

3744

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 540 0860
Fax in U.S.A.: (1-305) 381 9660

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-097415-A-00002-0000
Fec: 2007-03-16 17:08:19 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 2 PATENTES
Eve: 1 REGDEPOSITO
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 27

Trámite : 002
Evento : 001
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 00.097.415 A

Asunto : Solicitud de patente para **COMPUESTOS
OXAZOLIDINONAS SUSTITUIDAS Y SU PROCESO DE
PRODUCCIÓN**

Solicitante : BAYER HEALTHCARE AG

Fecha de Solicitud : 22 de diciembre de 2000

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. **14619** notificado por fijación en lista del 21 de diciembre de 2006.

2. Mediante el Oficio No. **14619** se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente.

Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. CLARIDAD DE LA SOLICITUD

Para subsanar las objeciones que sobre claridad hizo su Despacho, presento nuevo capítulo reivindicatorio con 6 reivindicaciones en el cual se han hecho los cambios respectivos, sugeridos por su Despacho. Para estos efectos, se han efectuado las siguientes modificaciones:

- El nuevo capítulo reivindicatorio se ha redactado evitando el uso de términos generales y ambiguos como "opcionalmente" y "al menos".
- La nueva reivindicación 5 referente al proceso de preparación de compuestos de acuerdo a la reivindicación 1 especifica con claridad los agentes activantes y acoplantes, así como los solventes inertes necesarios para realizar dicho proceso, los cuales están plenamente soportados en la descripción.
- La nueva reivindicación 1 reclama las sales farmacéuticamente aceptables, los hidratos y profármacos, de acuerdo con lo sugerido por su Despacho. Adicionalmente, la expresión "R¹ representa opcionalmente tiofeno benzo-fusionado (tienilo)" ha sido remplazada por "R¹ representa tiofeno (tienilo) o tiofeno benzo-fusionado (tienilo)", la cual expresa con claridad los significados de R¹.

Con las anteriores modificaciones del capítulo reivindicatorio quedan subsanadas las objeciones que por claridad hizo su Despacho ya que ahora cumplen con las disposiciones del artículo 30 de la Decisión 486.

3. Por lo tanto, le solicito se sirva continuar con el trámite de la presente solicitud pues tanto la descripción como las reivindicaciones se presentan de una forma clara y en consecuencia, con fundamento en las mismas una persona versada en la materia podría realizar el examen de patentabilidad del producto objeto de esta invención. A

pesar que las objeciones que sobre claridad planteó ese Despacho en el Oficio No. **14619** se deben tener por superadas, en el evento que el Despacho considere que sea necesario, respetuosamente le solicito hacer uso de la facultad que le otorga el artículo 45 inciso 2. de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración que considere necesaria.

3. ANEXOS:

- 3.1. Nuevo pliego reivindicatorio con 6 reivindicaciones.
- 3.2. Formulario de modificaciones.
- 3.3. Recibo por valor de \$99.000 por concepto de modificaciones en solicitud pendiente.

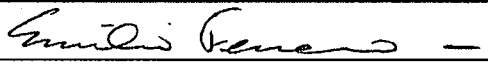
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

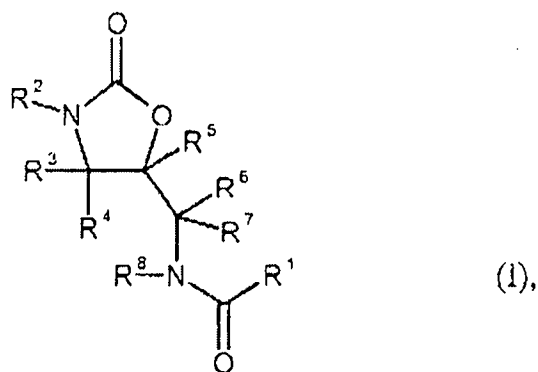
T.P.A. No. 31.929

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: BAYER HEALTHCARE AG Sociedad constituida y existente bajo las leyes las Reyes Federal de Alemania. Dirección: 51368 Leverkusen, Republica Federal de Alemania Domicilio: Leverkusen, Republica Federal de Alemania. Lugar de Constitución: Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@camyp.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 438.019 TP 31.929
4	Número de expediente: 00.097.415 A	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Se presenta nuevo capitulo reivindicatorio con 6 reivindicaciones con el objeto de subsanar la posible falta de claridad de la solicitud. _____ _____	
6	Comprobante de pago No. 07-14,467 Fecha: 19 de febrero de 2007	
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$99.000.00 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929	

Reivindicaciones

1. Compuestos de la fórmula general (I)



En la cual:

