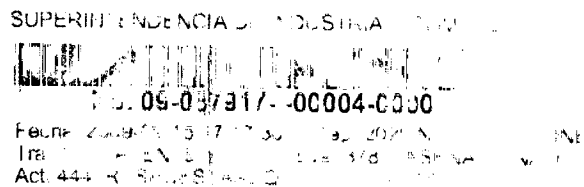


Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____



Ref.: Expediente N° 09-057.917

Solicitud de Patente de Invención Titulada: "COMPUESTOS DE UREA POLICICLICOS ANTIBACTERIANOS"

Solicitante: ASTRAZENECA AB

Nuestra Ref.: P2009/000086

RESPUESTA AL OFICIO N° 8656 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 230, DE FECHA 31 DE JULIO DE 2009,
(EXAMEN DE FORMA)

J. IAN RAISBECK, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito dar respuesta al auto emanado de ese Despacho dentro del término legal previsto en el artículo 12 del Código Contencioso Administrativo en los siguientes términos:

1. En respuesta a la única observación del Examinador, me permito adjuntar un nuevo Capitulo Reivindicatorio Modificado en donde han sido eliminadas las reivindicaciones 3-9, 11, 12, 14, 15, 17, 18, 21-23, 25 Y 28-37 en las nuevas Reivindicaciones 7 y 12 (antiguas 19 y 26) se limitó el sustituyente alquílico a C₁₋₄. En la nueva Reivindicación 8, se especifican los posibles sustituyentes para R⁵.

2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,


J. IAN RAISBECK
C.C. N°. 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799

Anexo: Capitulo Reivindicatorio Modificado
Tasa de Modificación (\$111.000)

337

2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-057917-000004-0000

FECHA: 2009-09-15 17:17:30 Dep. 2020 NUEVA REACCION
No. 11 PATENTE IYII Evt. 378 FASE NACIONAL
P. 1 444 RESPUESTA REQUE Folios 18

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 66,778

FECHA : SEPTIEMBRE 8 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
DLARTE RAISBEK	DEVOLUCION TASA			840	08/09/2009	111,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

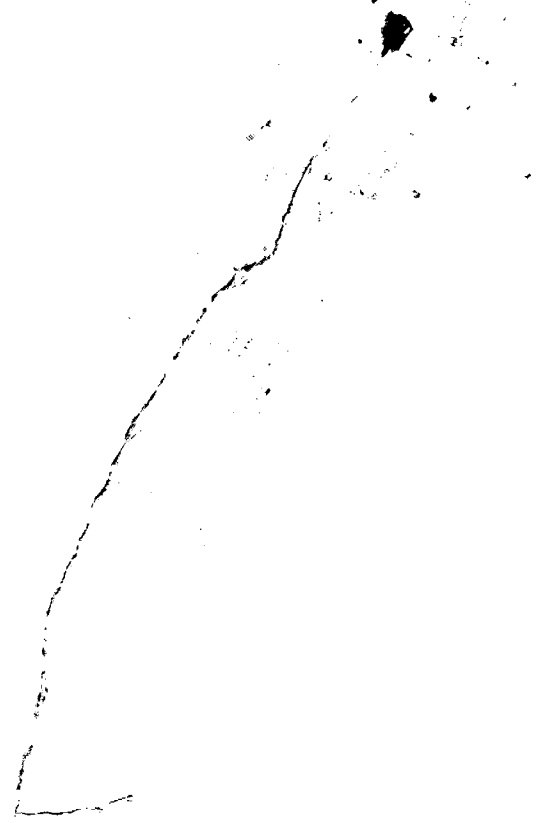
SOM: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

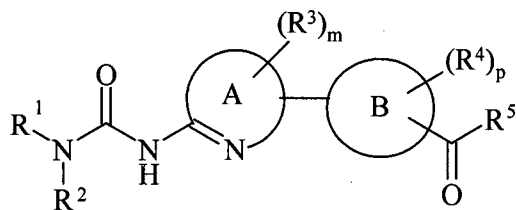
338



3

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de la fórmula (I):



