

BOGOTA - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y C
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-054440- -00003-0000

Fecha: 2009-10-26 16:24:44 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 7

701
A
SO
m
m

Re: PI.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "COMPUESTOS DE 4-HIDROXI-2-OXO-2, 3-DIHIDRO-1, 3-BENZOTIAZOL-7IL PARA LA MODULACIÓN DE LA ACTIVIDAD DEL ADRENORECEPTOR β 2".-Clase C07D 285/14.- Expediente número 09-054.440.-

1. Me refiero al Oficio No. **11050** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista del 2 de Octubre de 2009.
2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar el recibo de pago de la tasa establecida para la reivindicación adicional de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a la reivindicación 18, la cual ha sido reenumerada ahora como nueva reivindicación 16, la cual deberá ser estudiada junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:
 - (a) Recibos números 09-78.313, que acredita el pago de la tasa mencionada; y
 - (b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por 16 reivindicaciones.
4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 78,313
FECHA : OCTUBRE 19 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-054440- -00003-0000

Fecha: 2009-10-26 16:24:44 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evt: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 7

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	79464431	19/10/2009	18,384,180.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	25,000.00
		TOTAL :	\$ 25,000.00

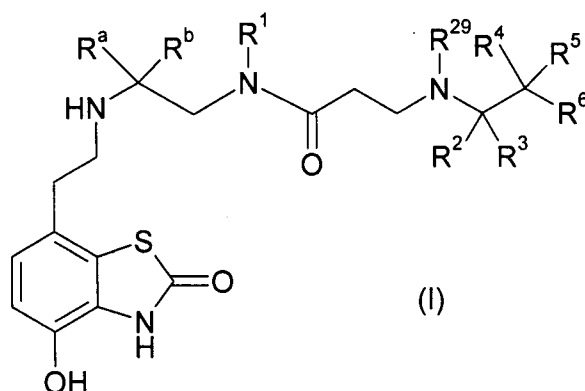
SDN: VEINTICINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula



donde

R^a y R^b son, independientemente, hidrógeno o C_{1-3} alquil; o R^a y R^b , junto con el carbono al cual están unidos, forman un anillo ciclopropil o ciclobutil;

R^1 es: un C_{3-12} alquil α - o β -ramificado (opcionalmente sustituido por halógeno, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} alquilS(O), C_{1-6} alquilS(O)₂, C_{1-6} haloalcoxi, hidroxil, $NR^{26}R^{27}$, $OC(O)(C_{1-6}$ alquil), C_{3-12} cicloalquil o R^{28}), $CH_2(C_{3-12}$ cicloalquil) (el anillo cicloalquil es opcionalmente sustituido por halógeno, C_{1-6} alquil, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} alquilS(O), C_{1-6} alquilS(O)₂, C_{1-6} haloalcoxi, hidroxil, $NR^{26}R^{27}$, $OC(O)(C_{1-6}$ alquil), C_{3-12} cicloalquil o R^{28}), C_{3-12} cicloalquil (opcionalmente sustituido por halógeno, C_{1-6} alquil, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} alquilS(O), C_{1-6} alquilS(O)₂, C_{1-6} haloalcoxi, hidroxil, $NR^{26}R^{27}$, $OC(O)(C_{1-6}$ alquil), C_{3-12} cicloalquil o R^{28}) o R^{28} ;

R^6 es un sistema de anillos aromáticos o heteroaromáticos de 5 a 14 miembros el cual es opcionalmente sustituido por halógeno, hidroxil, carboxil, C_{1-6} alquil (opcionalmente sustituido por halógeno o $-NR^7R^8$), C_{1-6} alcoxi (opcionalmente sustituido por halógeno o $-NR^9R^{10}$), C_{3-6} cicloalquil, C_{1-6} alcocarbonil, $-NR^{11}R^{12}$, C_{1-6} alquilcarbonilamino, C_{1-6} alquilsulfonilamino, fenilsulfonilamino, $-C(O)NHR^{13}$, $-SO_2NHR^{14}$, C_{1-6} alquilS(O)_p (opcionalmente sustituido por halógeno), C_{2-4} alquenil, C_{2-4} alquinil, ciano o C_{0-6} alquil- R^{15} , o un fenil o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros (cada uno de los cuales es opcionalmente sustituido por halógeno, trifluorometil, hidroxil, C_{1-6} alquil, C_{1-6} alcoxi o $-NR^{16}R^{17}$); R^6 puede también ser C_{1-6} haloalquil;