R^1 representa tiofeno (tienilo) o tiofeno benzo-fusionado (tienilo) que puede ser mono o polisustituido por un radical del grupo que consiste de halógeno; ciano; nitro; amino; aminometilo; alquilo (C_1 - C_8) el cual por su parte puede ser mono o polisustituido por halógeno; cicloalquilo (C_3 - C_7); alcoxi (C_1 - C_8); imidazolinilo; $-C(=NH)NH_2$; carbamoilo; y mono y di-alquil(C_1 - C_4)aminocarbonilo,

R^2 representa uno de los grupos de adelante:

A-,

A-M-,

D-M-A-,

B-M-A-,

B-,

B-M-,

B-M-B-,

D-M-B-,

Donde:

El radical "A" representa arilo (C_6-C_{14}), preferiblemente arilo (C_6-C_{10}), en particular fenilo o naftilo, muy particularmente preferiblemente fenilo;

El radical "B" representa un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene hasta 3 heteroátomos y/o miembros de heterocadena, en particular hasta 2 heteroátomos y/o miembros de heterocadena, del grupo que consiste de S, N, NO (N-óxido) y O;

El radical "D" representa un heterociclo saturado o parcialmente insaturado, mono o bicíclico, benzo-fusionado de 4 a 9 miembros o un heterociclo de 4 a 9 miembros que contiene hasta tres heteroátomos y/o los miembros de la heterocadena del grupo que consiste de S, SO, SO_2 , N, NO (N-óxido) y O;

El radical "M" representa $-NH-$, $-CH_2-$, $-CH_2-CH_2-$, $-O-$, $-NH-CH_2-$, $-CH_2-NH-$, $-OCH_2-$, $-CH_2O-$, $-CONH-$, $-NHCO-$, $-COO-$, $-OOC-$, $-S-$, $-SO_2-$ o representa una unión covalente;

Donde

Los grupos "A", "B" y "D" definidos anteriormente cada uno pueden ser mono o polisustituidos por un radical del grupo que consiste de halógeno; trifluorometilo; oxo; ciano; nitro; carbamoilo; piridilo; alcanilo (C_1-C_6); cicloalcanilo (C_3-C_7); arilcarbonilo (C_6-C_{14}); heteroarilcarbonilo (C_5-C_{10}); alcaniloximetiloxi (C_1-C_6); hidroxialquilcarbonilo (C_1-C_4); $-COOR^{27}$; $-SO_2R^{27}$; $-C(NR^{27}R^{28})=NR^{29}$; $-CONR^{28}R^{29}$; $-SO_2NR^{28}R^{29}$; $-OR^{30}$; $-NR^{30}R^{31}$; alquilo (C_1-C_6) y cicloalquilo (C_3-C_7),

Donde alquilo (C₁-C₆) y cicloalquilo (C₃-C₇) por su parte pueden ser sustituidos por un radical del grupo que consiste de ciano; -OR²⁷; -NR²⁸R²⁹; -CO(NH)_v(NR²⁷R²⁸) y -C(NR²⁷R²⁸)=NR²⁹,

Donde:

v es 0 o 1 y

R²⁷, R²⁸ y R²⁹ son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro representan cada uno hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alcanilo (C₁-C₄), carbamilo, trifluorometilo, fenilo, o piridilo,

y/o

R²⁷ y R²⁸ o R²⁹ junto con el átomo de nitrógeno al cual ellos están unidos forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 a 7 miembros que tiene hasta tres, preferiblemente hasta dos, heteroátomos idénticos o diferentes del grupo que consiste de N, O y S, y

R³⁰ y R³¹ son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro cada uno representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alquilsulfonilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), aminoalquilo (C₁-C₄), di-alquilamino (C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄), -CH₂C(NR²⁷R²⁸)=NR²⁹ o -COR³³,

Donde

R³³ representa alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxycarbonilo (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), aminoalquilo (C₁-C₄), alcoxycarbonilo (C₁-C₄),

alcanoil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alquenilo (C₁-C₆),
alquilo (C₁-C₈), que puede ser sustituido por fenilo o acetilo, arilo (C₆-
C₁₄), heteroarilo (C₅-C₁₀), trifluorometilo, tetrahidrofuranilo o
butirolactona,

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son idénticos o diferentes y representa cada uno hidrógeno
o representa alquilo (C₁-C₆)

y sus sales farmacéuticamente aceptables, hidratos y profármacos.

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I), en los cuales el radical R¹
es un radical 2-tiofeno no sustituido y el radical R² es simultáneamente un radical
fenilo mono o polisustituido y los radicales R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son cada uno
simultáneamente hidrógeno
y

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I) en los cuales el radical

R¹ representa 2-tiofeno que es sustituido en la posición 5 por un radical del
grupo que consiste de cloro, bromo, metilo y trifluorometilo,

R² representa D-A-:

Donde:

El radical "A" representa fenileno;

el radical "D" representa un heterociclo saturado de 5 o 6 miembros,

que esta unido a "A" por vía de un átomo de nitrógeno,

que tiene un grupo carbonilo directamente adyacente al átomo de nitrógeno enlazante y en el cual un miembro del anillo de carbono se puede reemplazar por un heteroátomo del grupo que consiste de S, N, y O;

donde

el grupo "A" definido anteriormente puede ser mono o disustituido en la posición meta con respecto al punto de unión de la oxazolidinona, por un radical del grupo que consiste de flúor, cloro, nitro, amino, trifluorometilo, metilo y ciano,

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y R^8 representan cada uno hidrógeno.

