

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____

S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-123852- -00003-0000

Fecha: 2010-02-08 10:32:28 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 8

Ref: Expediente N° 09-123.852

Solicitud de Patente de Invención Titulada: "DERIVADOS DE 6-AMINO-5-
ARIL PIRIDINA-2IL-CARBOXAMIDA"

Solicitante: PFIZER LIMITED

Nuestra Ref.: P2009/000178

RESPUESTA AL OFICIO N° 14368 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 372, DE FECHA 11 DE DICIEMBRE DE 2009,
(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, 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 al presente memorial un Capítulo Reivindicatorio Modificado en el cual se han eliminado las Reivindicaciones originales 12, 13, 14, 15, 16, 17 y 18, quedando así un total de 12 reivindicaciones para consideración en el examen de fondo.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Adjunto: Capítulo Reivindicatorio (con eliminaciones señaladas)

2

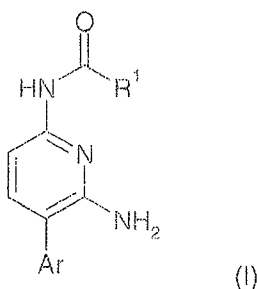
REIVINDICACIONES

RESPUESTA AL OFICIO No. 14368 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA No.

372 DE FECHA 11 DE DICIEMBRE DE 2009

(EXAMEN DE FORMA)

1. Un compuesto de la fórmula (I):



o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en la que

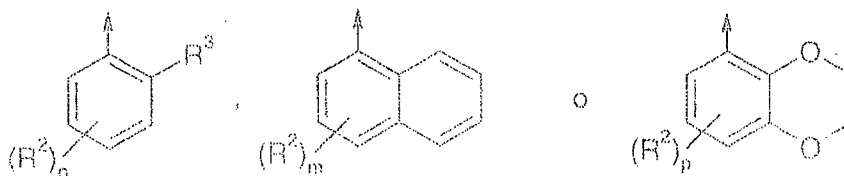
R^1 se selecciona entre:

(i) fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados cada uno de ellos independientemente entre halo, ciano, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), halo alcoxi (C_1-C_4), alcoxi(C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4) amino y di- (alquil (C_1-C_4)) amino; y

(ii) un grupo heteroarilo de 5 miembros que comprende o bien (a) entre 1 y 4

átomos de nitrógeno o (b) un átomo de oxígeno o uno de azufre y 1 ó 2 átomos de nitrógeno, y en la que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado entre alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), halo alcoxi (C_1-C_4), alcoxi(C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), alquil (C_1-C_4) amino y di-(alquil (C_1-C_4)) amino, con la condición de que R^1 no sea imidazolilo, oxazolilo o 1,2,4-triazolilo.

Ar es



en la que $\rightarrow$ indica el punto de unión al anillo de la piridina;

cada R^2 es independientemente alquilo (C_1-C_4), OR^4 , alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), ciano o halo;

n es 0 a 4;

m es 0 a 7;

p es 0 a 3;

568

3

R^3 es hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), OR^4 , alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), ciano o halo;

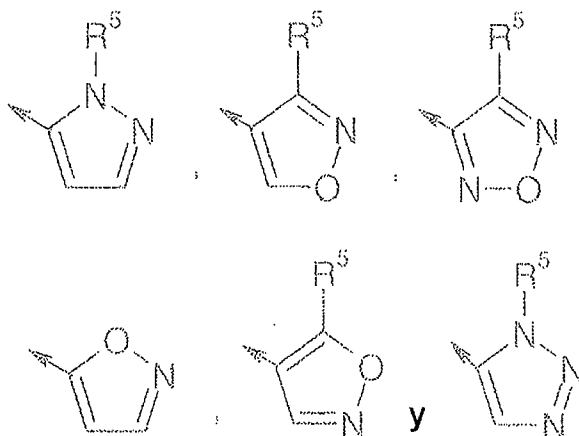
R^4 es hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquil (C_3-C_6) alquilo (C_1-C_4), Het^1 - o Het^1 alquilo (C_1-C_4); y Het^1 es un anillo heterocíclico saturado de 5 ó 6 miembros que comprende un átomo de oxígeno.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que R^1 se selecciona entre:

(i) fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes cada uno de ellos seleccionado independientemente entre halo, ciano, alquilo (C_1-C_4) alcoxi (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), o alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4); o

(ii) un grupo heteroarilo de 5 miembros seleccionado entre pirazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, y 1,2,3-triazolilo, estando cada uno de ellos opcionalmente sustituido con alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), o alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4).

3. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o Reivindicación 2, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que R^1 es un grupo heteroarilo de 5 miembros seleccionado entre



en el que $\rightarrow$ indica el punto de unión al resto carbonilo y en el que R^5 es alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), o alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4).