(I)

en donde:

R¹ se selecciona a partir de alquiloC₁₋₆, alqueniloC₂₋₆, alquiniloC₂₋₆ o cicloalquiloC₃₋₆; donde R¹ puede estar opcionalmente sustituido sobre un carbono por uno o más R⁶;

R² se selecciona a partir de hidrogeno o alquiloC₁₋₆; donde dicho alquiloC₁₋₆ se puede sustituir opcionalmente por uno o más grupos independientemente seleccionados a partir de halo, ciano, hidroxilo, nitro y amino;

o R¹ y R² junto con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico, en donde dicho anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido sobre un carbono por uno o más R⁷; y en donde dicho anillo heterocíclico contiene un grupo -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado a partir de R⁸;

R³ y R⁴ son sustituyentes sobre carbono y cada uno independientemente son seleccionados a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquiloC₁₋₆, alqueniloC₂₋₆, alquiniloC₂₋₆, alcoxiloC₁₋₆, alcaniloC₁₋₆, alcaniloC₁₋₆, alcanoiloxiC₁₋₆, N-(alquilC₁₋₆)amino, N,N-(alquilC₁₋₆)₂amino, alcanilaminoC₁₋₆, N-(alquilC₁₋₆)carbamoilo, N,N-(alquilC₁₋₆)₂carbamoilo, N-(alcoxilC₁₋₆)carbamoilo, N,N-(alcoxilC₁₋₆)₂carbamoilo, alquiloC₁₋₆S(O)_a en donde a es 0 a 2, alcoxilcarbonilC₁₋₆, alcoxilcarbonilaminoC₁₋₆, N-(alquilC₁₋₆)sulfamoilo, N,N-(alquilC₁₋₆)₂sulfamoilo, alquiloC₁₋₆sulfonilamino, carbociclilo-R⁹- o heterociclilo-R¹⁰-; donde R³ y R⁴ independientemente el uno del otro se pueden opcionalmente sustituir sobre el carbono por uno o más R¹¹; y en donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R¹²;

m es 0, 1, o 2; en donde los valores de R^3 pueden ser iguales o diferentes;

p es 0, 1, o 2; en donde los valores de R^4 pueden ser iguales o diferentes;

el Anillo A es un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno, donde dicho nitrógeno es =N- y se encuentra en posición orto al grupo $R^1R^2NC(O)NH$ de la fórmula (I); y en donde si dicho grupo heterocíclico contienen una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{13} ;

el Anillo B es un carbociclilo o un heterociclilo; donde dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- dicho nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{14} ;

R^5 se selecciona a partir de hidroxilo, alcoxilo C_{1-6} , $-N(R^{15})(R^{16})$ y un nitrógeno ligado al heterociclilo; donde dicho alcoxilo C_{1-6} puede estar opcionalmente sustituido sobre el carbono por uno o más R^{17} ; y donde si dicho heterociclilo ligado al nitrógeno contiene una fracción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado a partir de R^{18} ;

R^6 , R^7 , R^{11} y R^{17} son sustituyentes sobre el carbono y cada uno es seleccionado independientemente a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alcoxilo C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , alcanoiloxilo C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})amino, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ amino, alcanoilamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ carbamoilo, alquilo C_{1-6} $S(O)_a$ en donde a es 0 a 2, alcóxicarbonilo C_{1-6} , alcóxicarbonilamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})sulfamoilo, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ sulfamoilo, alquilsulfonilamino C_{1-6} , carbociclilo o heterociclilo; donde R^6 , R^7 , R^{11} y R^{17} independientemente pueden estar opcionalmente sustituidos sobre el carbono por uno o más R^{19} ; y donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{20} ;

R^{15} y R^{16} son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alcoxilo C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , carbociclilo o heterociclilo; donde R^{15} y R^{16} independientemente de cada uno se pueden sustituir opcionalmente sobre el carbono por uno o más R^{21} ; y en donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{22} ;

