

JOSE LLOREDA CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COM
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional
PCT para "COMPUESTOS NUEVOS 951: UN ÁCIDO
BIFENILOXIPROPANOICO COMO MODULADOR DE CRTH2 E
INTERMEDIOS".-Clase C07D 295/18.-Expediente número 10-001.081.-

1. Me refiero al Oficio No. **3005** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 5 de Marzo de 2010.

2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar los recibos de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 11 a 12 y 19 a 24, estas últimas se han reenumerado como las nuevas reivindicaciones números 13 a 18. En consecuencia, este juego de reivindicaciones deberá ser estudiado junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

(a) Recibos números 10-24,546, 09-97,071, 10-30,019, 10-30,020 y 10-30,021 que acreditan el pago de la tasa mencionada; y

(b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por 18 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 : 10 - 24,546
FECHA : ABRIL 5 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	52796984	05/04/2010	4,383,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		83 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN SI	155,000.00
		TOTAL :	\$ 155,000.00

SON: CIENTO CINCUENTA Y CINCO MIL PESOS

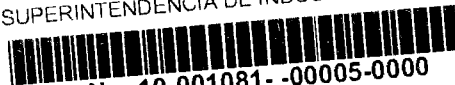
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 8001.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 97,071
FECHA : DICIEMBRE 23 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	36907905	23/12/2009	19,160,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	50,000.00
		TOTAL :	50,000.00

SON: CINCUENTA 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.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 30,019
FECHA : ABRIL 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA'S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	52797264	19/04/2010	24,584,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: 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.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 30,020
FECHA : ABRIL 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	042754387	52797264	19/04/2010	24,584,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

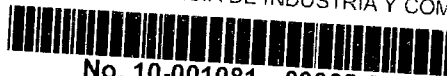
ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 30,021
FECHA : ABRIL 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001081- -00005-0000

Fecha: 2010-04-27 16:48:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A.	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	52797264	19/04/2010	24,584,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: MIL PESOS

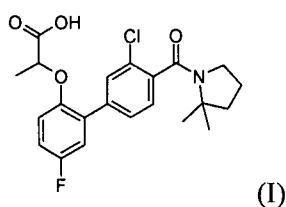
RESPONSABLE : _____

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.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



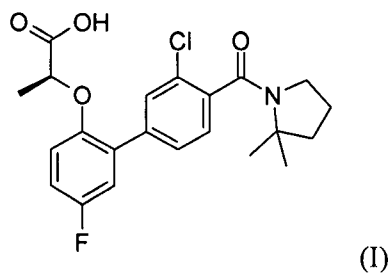
como una mezcla de ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico y ácido (2*R*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico,

o solvatos de estos o sales farmacéuticamente aceptables de estos o solvatos de sales farmacéuticamente aceptables.

2. Una mezcla de acuerdo con la reivindicación 1 en la que el ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico está presente al menos en un 95%.

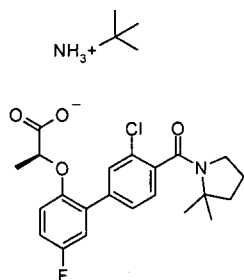
3. Una mezcla de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 en la que el ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico y el ácido (2*R*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico están en forma de la sal de 2-metilpropan-2-amina.

4. Un compuesto de fórmula (I):



o un solvato de este o una sal farmacéuticamente aceptable de este o un solvato de una sal farmacéuticamente aceptable.

- 5 5. Una sal de amina de un compuesto de fórmula (I) como se define en la reivindicación 4.
6. Una sal de acuerdo con la reivindicación 5 que es la sal del ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico y 2-
- 10 metilpropan-2-amina:



7. Una forma cristalina del compuesto: sal del ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico y 2-metilpropan-2-
- 15 amina, caracterizada por un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos en al menos uno de los siguientes valores de 2-theta medidos utilizando radiación CuKα: 14.6, 17.4 y 21.1.
8. Una forma cristalina del compuesto: sal del ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico y 2-metilpropan-2-
- 20 amina, caracterizada por un patrón de difracción de rayos X en polvo sustancialmente como el que se muestra en la Figura 1.
9. Una forma cristalina del compuesto: ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico, caracterizada por un
- 25

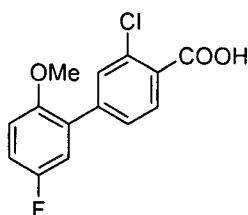
patrón de difracción de rayos X en polvo con picos en al menos uno de los siguientes valores de 2-theta medidos utilizando radiación CuK α : 15.0, 19.2 y 21.4.

10. Una forma cristalina del compuesto: ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico, caracterizada por un patrón de difracción de rayos X en polvo sustancialmente como el que se muestra en la Figura 2.

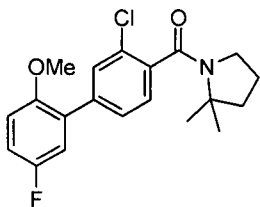
11. Una forma cristalina del compuesto: ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico, caracterizada por un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos en al menos uno de los siguientes valores de 2-theta medidos utilizando radiación CuK α : 10.6, 13.2 y 15.1.

12. Una forma cristalina del compuesto: ácido (2*S*)-2-({3'-cloro-4'-[(2,2-dimetilpirrolidin-1-il)carbonil]-5-fluorobifenil-2-il}oxi)propanoico, caracterizada por un patrón de difracción de rayos X en polvo sustancialmente como el que se muestra en la Figura 3.

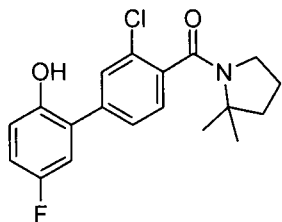
13. Un compuesto de fórmula (1a):



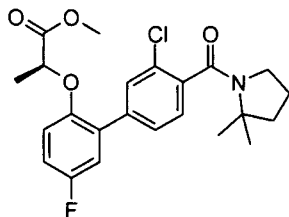
14. Un compuesto de fórmula (1c):



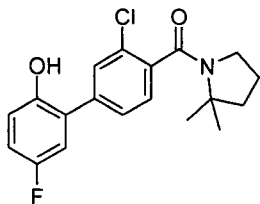
15. Un compuesto de fórmula (1d):



16. Un compuesto de fórmula (1f):

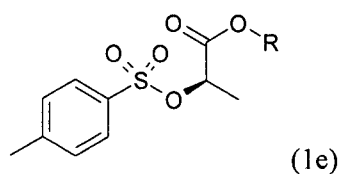


17. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) que comprende:
hacer reaccionar un compuesto de fórmula (1d):



(1d)

con un compuesto de fórmula (1e):



en la cual R es un grupo que forma ésteres, seguido de la desesterificación del derivado
resultante y con la formación opcional de una sal farmacéuticamente aceptable, solvato o
5 solvato de una sal.

18. Un producto farmacéutico que comprende, combinados, un primer principio activo
el cual es un compuesto de la fórmula (I) como se define en cualquiera de las
reivindicaciones 1 a 6 y al menos otro principio activo seleccionado entre uno o más de:
- 10 - un inhibidor de PDE4;
 - un agonista selectivo del receptor adrenérgico β_2 ;
 - un modulador de la función del receptor quimocinas;
 - un inhibidor de la función de la cinasa p38;
 - un glucocorticoide;
 - 15 - un agente anticolinérgico y
 - un antagonista del receptor glucocorticoide no esteroide.