

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-063358- -00003-0000

Fecha: 2010-09-16 16:42:29 Dep. 2020 DIF. NUEVAS CR.
Tra. 11 PATENTE IYI Evs. 373 FASE NACIONAL I
Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 10

Re: Expediente N°. 10-063.358

Solicitud de Patente de Invención "DERIVADOS DE PIRAZOL COMO
INHIBIDORES DE 5-LO"

Solicitante: PFIZER INC.

Nuestra Ref: P2010/000055

RESPUESTA AL OFICIO N° 8945 NOTIFICADO

POR FIJACION EN LISTA No. 246 DE FECHA 16 DE JULIO DE 2010,

(EXAMEN DE FORMA ART 12)

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 un nuevo Capitulo Reivindicatorio Modificado, del que han sido eliminadas las reivindicaciones 9-13 y se renumeraron quedando un total de 9 reivindicaciones. Así las cosas junto un recibo de pago valor de \$114.000.00, que cubre el valor de la tasa de modificación para solicitudes en trámite.
2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

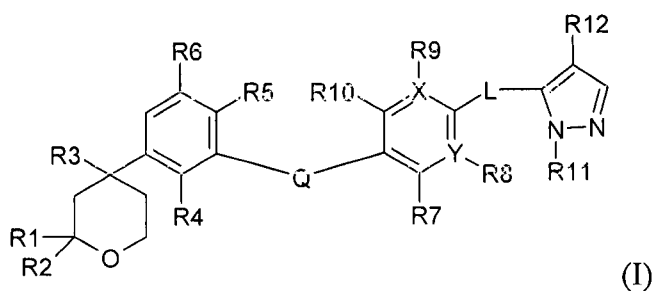
Anexo: Capitulo Reivindicatorio Modificado
Tasa por valor de \$114.000.00

455

2

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Examen de Forma)

1. Un compuesto de Fórmula (I)



o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, en el que,

Q es -S- o -S(O)-;

X y Y se seleccionan cada uno independientemente entre el grupo que consiste en C y N;

L se selecciona entre el grupo que consiste en:

- a) enlace;
- b) $-(CH_2)-$;
- c) $-O-$;
- d) $-C(O)-$;

R^1 y R^2 se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en:

- a) H;
- b) metilo;
- c) etilo;

R^3 se selecciona entre el grupo que consiste en

- a) $\leftarrow CN$;
- b) $\leftarrow C(O)NH_2$;
- c) $\leftarrow C(O)NH(CH_3)$;
- d) $\leftarrow C(O)N(CH_3)_2$;

R^4 es H o halo;

R^5 se selecciona entre el grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;
- c) $\leftarrow CN$;
- d) $\leftarrow OCH_3$

R^6 se selecciona entre el grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;

456

c) $\leftarrow$ CN;

R⁷ se selecciona entre el grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;
- c) $\leftarrow$ CN;
- d) $\leftarrow$ metilo;
- e) $\leftarrow$ OCH₃;

R⁸ está ausente cuando Y es N, o R⁸ se selecciona del grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;
- c) $\leftarrow$ CN;
- d) metilo;
- e) $\leftarrow$ OCH₃;

R⁹ está ausente cuando X es N, o R⁹ se selecciona del grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;
- c) $\leftarrow$ CN;
- d) metilo;
- e) $\leftarrow$ CF₃;
- f) $\leftarrow$ OCH₃;

R¹⁰ se selecciona entre el grupo que consiste en

- a) H;
- b) halo;
- c) $\leftarrow$ CN;

R¹¹ es H o alquilo (C₁-C₇);

R¹² es H o halo

siempre que el compuesto de Fórmula (I) no sea:

- a) 4-(3-{[3-fluoro-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)tetrahydro-2H-piran-4-carboxamida, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, o
- (b) 4-(3-{[4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)tetrahydro-2H-piran-4-carboxamida o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable.

2. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste en:

4-(3-{[3-fluoro-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)tetrahydro-2H-piran-4-carboxamida;

4-(2-fluoro-3-{[4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)-N-metiltetrahydro-2H-piran-4-carboxamida;

W58

4-(2,5-difluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-N-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

4-(2,4-difluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

4-(4-fluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-2-metil-4-(3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-(2-fluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-(4-fluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-(3-fluoro-5-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-(2,4-difluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-(3-fluoro-5-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

(2S,4R)-4-(2-fluoro-3-([4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

(2S,4R)-4-(3-([3-fluoro-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

(2S,4R)-4-(2-fluoro-3-([3-fluoro-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

(2S,4R)-4-(3-fluoro-5-([3-fluoro-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio)fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

4-[3-([3-fluoro-4-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)metil]fenil]tio)fenil]tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

4-[3-([4-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)carbonil]fenil]tio)fenil]tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

