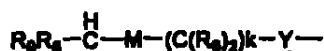
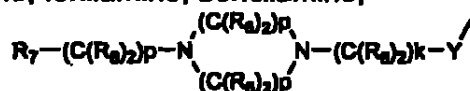
PG es un grupo protector seleccionado del grupo formado por acilo, CH₃OC(O)-, EtOC(O)-, Fmoc, trifluoroacetamida, Troc, Fenoc, benzamida, Teoc e imidas cíclicas tal como ftalimida, maleimida y 2,5-dimetilpirrol;

A es O, NR o S;

R es H, alquilo, alquenilo o alquinilo; y

G, R₁ y R₄ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2-6 átomos de carbono, alquiniloxi de 2-6 átomos de carbono, hidroximetilo, halometilo, alcanoloxi de 1-6 átomos de carbono, alquenoloxi de 3-8 átomos de carbono, alquinoloxi de 3-8 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquenoloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alquinoloximetilo de 4-9 átomos de carbono, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, alquiltio de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfinito de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1-6 átomos de carbono, alquilsulfonamida de 1-6

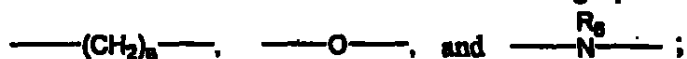
átomos de carbono, alquénilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, alquinilsulfonamida de 2-6 átomos de carbono, hidroxil, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano, nitro, carboxil, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, fenoxil, ftalimida, fenilo, tiofenoxil, bencilo, amino, hidroxilamino, alcoxilamino de 1-4 átomos de carbono, alquilamino de 1-6 átomos de carbono, dialquilamino de 2 a 12 átomos de carbono, N-alquilcarbamoilo, N,N-dialquilcarbamoilo, N-alquil-N-alquénilamino de 4 a 12 átomos de carbono, N,N-dialquénilamino de 6-12 átomos de carbono, fenilamino, bencilamino,



$R_7-(C(R_8)_2)_p-Y-$, $R_7-(C(R_8)_2)_p-M-(C(R_8)_2)_k-Y-$ o $Het-(C(R_8)_2)_q-W-(C(R_8)_2)_r-Y-$; o R_1 y R_4 son como se definieron precedentemente y G es R_2-NH- ;

o si cualquiera de los sustituyentes R_1 , R_4 o G están ubicados sobre átomos de carbono contiguos entonces se pueden tomar juntos como el radical divalente $-O-C(R_8)_2-O-$;

Y es un radical divalente seleccionado del grupo formado por



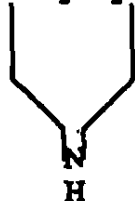
R_7 es $-NR_8R_8$, $-OR_8$, $-J$, $-N(R_8)_3^+$ o $-NR_8(OR_8)$;

M es $>NR_8$, $-O-$, $>N-(C(R_8)_2)_pNR_8R_8$, o $>N-(C(R_8)_2)_p-OR_8$;

W es $>NR_8$, $-O-$ o es un enlace;

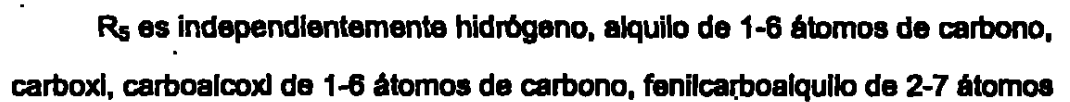
Het se selecciona del grupo formado por morfolino, tiomorfolino, S-óxido de tiomorfolino, S,S-dióxido de tiomorfolino, piperidina, pirrolidina, aziridina, piridina, imidazol, 1,2,3-triazol, 1,2,4-triazol, tiazol, tiazolidina, tetrazol,

piperazina, furano, tiofeno, tetrahidrotiofeno, tetrahidrofurano, dioxano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano y

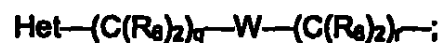
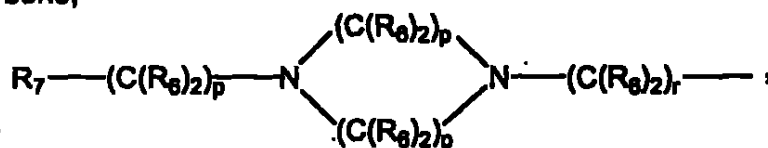


donde Het está opcionalmente mono- o di-sustituido en un carbono o nitrógeno con R_6 , opcionalmente mono- o di-sustituido en un carbono con hidroxil, $-N(R_6)_2$, o $-OR_6$, opcionalmente mono o di-sustituido en un carbono con los radicales monovalentes $-(C(R_6)_2)_n$, OR_6 o $-(C(R_6)_2)_n$, $N(R_6)_2$, y opcionalmente mono o di-sustituido en un carbono saturado con radicales divalentes $-O-$ o $-O(C(R_6)_2)_n$, $O-$;