2. Los compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo a la Reivindicación 1, caracterizado por

R^1 representa tiofeno (tienilo), en particular 2-tiofeno, el cual puede ser mono o polisustituido por halógeno, preferiblemente cloro o bromo, por amino, aminometilo o alquilo (C_1-C_8), preferiblemente metilo, donde el radical alquilo (C_1-C_8) por su parte puede ser mono o polisustituido por halógeno, preferiblemente flúor,

R^2 representa uno de los grupos de adelante:

A-,

A-M-,

D-M-A-,

B-M-A-,

B-,

B-M-,

B-M-B-,

D-M-B-,

Donde:

El radical "A" representa arilo (C_6-C_{14}), preferiblemente arilo (C_6-C_{10}), en particular fenilo o naftilo, muy particularmente preferiblemente fenilo;

El radical "B" representa un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene hasta 3 heteroátomos y/o miembros de la heterocadena, en particular hasta 2 heteroátomos y/o los miembros de la heterocadena, del grupo que consiste de S, N, NO (N-óxido) y O;

El radical "D" representa un heterociclo saturado o parcialmente saturado, de 4 a 7 miembros que contiene hasta tres heteroátomos y/o miembros de la heterocadena del grupo que consiste de S, SO, SO_2 , N, NO (N-óxido) y O;

El radical "M" representa $-NH-$, $-CH_2-$, $-CH_2-CH_2-$, $-O-$, $-NH-CH_2-$, $-CH_2-NH-$, $-OCH_2-$, $-CH_2O-$, $-CONH-$, $-NHCO-$, $-COO-$, $-OOC-$, $-S-$, $-SO_2-$ o representa una unión covalente;

Donde

Los grupos "A", "B" y "D" definidos anteriormente pueden en cada caso ser mono o polisustituídos por un radical del grupo que consiste de halógeno; trifluorometilo; oxo; ciano; nitro; carbamoilo; piridilo; alcanilo (C_1-C_6); cicloalcanilo (C_3-C_7); arilcarbonilo (C_6-C_{14}); heteroarilcarbonilo (C_5-C_{10}); alcaniloximetiloxi (C_1-C_6); $-COOR^{27}$; $-SO_2R^{27}$; $-C(NR^{27}R^{28})=NR^{29}$; -

CONR²⁸R²⁹; -SO₂NR²⁸R²⁹; -OR³⁰; -NR³⁰R³¹; alquilo (C₁-C₆) y cicloalquilo (C₃-C₇),

Donde alquilo (C₁-C₆) y cicloalquilo (C₃-C₇) por su parte pueden ser sustituidos por un radical del grupo que consiste de ciano; -OR²⁷; -NR²⁸R²⁹; -CO(NH)_v(NR²⁷R²⁸) y -C(NR²⁷R²⁸)=NR²⁹,

Donde:

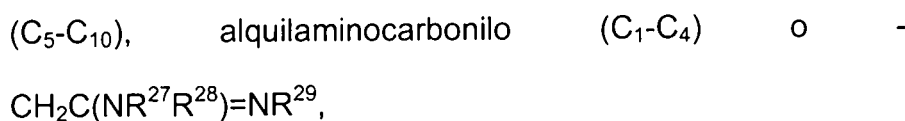
v es 0 o 1 y

R²⁷, R²⁸ y R²⁹ son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro representa cada uno hidrógeno, alquilo (C₁-C₄) o cicloalquilo (C₃-C₇),

y/o

R²⁷ y R²⁸ o R²⁹ junto con el átomo de nitrógeno al cual ellos están unidos forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 a 7 miembros que tiene hasta tres, preferiblemente hasta dos, heteroátomos idénticos o diferentes del grupo que consiste de N, O y S, y

R³⁰ y R³¹ son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro cada uno representa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), alquilsulfonilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), aminoalquilo (C₁-C₄), di-alquilamino (C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄), alcanoilo (C₁-C₄), arilcarbonilo (C₆-C₁₄), heteroarilcarbonilo



R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 y R^8 son idénticos o diferentes y
representa cada uno hidrógeno o representa alquilo (C_1-C_6),

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I), en el cual el radical R^1 es un radical 2-tiofeno no sustituido y el radical R^2 es simultáneamente un radical fenilo mono o polisustituido y los radicales R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 y R^8 son cada uno simultáneamente hidrógeno
y

