

82

REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para la preparación de 5-cloro-*N*-({(5*S*)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofenocarboxamida de fórmula (I) mediante reacción de clorhidrato de 4-{4-[(5*S*)-5-(aminometil)-2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il]fenil}morfolin-3-ona (VII) con cloruro de 5-clorotiofeno-2-carbonilo (IV), caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en un disolvente seleccionado del grupo de éter, alcohol, cetona y agua o en una mezcla de los mismos usando una base inorgánica.
2. Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en una cetona o una mezcla de cetona y agua como disolvente.
3. Procedimiento según la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo con hidróxido de sodio, carbonato de sodio o hidrogenocarbonato de sodio como base inorgánica.
4. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en una mezcla de acetona/agua como disolvente usando carbonato de sodio como base.
5. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque se dispone una disolución acuosa de carbonato de sodio y se realiza la adición de los reactantes a una temperatura entre 10 y 15°C, y la mezcla de reacción se sigue agitando después a 50°C.
6. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque el producto bruto así obtenido del compuesto de fórmula (I) se recristaliza con ácido acético en una etapa posterior.
7. Procedimiento según una de las reivindicaciones 1 a 6, en el que se prepara clorhidrato de aminometiloxazolidinona (VII) mediante escisión del grupo protector ftalimida de oxazolidinonmetilftalimida (VI) con metilamina en etanol como disolvente, caracterizado porque la aminometiloxazolidinona (VII) se aísla como sustancia en forma de clorhidrato.
8. Procedimiento según la reivindicación 7, caracterizado porque después de realizada la reacción de oxazolidinonmetilftalimida (VI) con metilamina, se añade ácido clorhídrico acuoso a una temperatura entre 50 y 60°C a la mezcla de reacción hasta un valor de pH entre 2 y 3.

9. Procedimiento según una de las reivindicaciones 7 u 8, en el que se prepara oxazolidinonmetilftalimida (VI) mediante ciclación del compuesto de hidroxiamino (V) con un equivalente de fosgeno, caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en tolueno como disolvente.

10. Procedimiento según la reivindicación 9, caracterizado porque la oxazolidinonmetilftalimida (VI) se aísla mediante filtración.

11. Procedimiento según una de las reivindicaciones 9 ó 10, en el que se prepara la hidroxiamina (V) mediante reacción de (S)-epoxiftalmida (II) con anilinomorfolinona (III) en etanol acuoso como disolvente, caracterizado porque la relación etanol/agua asciende a 1:2.

12. Procedimiento según la reivindicación 11, caracterizado porque la mezcla de reacción se mezcla después de una a dos horas de duración de reacción con cristales de siembra del producto de reacción (V).

13. Procedimiento según la reivindicación 12, caracterizado porque la mezcla de reacción se calienta a reflujo hacia el final del tiempo de reacción dos veces, y a continuación se enfría de nuevo la temperatura de reacción a entre 55 y 65°C respectivamente.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 72,102
FECHA : AGOSTO 30 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-066497- -00006-0000

Fecha: 2010-09-01 17:00:26 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 467 SOLICIPRORROGA Folios: 8

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325663435	30/08/2010	20,351,000.00

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

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-08 PRORROGA DE TERMINOS	*** N.CREACION PRORROGA DE TERMINOS 0	83,000.00
	TOTAL :	\$ 83,000.00

SON: OCHENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO: 15846-845-015-6.

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

Radicación No. 06 66497

Clasificación Internacional (IPC): A 61K 31/16

Concepto Técnico No. 0002

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (fase nacional)

☒

Cap. I

☒

Cap. II

☐

No. Sol. Internacional

PCT/EP2004/014870

Fecha de Presentación Internal.

31/12/2004

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios 24 – 35
- 1.2. Rta Solicitante: Folios 78 – 80
- 1.3. Reivindicaciones: Folios 83 – 84
- 1.4. Prioridad: Presentada en Alemania, el 15.01.04, bajo el número 102004002044.2

PCT/EP2004/014870
31/12/2004

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "Procedimiento de preparación".

Según las reivindicaciones 1-13 se refiere a un procedimiento de síntesis de 5-cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofenocarboxamida, mediante la reacción de clorhidrato de 4-{4-[(5S)-5-(aminometil)-2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il]fenil}morfolin-3-ona con cloruro de 5-clorotiofeno-2-carbonilo en donde la reacción se realiza en un disolvente seleccionado de éter, alcohol, cetona y agua usando una base inorgánica.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de un procedimiento de síntesis de 5-cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofenocarboxamida que sea sencillo.

Presentada en Alemania
1020040020
PCT/EP2004/014870
31/12/2004