R_6 es hidrógeno, alquilo de 1-6 átomos de carbono, alquenilo de 2-6 átomos de carbono, alquinilo de 2-6 átomos de carbono, cicloalquilo de 1-6 átomos de carbono, carboalquilo de 2-7 átomos de carbono, carboxialquilo (2-7 átomos de carbono), fenilo o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más entre halógeno, alcoxi de 1-6 átomos de carbono, trifluorometilo, amino, alquilamino de 1-3 átomos de carbono, dialquilamino de 2-6 átomos de carbono, nitró, ciano, azida, halometilo, alcoximetilo de 2-7 átomos de carbono, alcanoloximetilo de 2-7 átomos de carbono, alquililo de 1-6 átomos de carbono, hidroxil, carboxilo, carboalcoxi de 2-7 átomos de carbono, fenoxil, fenilo, tiofenoxil, benzilo, bencilo, fenilamino, bencilamino, alcanolamino de 1-6 átomos de carbono o alquilo de 1-6 átomos de carbono; con la condición que el grupo alquenilo o alquinilo está unido a un átomo de nitrógeno u oxígeno a través de un átomo de carbono saturado;



de carbono,



R_8 y R_9 son cada uno, independientemente $-(C(R_8)_2)_r NR_8 R_9$ o $-(C(R_8)_2)_r OR_8$;

J es independientemente hidrógeno, cloro, flúor o bromo;

Q es un alquilo de 1-6 átomos de carbono o hidrógeno;

a = 0 ó 1;

g = 1-6;

k = 0-4;

n es 0-1;

m es 0-3;

p = 2-4;

q = 0-4;

r = 1-4;

s = 1-6;

u = 0-4 y v = 0-4, donde la suma de u+v es 2-4;

x = 0-3;

y = 0-1;

z = 0-3;

o una sal del mismo.

23. El compuesto de la cláusula 22, CARACTERIZADO PORQUE además comprende las siguientes condiciones:

cuando R_6 es alquénilo de 2-7 átomos de carbono o alquinilo de 2-7 átomos de carbono, dicho grupo alquénilo o alquinilo está unido a un átomo de nitrógeno u oxígeno a través de un átomo de carbono saturado;

y además con la condición que

cuando Y es $-N R_6 -$ y R_7 es $-N R_6 R_6$, $-N(R_6)_3^+$ o $-N R_6 (O R_6)$, entonces $g = 2-6$;

cuando M es $-O-$ y R_7 es $-O R_6$, entonces $p = 1-4$;

cuando Y es $-N R_6 -$, entonces $k = 2-4$; cuando Y es $-O-$ y M o W es $-O-$, entonces $k = 1-4$;

cuando W no es un enlace con Het unido a través de un átomo de nitrógeno, entonces $q = 2-4$; y

cuando W es un enlace con Het unido a través de un átomo de nitrógeno e Y es $-O-$ o $-N R_6 -$, entonces $k = 2-4$.

24. El compuesto de la cláusula 22, donde LG es morfolino.

25. El compuesto de la cláusula 24, donde PG es acilo, A es amino, G es etoxi, R_1 es H y R_4 es H.

p.p. Wyeth

Miguel N. Armando (627)

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

00031

①

SOLICITUD DE

☒

Corrección de Error Material

☐

Modificación de una solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: Wyeth

Dirección: 5 Giralda Farma, Madison, NJ 07940, Estados Unidos

Nacionalidad o Domicilio: Nueva Jersey, Estados Unidos

Lugar de Constitución: Delaware, Estados Unidos

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 6o.

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: patents.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 79.143.366

TP 20.281

④

Numero de expediente

06.078.810

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada

Como respuesta a solicitud de ese despacho se presenta nuevo capítulo

reivindicatorio el cual contiene el mismo número de reivindicaciones que el presentado en la fase internacional

⑥

Comprobante de Pago No.

06-41701

Fecha 2-JUN-06

⑦

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Podera, si fuere el caso.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALVARO CORREA ORDOÑEZ

FIRMA

C.C. 79.143.366

T.P. 20.281

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

2000-F03

018

00022

106

SELECCION DE MARCA PARA LOS PRODUCTOS DE LA INDUSTRIA
Rad: 06-078810- -00003-0000
Fee: 2008-12-15 17:07:52 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tm. 11 PATENTEYII
Evo: 378 FASENACIONALI
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 32

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 41,701
FECHA : JUNIO 2 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
RAISBECK LARA RODRIGUEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	36339816	02/06/2006	30,057,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	95,000.00
		TOTAL :	\$ 95,000.00

SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____