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I) en los cuales el radical

R^1 representa 2-tiofeno que es sustituido en la posición 5 por un radical del grupo que consiste de cloro, bromo, metilo y trifluorometilo,

R^2 representa D-A-:

Donde:

el radical "A" representa fenileno;

el radical "D" representa un heterociclo saturado de 5 o 6 miembros,

que esta unido a "A" vía un átomo de nitrógeno,

que tiene un grupo carbonilo directamente adyacente al átomo de nitrógeno enlazante y en el cual un miembro del anillo de carbono se puede reemplazar por un heteroátomo del grupo que consiste de S, N, y O;

donde

el grupo "A" definido anteriormente puede ser mono o disustituido en la posición meta con respecto al punto de unión de la oxazolidinona, por un radical del grupo que consiste de flúor, cloro, nitro, amino, trifluorometilo, metilo y ciano,

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y R^8 representan cada uno hidrógeno.

3. Los compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo a la Reivindicación 1, caracterizado porque

R^1 representa tiofeno (tienilo), en particular 2-tiofeno, que puede ser mono o polisustituido por halógeno, preferiblemente cloro o bromo, o por alquilo (C_1 - C_8), preferiblemente metilo, donde el radical alquilo (C_1 - C_8) por su parte puede ser mono o polisustituido por halógeno, preferiblemente flúor,

R^2 representa uno de los grupos de adelante:

A-,

A-M-,

D-M-A-,

B-M-A-,

B-,

B-M-,

B-M-B-,

D-M-B-,

Donde:

El radical "A" representa fenilo o naftilo, en particular fenilo;

El radical "B" representa un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene hasta 2 heteroátomos del grupo que consiste de S, N, NO (N-óxido) y O;

El radical "D" representa un heterociclo saturado o parcialmente insaturado, de 5 o 6 miembros que contiene hasta dos heteroátomos y/o miembros de la heterocadena del grupo que consiste de S, SO, SO₂, N, NO (N-óxido) y O;

El radical "M" representa -NH-, -O-, -NH-CH₂-, -CH₂-NH-, -OCH₂-, -CH₂O-, -CONH-, -NHCO-, o representa una unión covalente;

Donde

Los grupos "A", "B" y "D" definidos anteriormente pueden en cada caso ser mono o polisustituídos por un radical del grupo que consiste de halógeno; trifluorometilo; oxo; ciano; piridilo; alcanilo (C₁-C₃); arilcarbonilo (C₆-C₁₀); heteroarilcarbonilo (C₅-C₆); alcaniloximetiloxi (C₁-C₃); -C(NR²⁷R²⁸)=NR²⁹; -CONR²⁸R²⁹; -SO₂NR²⁸R²⁹; -OH; -NR³⁰R³¹; alquilo (C₁-C₄); y ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

Donde alquilo (C₁-C₄) y ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo por su parte pueden ser sustituidos por un radical del grupo que consiste de ciano; -OH; -OCH₃; -NR²⁸R²⁹; -CO(NH)_v(NR²⁷R²⁸) y -C(NR²⁷R²⁸)=NR²⁹,

Donde:

v es 0 o 1, preferiblemente 0, y

R^{27} , R^{28} y R^{29} son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro representan cada uno hidrógeno, alquilo (C_1 - C_4) u otro ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo

y/o

R^{27} y R^{28} o R^{27} y R^{29} junto con el átomo de nitrógeno al cual ellos están unidos pueden formar un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 a 7 miembros que tiene hasta dos heteroátomos idénticos o diferentes del grupo que consiste de N, O y S, y

R^{30} y R^{31} son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro representa cada uno hidrógeno, alquilo (C_1 - C_4), ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, alquilsulfonilo (C_1 - C_4), hidroxialquilo (C_1 - C_4), aminoalquilo (C_1 - C_4), di-alquilamino (C_1 - C_4)-alquilo(C_1 - C_4), alcanilo (C_1 - C_3) o fenilcarbonilo,

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y R^8 son idénticos o diferentes y cada uno representa hidrógeno o representa alquilo (C_1 - C_6),

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I), en los cuales el radical R^1 es un radical 2-tiofeno no sustituido y el radical R^2 es simultáneamente un radical fenilo mono o polisustituido y los radicales R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y R^8 son cada uno simultáneamente hidrógeno, y

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I) en el cual el radical

R¹ representa 2-tiofeno que es sustituido en la posición 5 por un radical del grupo que consiste de cloro, bromo, metilo y trifluorometilo,

R² representa D-A-:

Donde:

el radical "A" representa fenileno;

el radical "D" representa un heterociclo saturado de 5 o 6 miembros,

que esta unido a "A" por vía de un átomo de nitrógeno,

que tiene un grupo carbonilo directamente adyacente al átomo de nitrógeno

enlazante y en el cual un miembro del anillo de carbono se puede

reemplazar por un heteroátomo del grupo que consiste de S, N, y O;

donde

el grupo "A" definido anteriormente puede ser mono o disustituido en la

posición meta con respecto al punto de unión de la oxazolidinona, por un

radical del grupo que consiste de flúor, cloro, nitro, amino, trifluorometilo,

metilo y ciano,

R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ cada uno representa hidrógeno.