4-[3-([3-ciano-4-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)oxi]fenil]tio)fenil]tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-[2-fluoro-3-([4-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)carbonil]fenil]tio)fenil]-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

(2S,4R)-4-[2-fluoro-3-([4-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)carbonil]fenil]tio)fenil]-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

4-[3-([5-cloro-6-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)oxi]piridin-3-il]tio)fenil]tetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

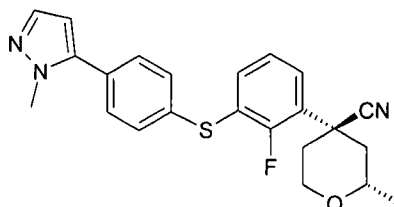
58

(2S,4R)-4-[3-({5-cloro-6-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)oxi]piridin-3-il}tio)-2-fluorofenil]-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo;

(2S,4R)-4-[3-({5-cloro-6-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)oxi]piridin-3-il}tio)-2-fluorofenil]-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carboxamida;

o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable.

3. El compuesto según la Reivindicación 2, (2S,4R)-4-(2-fluoro-3-{[4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo que tiene la Fórmula



o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable.

4. El compuesto según la Reivindicación 3, (2S,4R)-4-(2-fluoro-3-{[4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo, sal tosilato, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable.

5. El compuesto según la Reivindicación 4, que es una sal de (2S,4R)-4-(2-fluoro-3-{[4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)fenil]tio}fenil)-2-metiltetrahidro-2H-piran-4-carbonitrilo y ácido para-toluenosulfónico en una relación molar 1:1, que es cristalina y tiene un patrón de difracción de rayos x de polvo con los siguientes picos del patrón de rayos x de polvo principal expresado en términos de ángulo 2-theta ($\pm 0,1$ grados) cuando se mide usando radiación Cu K α_1 (Longitud de onda = 1,5406 Å)

Ángulo 2-Theta °
13,5
14,2
18,9
23,3
24,5

6. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de Fórmula (I), según lo definido en una o más de las Reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.

7. Una combinación particularmente para tratar una enfermedad, afección o trastorno

6

mediado por 5-LO, comprendiendo dicha combinación un compuesto de Fórmula (I) según lo definido en una o más de las reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y uno o más agentes terapéuticos.

8. La combinación según la Reivindicación 7, seleccionada del grupo que consiste en:

- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un glucocorticosteroide o un DAGR;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un inhibidor de COX, o bien inhibidores de COX-1 o COX-2 selectivos o no selectivos;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un α_2 agonista;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un antagonista del receptor muscarínico M3 o un agente anticolinérgico;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un antagonista del receptor de histamina;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un diurético;
- una combinación que comprende un compuesto de Fórmula (I) o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, y un bloqueante del canal de calcio.

9. ~~[ELIMINADA] Un compuesto de Fórmula (I) según se define en una o más de las reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato, para uso como medicamento.~~

10. ~~[ELIMINADA] Un método para tratar una enfermedad, afección o trastorno mediado por 5-LO, en un sujeto que necesita dicho tratamiento, administrando una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de Fórmula (I) según se define en una o más de las reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable.~~

11. ~~[ELIMINADA] Un compuesto de Fórmula (I) según se define en una o más de las reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, para uso en el tratamiento de una enfermedad, afección o trastorno mediado por 5-LO.~~

12. ~~[ELIMINADA] Uso de un compuesto de Fórmula (I) según se define en una o más de las reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, para la elaboración de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad, afección o trastorno mediado por 5-LO.~~

560

X

13. [ELIMINADA] La invención según una o más de las reivindicaciones 7-12, en la que la enfermedad, afección o trastorno mediado por SLO se selecciona del grupo que consiste en:

➤ ~~asma de cualquier tipo, etiología o patogénesis, en particular asma que es un miembro seleccionado del grupo que consiste en asma atópica, asma no atópica, asma alérgica, asma atópica bronquial mediada por IgE, asma bronquial, asma esencial, asma verdadera, asma intrínseca causada por alteraciones patofisiológicas, asma extrínseca causada por factores ambientales, asma esencial de causa desconocida o no aparente, asma bronquítica, asma enfisematosa, asma inducida por ejercicio, asma inducida por alérgenos, asma inducida por aire frío, asma ocupacional, asma infecciosa causada por infección bacteriana, fúngica, de protozoos, o vírica, asma no alérgica, asma incipiente y síndrome sibilante de la infancia;~~

➤ ~~broncoconstricción crónica o aguda, bronquitis crónica, obstrucción de las vías respiratorias pequeñas y enfisema;~~