R^8 , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{18} , R^{20} y R^{22} son independientemente seleccionados a partir de alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alcanoilo C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , alcóxicarbonilo C_{1-6} ,

S

carbamoilo, *N*-(alquilC₁₋₆)carbamoilo, *N,N*-(alquilC₁₋₆)carbamoilo, bencilo, benciloxicarbonilo, benzoilo y fenilsulfonilo; donde R⁸, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁸, R²⁰ y R²² independientemente el uno del otro puede ser opcionalmente sustituido sobre el carbono por uno o más R²³;

R⁹ y R¹⁰ son independientemente seleccionados a partir de un enlace directo, -O-, -N(R²⁴)-, -C(O)-, -N(R²⁵)C(O)-, -C(O)N(R²⁶)-, -S(O)_s-, -SO₂N(R²⁷)- o -N(R²⁸)SO₂-; donde R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷ y R²⁸ son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno o alquiloC₁₋₆ y *s* es 0-2; y

R¹⁹, R²¹ y R²³ son independientemente seleccionados a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, trifluorometil, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, metilo, etilo, metoxilo, etoxilo, acetilo, acetoxilo, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, *N*-metil-*N*-etilamino, acetilamino, *N*-metilcarbamoilo, *N*-etilcarbamoilo, *N,N*-dimetilcarbamoilo, *N,N*-dietilcarbamoilo, *N*-metil-*N*-etilcarbamoilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonil, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, *N*-metilsulfamoilo, *N*-etilsulfamoilo, *N,N*-dimetilsulfamoilo, *N,N*-dietilsulfamoilo o *N*-metil-*N*-etilsulfamoilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;

siempre y cuando:

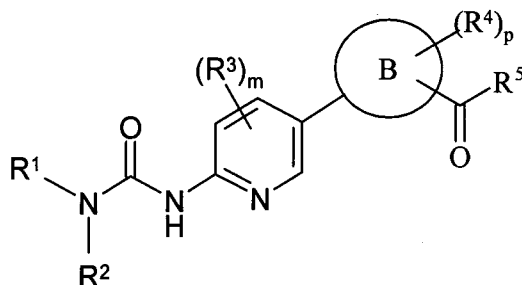
- (a) dicho compuesto no es (i) éster etílico del ácido 5-[2-[[*(etilamino)carbonil*]amino]piridin-4-il]-4-metil-4*H*-1,2,4-triazol-3-carboxílico; (ii) éster metílico del ácido 4-[2-[[*(4-metil-1-piperazinil)carbonil*]amino]-4-tiazolil] benzoico; (iii) ácido 4-((*4E*)-4-{[5-(*dimetilamino*)-2-tienil]metilen}-3-{[(*metilamino*)carbonil]amino}-5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il] benzoico; o (iv) ácido 5-((*4E*)-4-{[5-(*dietilamino*)-2-furil]metilen}-3-{[(*metilamino*)carbonil]amino}-5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]isoftálico;
- (b) cuando el Anillo A es un tiazolilo, R¹ no es un alquiloC₁₋₆ opcionalmente sustituido con un heterociclo u opcionalmente sustituido con un *N*-(alquiloC₁₋₆)carbamoilo; y
- (c) cuando el Anillo A es un tiazolilo, R⁵ no es un morfolino.

2. Un compuesto según la Reivindicación 1 donde el Anillo A se seleccionado a partir del grupo que consta de piridilo, pirimidinilo, y tiazolilo.

351

6

3. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 1 o 2, donde dicho compuesto de fórmula (I) es un compuesto según la fórmula (XV):



(XV)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. Un compuesto de acuerdo a las Reivindicaciones 1-3, donde R^3 se selecciona a partir del grupo que consta de piridilo, fenilo o tiazolilo que pueden estar opcionalmente sustituidos sobre uno o más átomos de carbono por uno o más R^{11} .

5. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 4, donde R^{11} , cada vez que aparezca, se selecciona independientemente del grupo constituido por halo, alquilo C_{1-4} , y un haloalquilo C_{1-4} .