4. Los compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo a la Reivindicación 1, caracterizado porque

R¹ representa 2-tiofeno que puede ser sustituido en la posición 5 por un radical del grupo que consiste de cloro, bromo, metilo o trifluorometilo,

R^2 representa uno de los grupos de adelante:

A-,

A-M-,

D-M-A-,

B-M-A-,

B-,

B-M-,

B-M-B-,

D-M-B-,

Donde:

El radical "A" representa fenilo o naftilo, en particular fenilo;

El radical "B" representa un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene hasta 2 heteroátomos del grupo que consiste de S, N, NO (N-óxido) y O;

El radical "D" representa un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 o 6 miembros que contiene un átomo de nitrógeno y puede ser un heteroátomo adicional y/o un miembro de la heterocadena del grupo que consiste de S, SO, SO₂, y O; o contiene hasta dos heteroátomos y/o miembros de la heterocadena del grupo que consiste de S, SO, SO₂, y O;

El radical "M" representa -NH-, -O-, -NH-CH₂-, -CH₂-NH-, -OCH₂-, -CH₂O-, -CONH-, -NHCO-, o representa una unión covalente;

Donde

Los grupos "A", "B" y "D" definidos anteriormente pueden en cada caso ser mono o polisustituidos por un radical del grupo que consiste de halógeno; trifluorometilo; oxo; ciano; piridilo; alcanilo (C₁-C₃); arilcarbonilo (C₆-C₁₀);

heteroarilcarbonilo (C_5-C_6); alcaniloximetiloxi (C_1-C_3); $-CONR^{28}R^{29}$; $-SO_2NR^{28}R^{29}$; $-OH$; $-NR^{30}R^{31}$; alquilo (C_1-C_4); y ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

Donde alquilo (C_1-C_4) y ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo por su parte pueden ser sustituidos por un radical del grupo que consiste de ciano; $-OH$; $-OCH_3$; $-NR^{28}R^{29}$; $-CO(NH)_v(NR^{27}R^{28})$ y $-C(NR^{27}R^{28})=NR^{29}$,

Donde:

v es 0 o 1, preferiblemente 0, y

R^{27} , R^{28} y R^{29} son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro cada uno representan hidrógeno, alquilo (C_1-C_4) u otro ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo

y/o

R^{27} y R^{28} o R^{27} y R^{29} junto con el átomo de nitrógeno al cual ellos están unidos pueden formar un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 a 7 miembros que tiene hasta dos heteroátomos idénticos o diferentes del grupo que consiste de N, O y S, y

R^{30} y R^{31} son idénticos o diferentes e independientemente uno del otro representan cada uno hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, alquilsulfonilo (C_1-C_4), hidroxialquilo (C_1-C_4), aminoalquilo (C_1-C_4), di-alquilamino (C_1-C_4)-alquilo(C_1-C_4), alcanilo (C_1-C_3) o fenilcarbonilo,

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 y R^8 son idénticos o diferentes y

Representan cada uno hidrógeno o representa alquilo (C_1-C_4),

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I), en el cual el radical R^1 es un radical 2-tiofeno no sustituido y el radical R^2 es simultáneamente un radical fenilo mono o polisustituido y los radicales R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 y R^8 son cada uno simultáneamente hidrógeno, y

Excepto para los compuestos de la fórmula general (I) en el cual el radical

R^1 representa 2-tiofeno que es sustituido en la posición 5 por un radical del grupo que consiste de cloro, bromo, metilo y trifluorometilo,

R^2 representa D-A-:

Donde:

el radical "A" representa fenileno;

el radical "D" representa un heterociclo saturado de 5 o 6 miembros,

que esta unido a "A" por vía de un átomo de nitrógeno,

que tiene un grupo carbonilo directamente adyacente al átomo de nitrógeno enlazante y en el cual un miembro del anillo de carbono se puede reemplazar por un heteroátomo del grupo que consiste de S, N, y O;

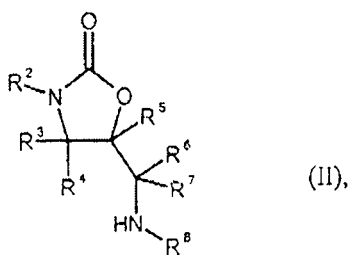
donde

el grupo "A" definido anteriormente puede ser mono o disustituido en la posición meta con respecto al punto de unión de la oxazolidinona, por un radical del grupo que consiste de flúor, cloro, nitro, amino, trifluorometilo, metilo y ciano,

R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 y R^8 representan cada uno hidrógeno.