p es 0, 1 ó 2;

R¹³ es hidrógeno, C₁₋₆ alquil, fenil-C₀₋₆ alquil o C₂₋₆ alquileo-NR¹⁸R¹⁹;
ambos R¹⁸ y R¹⁹ son, independientemente, hidrógeno o C₁₋₆ alquil, o R¹⁸ y R¹⁹
junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo heterocíclico
saturado de 4 a 6 miembros que comprende opcionalmente un heteroátomo del
anillo adicional seleccionado de nitrógeno y oxígeno;

R¹⁴ es hidrógeno, C₁₋₆ alquil, fenil-C₀₋₆ alquil o C₂₋₆ alquileo-NR²⁰R²¹;

R¹⁵ es un anillo que contiene nitrógeno de 5 ó 6 miembros saturado;

R², R³, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹⁶, R¹⁷, R²⁶, R²⁷ y R²⁹ son,
independientemente, hidrógeno o C₁₋₆ alquil;

R⁴ es hidrógeno, hidroxilo o C₁₋₆ alquil;

ambos R²⁰ y R²¹ son, independientemente, hidrógeno o C₁₋₆ alquil, o R²⁰ y R²¹
junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo heterocíclico
saturado de 4 a 6 miembros que comprende opcionalmente un heteroátomo del
anillo adicional seleccionado de nitrógeno y oxígeno;

R²⁸ es un heterociclil de 4 a 7 miembros que comprende un nitrógeno
(opcionalmente sustituido por C(O)(C₁₋₆ alquil)), oxígeno o azufre del anillo; el
anillo R²⁸ es opcionalmente sustituido por C₁₋₆ alquil, y los átomos de carbono en
el anillo que no son adyacentes a un heteroátomo del anillo son opcionalmente
sustituidos por halógeno, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alquilS(O), C₁₋₆
alquilS(O)₂, C₁₋₆ haloalcoxi, hidroxilo, NR¹⁸R¹⁹, OC(O)(C₁₋₆ alquil) o C₃₋₁₂
cicloalquil;

o una sal farmacéuticamente aceptable de este.

2. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1 donde
R², R³, R⁴ y R⁵ son todos hidrógeno.

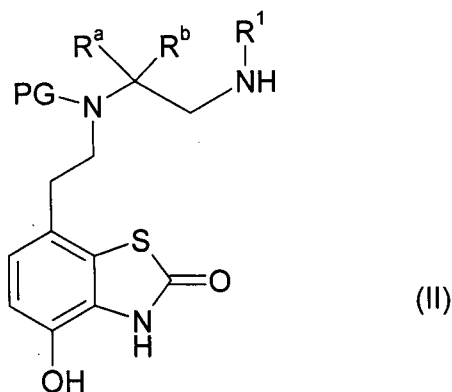
3. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1 ó 2
donde R²⁹ es hidrógeno.

4. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1, 2 ó 3
donde R^a y R^b son ambos hidrógeno.

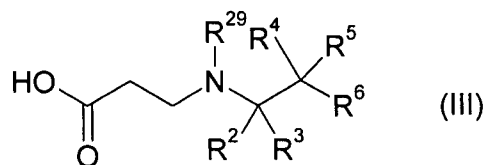
5. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1, 2, 3 ó
4 donde R¹ es C₃₋₆ alquil α - o β -ramificado.