6. Un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, donde R^4 se selecciona del grupo que consta de carbamoilo, un N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, un N,N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, un alcoxilarbonilo C_{1-6} , carboxilo, oxo, hidroxilo, un alquilo C_{1-6} , un alcanoilo C_{1-6} , un N -(alcoxi C_{1-6})carbamoilo, un imidazolilo, y un $1H$ -1,2,4-triazolilo, en donde el N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, alcoxilarbonilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , N -(alcoxi C_{1-6})carbamoilo, imidazolilo, y $1H$ -1,2,4-triazolilo se pueden sustituir opcionalmente sobre uno o más átomos de carbono con uno o más R^{11} ; y

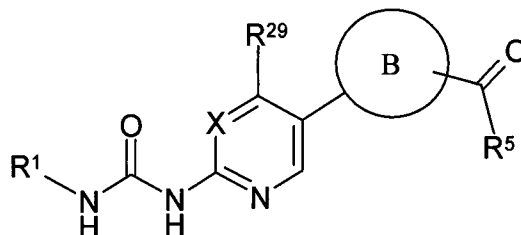
donde el hidrógeno del $-NH-$ del imidazoilo y $1H$ -1,2,4-triazolilo opcionalmente se pueden reemplazar con R^{12} .

7. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 6, donde cada vez que aparezca R^{11} , se selecciona independientemente del grupo que consta de alquilo C_{1-4} , un alcoxilo C_{1-4} , y

342

un alcoxiC₁₋₄alquiloC₁₋₄; y R¹², cada vez que aparezca se selecciona independientemente del grupo que consta de alquiloC₁₋₄ y un alcoxiC₁₋₄alquiloC₁₋₄.

8. Un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, donde dicho compuesto es un compuesto según la fórmula (XVIII):



(XVIII)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde:

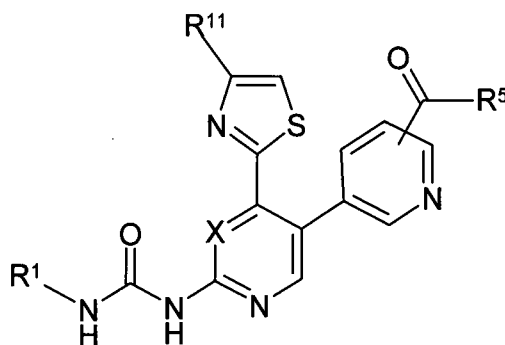
X es CH o N;

el Anillo B es seleccionado de un grupo constituido por tiazolilo, piridilo, 1,3-benzotiazolilo, fenilo, imidazo[1,2-a]piridinil, 4-oxo-1*H*-quinolinil, y 2-oxo-1*H*-piridilo;

R⁵ es hidroxilo, amino, a alcoxiC₁₋₄, un *N*-(alquilC₁₋₄)amino, an *N,N*-(alquilC₁₋₄)amino, o un *N*-(cicloalquilC₃₋₆)amino, donde el alcoxiC₁₋₄ esta opcionalmente sustituido en uno o más átomos de carbono con uno o más R¹⁷; y donde *N*-(alquilC₁₋₄)amino, *N,N*-(alquilC₁₋₄)amino, o *N*-(cicloalquilC₃₋₆)amino puede estar opcionalmente sustituido en uno o más átomos de carbono por uno o más R¹⁹; y

R²⁹ se selecciona de un grupo que consta de piridilo, tiazolilo, y fenilo, donde el piridilo, tiazolilo, o fenilo pueden ser opcionalmente sustituidos en uno o más carbonos por uno o más R¹¹; y donde si R²⁹ es un piridilo o tiazolilo, el hidrógeno de la fracción -NH- puede ser sustituido opcionalmente por un grupo a partir de R⁸.

9. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 8, en donde dicho compuesto es un compuesto según la fórmula (XIX):



(XIX)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 9, donde R¹¹ es un halo, un alquiloC₁₋₄, o un haloalquiloC₁₋₄.
11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un excipiente o vehículo farmacéuticamente aceptable.
12. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en la producción de un efecto anti-bacterial en un animal de sangre caliente.
13. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en la inhibición de la ADN girasa bacteriana y/o topoisomerasa IV en un animal de sangre caliente.
14. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento de una infección bacteriana en un animal de sangre caliente.
15. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento de neumonía adquirida en la comunidad, neumonía adquirida en el hospital, infecciones dermatológicas y de la estructura cutánea, exacerbaciones agudas de bronquitis crónica,

sinusitis aguda, otitis media aguda, sepsis relacionada con el catéter, neutropenia febril, osteomielitis, endocarditis, infecciones del tracto urinario, *Streptococcus pneumoniae* penicilina resistente, *Staphylococcus aureus* meticilino resistente, *Staphylococcus epidermidis* meticilino resistente o *Enterococci* resistente a vancomicina.

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS REIVINDICACIONES

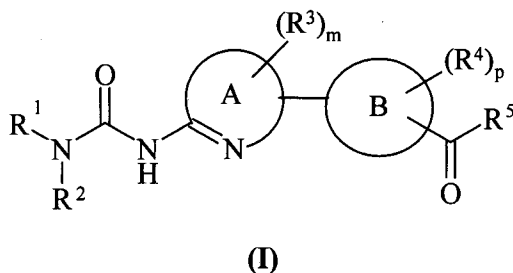
Se eliminaron las Reivindicaciones 3-9, 11, 12, 14, 15, 17, 18, 21-23, 25 y 28-37.

En las nuevas Reivindicaciones 7 y 12 (antiguas 19 y 26) se limitó el sustituyente alquílico a C₁₋₄.

En la nueva Reivindicación 8, se especifican los posibles sustituyentes para R⁵.

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

1. Un compuesto de la fórmula (I):



en donde:

R^1 se selecciona a partir de alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} o cicloalquilo C_{3-6} ; donde R^1 puede estar opcionalmente sustituido sobre un carbono por uno o más R^6 ;

R^2 se selecciona a partir de hidrogeno o alquilo C_{1-6} ; donde dicho alquilo C_{1-6} se puede sustituir opcionalmente por uno o más grupos independientemente seleccionados a partir de halo, ciano, hidroxilo, nitro y amino;

o R^1 y R^2 junto con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo heterocíclico, en donde dicho anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido sobre un carbono por uno o más R^7 ; y en donde dicho anillo heterocíclico contiene un grupo -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado a partir de R^8 ;

R^3 y R^4 son sustituyentes sobre carbono y cada uno independientemente son seleccionados a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alcoxilo C_{1-6} , alcanilo C_{1-6} , alcanilo C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})amino, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ amino, alcaniloamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ carbamoilo, N -(alcoxil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(alcoxil C_{1-6}) $_2$ carbamoilo, alquilo C_{1-6} S(O) $_a$ en donde a es 0 a 2, alcoxilcarbonil C_{1-6} , alcoxilcarbonilamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})sulfamoilo, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ sulfamoilo, alquilo C_{1-6} sulfonilamino, carbociclilo- R^9 - o heterociclilo- R^{10} -; donde R^3 y R^4 independientemente el uno del otro se pueden opcionalmente sustituir sobre el carbono por uno o más R^{11} ; y en donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{12} ;

m es 0, 1, o 2; en donde los valores de R^3 pueden ser iguales o diferentes;

p es 0, 1, o 2; en donde los valores de R^4 pueden ser iguales o diferentes;

el Anillo A es un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno, donde dicho nitrógeno es =N- y se encuentra en posición orto al grupo $R^1R^2NC(O)NH$ de la fórmula (I); y en donde si dicho grupo heterocíclico contienen una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{13} ;

el Anillo B es un carbociclilo o un heterociclilo; donde dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- dicho nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{14} ;