5. Proceso para preparar oxazolidinonas sustituidas de acuerdo a la Reivindicación 1, donde de acuerdo a un proceso alternativo

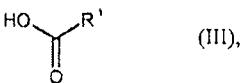
[A] los compuestos de fórmula general (II)



En el cual

Los radicales R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 son cada uno definidos en la Reivindicación 1

Reaccionan con ácidos carboxílicos de la fórmula general (III)

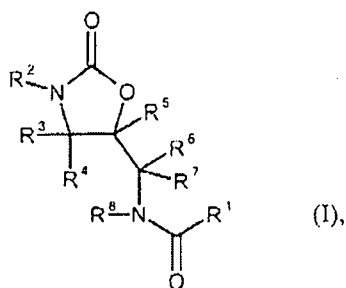


En la cual

El radical R^1 es como se definió en la Reivindicación 1,

U otro con los correspondientes haluros de carbonilo, preferiblemente cloruros de carbonilo, u otros con los correspondientes anhídridos carboxílicos simétricos o mezclados de los ácidos carboxílicos de la fórmula general (III) definidos anteriormente

En solventes inertes, seleccionados del grupo que consiste de hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, triclorometano, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetileno o tricloroetileno, éteres, tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, glicol dimetil éter o dietilen glicol dimetil éter, alcoholes, tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol o terc-butanol, hidrocarburos, tales como benceno, xileno, tolueno, hexano o ciclohexano, dimetilformamida, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina, triamida hexametilfosfórica o agua, o mezclas de éstos, si es apropiado en la presencia de N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida • HCl, N,N'-díciclohexil-carbodiimida o 1-hidroxi-1H-benzotriazol • H₂O y/o una base, seleccionada del grupo que consiste de hidróxidos de metal alcalino, carbonatos de metal alcalino, metóxido de sodio o metoxido de potasio o etóxido de sodio o etóxido de potasio o terc-butóxido de potasio, o amidas, tales como amida de sodio, bis-(trimetilsilil)amida de litio o diisopropilamida de litio, o aminas, tales como trietilamina, diisopropiletilamina, diisopropilamina, 4-N,N-dimetilaminopiridina o piridina, para dar compuestos de la fórmula general (I)

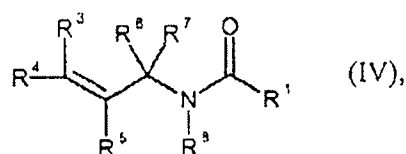


En la cual

Los radicales R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, y R⁸ son cada uno definidos en la Reivindicación 1,

U otro de acuerdo a un proceso alternativo

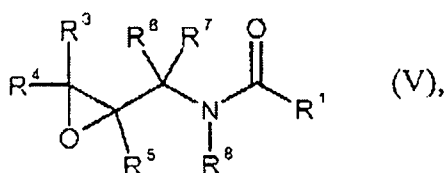
[B] compuestos de la fórmula general (IV)



En la cual

Los radicales R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , y R^8 son cada uno definidos en la Reivindicación 1,

Son convertidos, utilizando ácido m-cloroperbenzóico (MCPBA), metaperiodato de sodio, N-metilmorfolino N-óxido (NMO), ácido monoperoxiftálico o tetróxido de osmio en un solvente inerte, seleccionado del grupo que consiste de hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, triclorometano, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetileno o tricloroetileno, éteres, tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, glicol dimetil éter o dietilen glicol dimetil éter, alcoholes, tales como metanol, etanol, n.propanol, isopropanol, n-butanol o terc-butanol, hidrocarburos, tales como benceno, xileno, tolueno, hexano o ciclohexano, dimetilformamida, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina, triamida hexametilfosfórica o agua, o mezclas de éstos, en el epóxido correspondiente de la fórmula general (V)



Los radicales R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , y R^8 son cada uno como se definió en la Reivindicación 1,

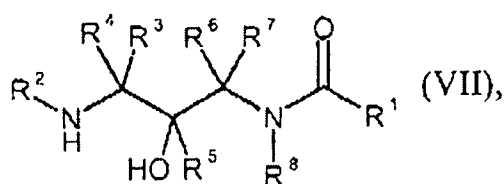
Y, mediante la reacción en un solvente inerte, seleccionado del grupo que consiste de hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, triclorometano, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetileno o tricloroetileno, éteres, tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, glicol dimetil éter o dietilen glicol dimetil éter, alcoholes, tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol o terc-butanol, hidrocarburos, tales como benceno, xileno, tolueno, hexano o ciclohexano, dimetilformamida, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina, triamida hexametilfosfórica, o agua, o mezclas de éstos, si es apropiado en la presencia de un catalizador, con una amina de la fórmula general (VI)



En la cual

El radical R^2 es como se definió en la Reivindicación 1,

Los compuestos de la fórmula general (VII)