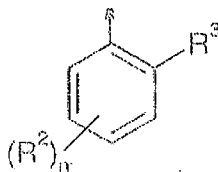
4. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 3 o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que R^5 es metilo, etilo, isopropilo, metoximetilo, o trifluorometilo.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que

569

24

Ar es



6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que cada R^2 se selecciona independientemente entre alquilo (C_1-C_4), OR^4 , alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4) y halo; y en el que R^4 es hidrógeno, alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquil (C_3-C_6) alquilo (C_1-C_4).

7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que cada R^2 se selecciona independientemente entre metilo, etilo, propilo, hidroxilo, metoxi, etoxi, propoxi, butoxi, ciclopropiloxi, metoximetilo, metoxietoxi, metoxipropoxi, ciclopropilmetoxi, difluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, cloro y fluoro.

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que R^3 es alquilo (C_1-C_4), OR^4 , alcoxi (C_1-C_4) alquilo (C_1-C_4), halo alquilo (C_1-C_4), ciano o halo.

9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que R^3 es metilo, etilo, propilo, hidroxilo, metoxi, etoxi, propoxi, butoxi, ciclopropiloxi, metoximetilo, metoxietoxi, metoxipropoxi, ciclopropilmetoxi, difluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, cloro o fluoro.

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9 que se selecciona entre:

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida,

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(7-cloro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-5-il)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-cloro-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-cloro-5-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-

9

carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-1-etil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-1-isopropil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(5-fluoro-2-propoxifenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-cloro-2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-amino-5-[2-(ciclopropiloxi)-5-fluorofenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida ;

N-{6-amino-5-[2-(ciclopropiloxi)-5-fluorofenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2,5-diclorofenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2,3,5-triclorofenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2,3-dicloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2,5-dicloro-3-metoxifenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2,4-diclorofenil)piridin-2-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-cloro-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-5-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-(2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-5-metilisoxazol-4-carboxamida;

6

N-[6-Amino-5-[2-clorofenil]piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2,5-dicloro-3-metoxifenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2,3,5-triclorofenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[2-(difluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(trifluorometil)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-3-(metoximetil)isoxazol-4-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[2-(difluorometil)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2,5-dicloro-3-metoxifenil)piridin-2-il]-4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-1-etil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-1-etil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-etil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[5-cloro-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-etil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-1-isopropil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-1-isopropil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-isopropil-1H-pirazol-5-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-3-(metoximetil)isoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-3-(metoximetil)isoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-5-(metoximetil)isoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-fluorofenil)piridin-2-il]-5-(metoximetil)isoxazol-4-carboxamida;
N-[6-Amino-5-(2-clorofenil)piridin-2-il]-3-(trifluorometil)isoxazol-4-carboxamida;

572

N-{6-Amino-5-[2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-3-(trifluorometil)isoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-metoxifenil)piridin-2-il]-3-(trifluorometil)isoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida,

N-{6-Amino-5-[2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-5-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-etoxi-5-fluorofenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-metoxi-2-(trifluorometoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[2-(2,2,2-trifluoroetil)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-[6-Amino-5-(2-cloro-5-etoxifenil)piridin-2-il]-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-cloro-2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-1-metil-1H-pirazol-5-carboxamida;

N-{6-Amino-5-[5-fluoro-2-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]piridin-2-il}-3-metilisoxazol-4-carboxamida;

y sus sales y solvatos farmacéuticamente aceptables.

11. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto de la fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, junto con uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.

~~12. [ELIMINADA] Un compuesto de la fórmula (I), o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, para uso como un medicamento.~~

~~13. [ELIMINADA] El uso de un compuesto de la fórmula (I), o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad o afección para la que está indicado un modulador de los canales de Na_{v1.8}.~~

573



~~14. [ELIMINADA] Uso de acuerdo con la Reivindicación 13 en el que la enfermedad o afección es dolor.~~

~~15. [ELIMINADA] Un procedimiento de tratamiento de una enfermedad o afección para la que está indicado un modulador de los canales de $Na_{v1.8}$ en un mamífero, incluyendo un ser humano, que incluye la administración a un mamífero que requiere tal tratamiento de una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula (I), o su sal, solvato o composición farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 y 11 respectivamente.~~

~~16. [ELIMINADA] Un procedimiento de acuerdo con la Reivindicación 15 en el que la enfermedad o afección es dolor.~~

~~17. [ELIMINADA] Un compuesto de la fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, para uso en el tratamiento de una enfermedad o afección para la que está indicado un modulador de los canales de $Na_{v1.8}$.~~

~~18. [ELIMINADA] Un compuesto de la fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, para uso en el tratamiento de dolor.~~

12. [ANTIGUA 19] Una combinación de un compuesto de la fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, como se ha definido en una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, y otro agente farmacológicamente activo.