R^5 se selecciona a partir de hidroxilo, alcoxilo C_{1-6} , $-N(R^{15})(R^{16})$ y un nitrógeno ligado al heterociclilo; donde dicho alcoxilo C_{1-6} puede estar opcionalmente sustituido sobre el carbono por uno o más R^{17} ; y donde si dicho heterociclilo ligado al nitrógeno contiene una fracción -NH- ese nitrógeno puede estar opcionalmente sustituido por un grupo seleccionado a partir de R^{18} ;

R^6 , R^7 , R^{11} y R^{17} son sustituyentes sobre el carbono y cada uno es seleccionado independientemente a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, alquilo C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alcoxilo C_{1-6} , alcanilo C_{1-6} , alcaniloxilo C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})amino, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ amino, alcanilamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(C_{1-6} alquil) $_2$ carbamoilo, alquilo C_{1-6} $S(O)_a$ en donde a es 0 a 2, alcoxicarbonilo C_{1-6} , alcoxicarbonilamino C_{1-6} , N -(alquil C_{1-6})sulfamoilo, N,N -(alquil C_{1-6}) $_2$ sulfamoilo, alquilsulfonilamino C_{1-6} , carbociclilo o heterociclilo; donde R^6 , R^7 , R^{11} y R^{17} independientemente pueden estar opcionalmente sustituidos sobre el carbono por uno o más R^{19} ; y donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{20} ;

R^{15} y R^{16} son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno, alquilo C_{1-6} , alcoxilo C_{1-6} , alcanilo C_{1-6} , carbociclilo o heterociclilo; donde R^{15} y R^{16} independientemente de cada uno se pueden sustituir opcionalmente sobre el carbono por uno o más R^{21} ; y en donde si dicho heterociclilo contiene una fracción -NH- ese nitrógeno se puede sustituir opcionalmente por un grupo seleccionado a partir de R^{22} ;

R^8 , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{18} , R^{20} y R^{22} son independientemente seleccionados a partir de alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , alcanilo C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , alcoxicarbonilo C_{1-6} ,

B

carbamoilo, *N*-(alquiloC₁₋₆)carbamoilo, *N,N*-(alquiloC₁₋₆)carbamoilo, bencilo, benciloxicarbonilo, benzoilo y fenilsulfonilo; donde R⁸, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁸, R²⁰ y R²² independientemente el uno del otro puede ser opcionalmente sustituido sobre el carbono por uno o más R²³;

R⁹ y R¹⁰ son independientemente seleccionados a partir de un enlace directo, -O-, -N(R²⁴)-, -C(O)-, -N(R²⁵)C(O)-, -C(O)N(R²⁶)-, -S(O)_s-, -SO₂N(R²⁷)- o -N(R²⁸)SO₂-; donde R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷ y R²⁸ son independientemente seleccionados a partir de hidrógeno o alquiloC₁₋₆ y *s* es 0-2; y

R¹⁹, R²¹ y R²³ son independientemente seleccionados a partir de halo, nitro, ciano, hidroxilo, trifluorometoxi, trifluorometil, amino, carboxilo, carbamoilo, mercapto, sulfamoilo, metilo, etilo, metoxilo, etoxilo, acetilo, acetoxilo, metilamino, etilamino, dimetilamino, dietilamino, *N*-metil-*N*-etilamino, acetilamino, *N*-metilcarbamoilo, *N*-etilcarbamoilo, *N,N*-dimetilcarbamoilo, *N,N*-dietilcarbamoilo, *N*-metil-*N*-etilcarbamoilo, metiltio, etiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, mesilo, etilsulfonil, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *N*-metilsulfamoilo, *N*-etilsulfamoilo, *N,N*-dimetilsulfamoilo, *N,N*-dietilsulfamoilo o *N*-metil-*N*-etilsulfamoilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;

siempre y cuando:

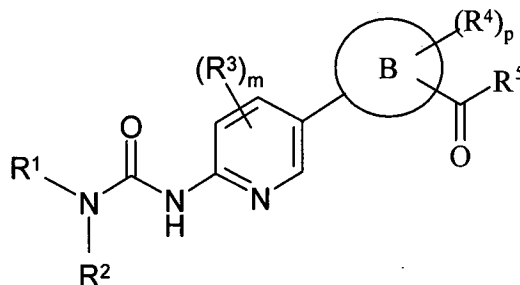
- (a) dicho compuesto no es (i) éster etílico del ácido 5-[2-[[[(etilamino)carbonil]amino]piridin-4-il]-4-metil-4*H*-1,2,4-triazol-3-carboxílico; (ii) éster metílico del ácido 4-[2-[[[(4-metil-1-piperazinil)carbonil]amino]-4-tiazolil] benzoico; (iii) ácido 4-((4*E*)-4-{[5-(dimetilamino)-2-tienil]metilen}-3-{[(metilamino)carbonil]amino}-5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il) benzoico; o (iv) ácido 5-((4*E*)-4-{[5-(dietilamino)-2-furil]metilen}-3-{[(metilamino)carbonil]amino}-5-oxo-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)isoftálico;
- (b) cuando el Anillo A es un tiazolilo, R¹ no es un alquiloC₁₋₆ opcionalmente sustituido con un heterociclo u opcionalmente sustituido con un *N*-(alquiloC₁₋₆)carbamoilo; y
- (c) cuando el Anillo A es un tiazolilo, R⁵ no es un morfolino.

2. Un compuesto según la Reivindicación 1 donde el Anillo A se seleccionado a partir del grupo que consta de piridilo, pirimidinilo, y tiazolilo.

349

14

3. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 1 o 2, donde dicho compuesto de fórmula (I) es un compuesto según la fórmula (XV):



(XV)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. Un compuesto de acuerdo a las Reivindicaciones 1-3, donde R^3 se selecciona a partir del grupo que consta de piridilo, fenilo o tiazolilo que pueden estar opcionalmente sustituidos sobre uno o más átomos de carbono por uno o más R^{11} .

5. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 4, donde R^{11} , cada vez que aparezca, se selecciona independientemente del grupo constituido por halo, alquilo C_{1-4} , y un haloalquilo C_{1-4} .

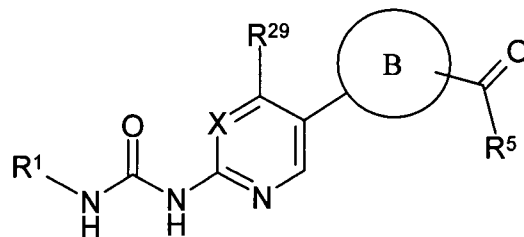
6. Un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1-5, donde R^4 se selecciona del grupo que consta de carbamoilo, un N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, un N,N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, un alcoxilarbonilo C_{1-6} , carboxilo, oxo, hidroxilo, un alquilo C_{1-6} , un alcanoilo C_{1-6} , un N -(alcoxi C_{1-6})carbamoilo, un imidazolilo, y un 1H-1,2,4-triazolilo, en donde el N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, N,N -(alquil C_{1-6})carbamoilo, alcoxilarbonilo C_{1-6} , alquilo C_{1-6} , alcanoilo C_{1-6} , N -(alcoxi C_{1-6})carbamoilo, imidazolilo, y 1H-1,2,4-triazolilo se pueden sustituir opcionalmente sobre uno o más átomos de carbono con uno o más R^{11} ; y

donde el hidrógeno del-NH- del imidazoilo y 1H-1,2,4-triazolilo opcionalmente se pueden reemplazar con R^{12} .

7. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 6, donde cada vez que aparezca R^{11} , se selecciona independientemente del grupo que consta de alquilo C_{1-4} , un alcoxilo C_{1-4} , y

un alcoxiC₁₋₄alquiloC₁₋₄; y R¹², cada vez que aparezca se selecciona independientemente del grupo que consta de alquiloC₁₋₄ y un alcoxiC₁₋₄alquiloC₁₋₄.