128

6. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1, 2, 3 ó 4 donde R^1 es C_{5-8} cicloalquil opcionalmente sustituido por halógeno o C_{1-4} alquil.
7. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1, 2, 3 ó 4 donde R^1 es ciclopentil, ciclohexil (opcionalmente sustituido por halógeno) o cicloheptil.
8. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde el sistema de anillos aromáticos o heteroaromáticos de 5 a 14 miembros de R^6 es fenil, piridinil, tienil, benzotiazolil o bencimidazolil.
9. Un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R^6 es opcionalmente sustituido por halógeno, hidroxil, C_{1-4} alquil, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalcoxi o $S(O)_2NH_2$.
10. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como el reivindicado en la reivindicación 1, dicho proceso comprende:
- a. acoplar un compuesto de la fórmula (II):

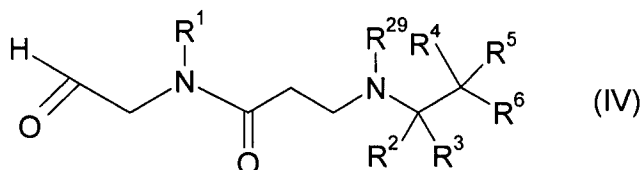


donde PG es un Grupo de Protección adecuado, con un compuesto de la fórmula (III):

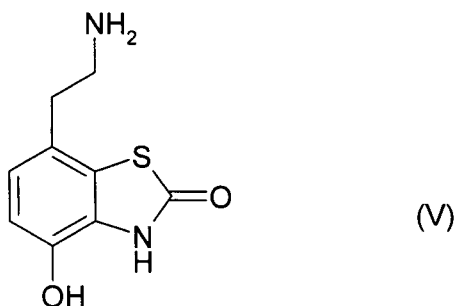


donde R^{29} es C_{1-6} alquil o un Grupo de Protección adecuado; y desproteger el compuesto resultante; o

b. cuando R^a y R^b son ambos hidrógeno, llevar a cabo una aminación reductiva en un compuesto de la fórmula (IV):



donde R^{29} es C_{1-6} alquil o un Grupo de Protección adecuado; con un compuesto de la fórmula (V):



y desproteger el compuesto resultante.

11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de este como el reivindicado en la reivindicación 1 en asociación con un adyuvante, diluyente o portador farmacéuticamente aceptable.
12. Un compuesto de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de este como el reivindicado en la reivindicación 1 para su uso en terapia.
13. Uso de un compuesto de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de este como el reivindicado en la reivindicación 1 en la fabricación de un medicamento para el tratamiento de enfermedades o afecciones humanas en el cual la modulación de la actividad del adrenoreceptor $\beta 2$ es beneficiosa.
14. Uso de un compuesto de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de este como el reivindicado en la reivindicación 1 en la fabricación de un

medicamento para su uso en el tratamiento del síndrome de diestrés respiratorio del adulto (ARDS), enfisema pulmonar, bronquitis, broncoestasia, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), asma o rinitis.

- 5 15. Un método de tratar, o reducir el riesgo de, una enfermedad o afección en la cual la modulación de la actividad del adrenoreceptor $\beta 2$ es beneficiosa que comprende administrar a un paciente en necesidad de este una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de este como el reivindicado en la reivindicación 1.

10

16. Una combinación que comprende un compuesto de la fórmula (I) y uno o más agentes seleccionados de la lista que comprende:

15

- un agonista del receptor glucocorticoide (receptor GR) no esteroide;
- un esteroide;
- un inhibidor PDE4;
- un antagonista del receptor muscarínico;
- un modulador de la función del receptor de la quimioquina; o
- un inhibidor de una función quinasa.



2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
LLOREDA RICAURTE ALICIA
Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA A.B.

REFERENCIA	Radicación No.	9 54440
	Solicitud internacional	PCT/GB2007/004861
	Fecha inicio fase nacional	20/07/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	10430
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

17 0 MAYO 2010

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

jfernand