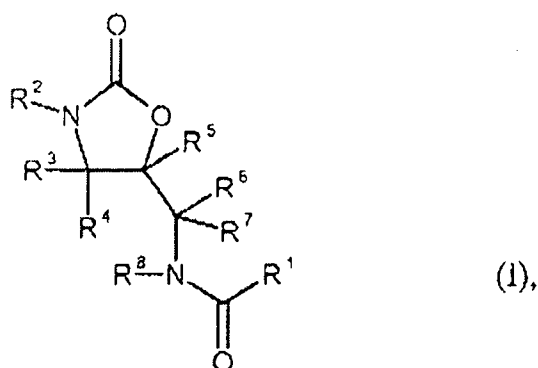


En la cual

Los radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , y R^8 son cada uno como se definió en la Reivindicación 1,

Son inicialmente preparados y,

Subsecuentemente, en un solvente inerte, seleccionado del grupo que consiste de hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, triclorometano, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, tricloroetano, tetracloroetano, 1,2-dicloroetileno o tricloroetileno, éteres, tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, glicol dimetil éter o dietilen glicol dimetil éter, alcoholes, tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol o terc-butanol, hidrocarburos, tales como benceno, xileno, tolueno, hexano o ciclohexano, dimetilformamida, dimetil sulfóxido, acetonitrilo, piridina, triamida hexametilfosfórica, o agua, o mezclas de éstos, en la presencia de fosgeno o equivalentes de fosgeno, tales como, por ejemplo, carbonildiimidazol (CDI), ciclizado para dar los compuestos de la fórmula general (I)



En la cual

Los radicales R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, y R⁸ son cada uno como se definió en la Reivindicación 1,

Donde –ambos para el proceso alternativo [A] y para el proceso alternativo [B]- en le caso donde R² contiene un radical de hidrocarburo cíclico de 3 a 7 miembros saturado o parcialmente insaturado que tiene uno o más heteroátomos idénticos o diferentes del grupo que consiste de N y S, una oxidación con ácido m-cloroperbenzóico (MCPBA), metaperiodato de sodio,

N-metilmorfolino N-óxido (NMO), ácido monoperoxiftálico o tetróxido de osmio para lograr la sulfona correspondiente, el sulfóxido o el N-óxido pueden seguir, y/o

Donde –ambos para el proceso alternativo [A] y para el proceso alternativo [B]- en le caso donde el compuesto preparado de esta manera tiene un grupo ciano en la molécula, una amidinación de este grupo ciano por métodos de costumbre puede seguir, y/o

Donde –ambos para el proceso alternativo [A] y para el proceso alternativo [B]- en le caso donde el compuesto preparado de esta manera tiene un grupo protector amino BOC en la molécula, la remoción de este grupo protector amino BOC por métodos de costumbre puede seguir, y/o

Donde –ambos para el proceso alternativo [A] y para el proceso alternativo [B]- en le caso donde el compuesto preparado de esta manera tiene un radical anilina o benzilamina en la molécula, una reacción de este grupo amino con varios reactivos tales como ácidos carboxílicos, anhídridos carboxílicos, cloruros de carbonilo, isocianatos, cloruros de sulfonilo o alquil haluros para dar los derivados correspondientes pueden seguir, y/o

Donde –ambos para el proceso alternativo [A] y para el proceso alternativo [B]- en le caso donde el compuesto preparado de esta manera tenga un anillo de fenilo en la molécula, una reacción con ácido clorosulfónico y la reacción subsecuente con aminas para dar las sulfonamidas correspondientes puede seguir.

6. Los medicamentos, que comprenden un compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo a la Reivindicación 1 y uno o más auxiliares o excipientes farmacológicamente aceptables.

400

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 14,467
FECHA : FEBRERO 19 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-097415-A-00002-0000
Fec: 2007-03-16 17:08:19 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 2 PATENTES
Eve: 1 REGDEPOSITO
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 27

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55767485	19/02/2007	35,641,000.00

***** 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 LEMAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO 14033 801 001 4

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020

Bogotá, D.C., 25 de abril de 2007

Doctor
EMILIO FERRERO
(Apoderado)

ASUNTO	Radicación	00097415A
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	00004963
	Folios	003

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados:

Los textos estudiados fueron la descripción (Folios: 10 a 195) y las reivindicaciones modificadas 1 a 6 (Folios: 378 a 399).

La presente solicitud reivindica prioridad alemana N° DE19962924.2 de 24 de diciembre de 1999 y cumple con lo establecido en los artículos 9, 10 y 11 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Objeto de invención:

La presente solicitud se titula: "Compuestos oxazolidinonas sustituidas y su proceso de producción".

El objeto de la presente solicitud se refiere a derivados de oxazolidinona, a procedimientos para su preparación así como a su uso como principio activo en medicamentos.