8. Un compuesto de acuerdo a cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, donde dicho compuesto es un compuesto según la fórmula (XVIII):



(XVIII)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo donde:

X es CH o N;

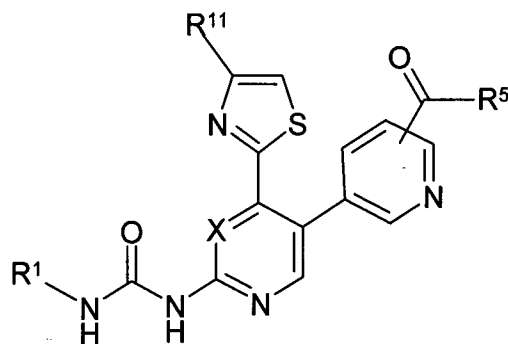
el Anillo B es seleccionado de un grupo constituido por tiazolilo, piridilo, 1,3-benzotiazolilo, fenilo, imidazo[1,2-a]piridinil, 4-oxo-1H-quinolinil, y 2-oxo-1H-piridilo;

R⁵ es hidroxilo, amino, a alcoxiC₁₋₄, un N-(alquilC₁₋₄)amino, an N,N-(alquilC₁₋₄)amino, o un N-(cicloalquilC₃₋₆)amino, donde el alcóxiloC₁₋₄ esta opcionalmente sustituido en uno o más átomos de carbono con uno o más R¹⁷; y donde N-(alquilC₁₋₄)amino, N,N-(alquilC₁₋₄)amino, o N-(cicloalquilC₃₋₆)amino puede estar opcionalmente sustituido en uno o más átomos de carbono por uno o más R¹⁹; y

R²⁹ se selecciona de un grupo que consta de piridilo, tiazolilo, y fenilo, donde el piridilo, tiazolilo, o fenilo pueden ser opcionalmente sustituidos en uno o más carbonos por uno o más R¹¹; y donde si R²⁹ es un piridilo o tiazolilo, el hidrógeno de la fracción -NH- puede ser sustituido opcionalmente por un grupo a partir de R⁸.

9. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 8, en donde dicho compuesto es un compuesto según la fórmula (XIX):

16



(XIX)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. Un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 9, donde R¹¹ es un halo, un alquiloC₁₋₄, o un haloalquiloC₁₋₄.
11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un excipiente o vehículo farmacéuticamente aceptable.
12. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en la producción de un efecto anti-bacterial en un animal de sangre caliente.
13. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en la inhibición de la ADN girasa bacteriana y/o topoisomerasa IV en un animal de sangre caliente.
14. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento de una infección bacteriana en un animal de sangre caliente.
15. Un compuesto según cualquiera de la Reivindicaciones 1 a 10, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento de neumonía adquirida en la comunidad, neumonía adquirida en el hospital, infecciones dermatológicas y de la estructura cutánea, exacerbaciones agudas de bronquitis crónica,

352



sinusitis aguda, otitis media aguda, sepsis relacionada con el catéter, neutropenia febril, osteomielitis, endocarditis, infecciones del tracto urinario, *Streptococcus pneumoniae* penicilina resistente, *Staphylococcus aureus* meticilino resistente, *Staphylococcus epidermidis* meticilino resistente o *Enterococci* resistente a vancomicina.



18

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS REIVINDICACIONES

Se eliminaron las Reivindicaciones 3-9, 11, 12, 14, 15, 17, 18, 21-23, 25 y 28-37.

En las nuevas Reivindicaciones 7 y 12 (antiguas 19 y 26) se limitó el sustituyente alquílico a C₁₋₄.

En la nueva Reivindicación 8, se especifican los posibles sustituyentes para R⁵.



2020

Bogotá D.C.,

Doctor(a)

RAISBECK J. IAN

Apoderado(a) y/o Representante de
ASTRAZENECA AB

REFERENCIA	Radicación No.	9 57917
	Solicitud internacional	PCT/GB2007/004624
	Fecha inicio fase nacional	04/07/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	10701
	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,

23 JUN. 2019

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

jfernand