Según la descripción, la coagulación sanguínea es un mecanismo de protección del organismo mediante el cual se pueden sellar de forma rápida y fiable defectos en la pared vascular. De este modo, puede evitarse o minimizarse una pérdida de sangre. La hemostasia tras una herida vascular se realiza esencialmente por el sistema de coagulación, en el que se desencadena una cascada enzimática de reacciones complejas de proteínas del plasma. En esto intervienen numerosos factores de coagulación sanguínea, de los cuales cada uno, tan pronto se activa, transforma al siguiente precursor inactivo en su forma activa. Al final de la cascada resulta la transformación del fibrinógeno soluble en la fibrina insoluble, de modo que se forma un coágulo sanguíneo. Tradicionalmente, en la coagulación sanguínea se diferencia entre el sistema intrínseco y el sistema extrínseco que confluyen en una ruta de reacción final común. A este respecto el factor Xa, que se forma a partir de la proenzima factor x, desempeña un papel clave, pues une ambas rutas de coagulación. La serinaproteasa Xa activada disocia la protrombina en trombina. La

trombina formada disocia a su vez el fibrinógeno en fibrina, una substancia coagulante gelatinosa fibrosa. Además de ello, la trombina es un potente desencadenante de la agregación de los trombocitos que contribuye igualmente de forma notable a la hemostasis.

La activación descontrolada del sistema de coagulación o una inhibición defectuosa del proceso de activación puede producir la formación de trombos o embolias locales en vasos (arterias, venas, vasos linfáticos) o cavidades cardiacas. Esto puede conducir a enfermedades graves como infarto cardiaco, angina de pecho, reoclusiones y reestenosis tras una angioplastia o bypass aortocoronario, apoplejía cerebral, ataques isquémicos transitorios, enfermedades oclusivas arteriales periféricas, embolias pulmonares o trombosis venosas profundas. Estas enfermedades tromboembólicas son la causa más frecuente de morbilidad en la mayoría de los países industriales.

De acuerdo con la presente solicitud para la terapia y profilaxis de enfermedades tromboembólicas se utiliza una heparina que se administra parenteral o subcutáneamente. Debido a las propiedades farmacocinéticas más adecuadas actualmente se prefiere ciertamente cada vez más la heparanina de bajo peso molecular; sin embargo, tampoco así pueden evitarse los inconvenientes conocidos que presenta la terapia con heparina: inhibe simultáneamente varios factores de la cascada de coagulación resulta una actividad no selectiva. Existe un alto riesgo de hemorragia, en especial pueden producirse hemorragias cerebrales y hemorragias en el tracto intestinal y esto puede conducir a trombopenia, alopecia medicamentosa u osteoporosis.

Lo que se reivindica como novedoso es lo siguiente: derivados de oxazolidinonas de fórmula general (I) (ver folio: 378).

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A61K 31/421, 31/16.

Respecto de los artículos 28 y 30:

El artículo 30 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: "Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción."

Las reivindicaciones podrán ser independientes o dependientes. Una reivindicación será independiente cuando defina la materia que se desea proteger sin referencia a otra reivindicación anterior. Una reivindicación será dependiente cuando defina la materia que se desea proteger refiriéndose a una reivindicación anterior. Una reivindicación que se refiera a dos o más reivindicaciones anteriores se considerará una reivindicación dependiente múltiple."

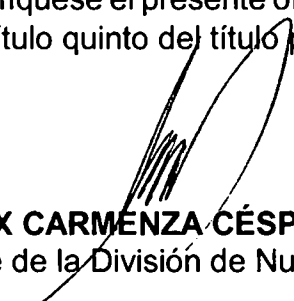
De acuerdo con lo anterior, el capítulo reivindicatorio debe ser más conciso, a pesar de las modificaciones que ha hecho el señor solicitante; los significados para R2 continúan siendo bastante amplios y abarcando una gran cantidad de compuestos, que pueden estar fuera de lo revelado en los ejemplos de esta solicitud divisional. De igual modo, se presenta por ejemplo el significado para R2 de D-M-A, donde M puede ser un enlace covalente, por lo cual R2 sería D-A, que es el mismo significado de R2 en la solicitud original 00-97415, la cual ya fue concedido el privilegio de patente por parte de esta Oficina.

De otro lado, se le recuerda al señor solicitante que las reivindicaciones no deben caracterizarse por lo que no son o por lo que no debe encontrarse en dichas reivindicaciones, es decir, en gran parte los compuestos que se reclaman se

caracterizan por una serie de excepciones, que sería conveniente colocar los compuestos como tal que han sido objeto de la invención como tal.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 03 MAYO 2007

CONCEPTO TÉCNICO Nº: 662	EXAMINADOR TÉCNICO Código Nº: 202005	EXAMINADOR JURÍDICO Código Nº:
-----------------------------	---	-----------------------------------