➤ ~~enfermedades obstructivas o inflamatorias de las vías respiratorias de cualquier tipo, etiología o patogenia, en particular cualquier enfermedad obstructiva o inflamatoria de las vías respiratorias que es un miembro seleccionado entre el grupo que consiste en neumonía eosinofílica crónica, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC), EPOC que incluye bronquitis crónica, enfisema pulmonar o disnea asociada o no asociada con EPOC, EPOC que se caracteriza por una obstrucción de las vías respiratorias progresiva e irreversible, síndrome de distrés respiratorio en adultos (ARDS), exacerbación de la hiperreactividad de las vías respiratorias consecuente a otra terapia de fármacos y enfermedad de las vías respiratorias que se asocia con la hipertensión pulmonar;~~

➤ ~~bronquitis de cualquier tipo, etiología o patogenia, en particular bronquitis que es un miembro seleccionado entre el grupo que consiste en bronquitis aguda, bronquitis laringotraqueal aguda, bronquitis araquídica, bronquitis catarral, laringotraqueobronquitis, bronquitis seca, bronquitis asmática infecciosa, bronquitis productiva, estafilococos o bronquitis por estafilococos y bronquitis vesicular;~~

➤ ~~lesión pulmonar aguda;~~

➤ ~~bronquiectasia de cualquier tipo, etiología o patogenia, en particular bronquiectasia que es un miembro seleccionado entre el grupo que consiste en bronquiectasia cilíndrica, bronquiectasia sacciforme, bronquiectasia fusiforme, bronquiectasia capilar, bronquiectasia quística, bronquiectasia seca y bronquiectasia foliolar;~~

➤ ~~rinitis alérgica de cualquier tipo, incluyendo rinitis alérgica estacional, rinitis alérgica perenne, rinitis vasomotora, rinitis medicamentosa y rinitis polínica~~

➤ ~~dolor, incluyendo dolor nociceptivo o dolor neuropático;~~

➤ ~~una enfermedad neurodegenerativa; y~~

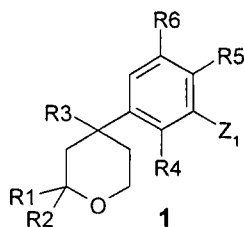
h61

➔ ~~una afección cardiovascular.~~

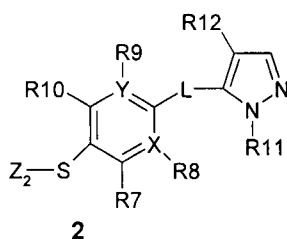
6

14. 9. [RENUMERADA] Un método para la elaboración de un compuesto de Fórmula (I) según se define en una o más de las Reivindicaciones 1-5, o su sal o solvato farmacéuticamente aceptable, comprendiendo dicho método

(i) poner en contacto un disolvente adecuado con un compuesto de Fórmula 1

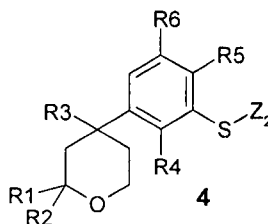


en donde R¹ a R⁶ son como se definió en la Reivindicación 1, y Z₁ es un grupo saliente o pareja de acoplamiento, con un compuesto de Fórmula 2

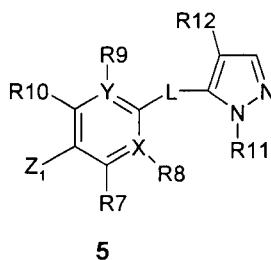


en donde X, Y, L y R⁷ a R¹² son como se definió en la Reivindicación 1, y Z₂ es hidrógeno o un grupo protector;
o, en alternativa a (i)

(ii) poner en contacto un compuesto de Fórmula 4



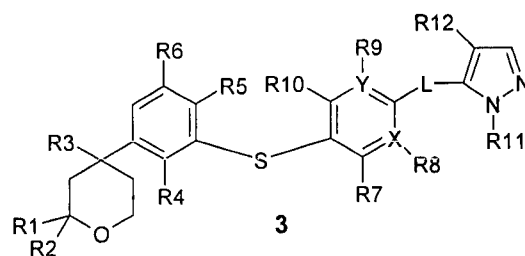
en donde R¹ a R⁶ son como se definió en la Reivindicación 1, y Z₂ es como se definió en (i), con un compuesto de Fórmula 5



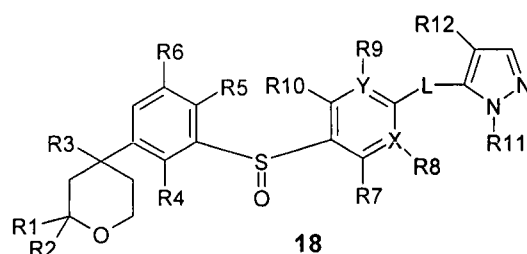
en donde X, Y, L y R⁷ a R¹² son como se definió en la Reivindicación 1 y Z₁ es como se define en (i)

como para obtener un compuesto de Fórmula 3

482



(iii) opcionalmente, poner en contacto dicho compuesto de Fórmula 3 con un agente oxidante en un disolvente adecuado como para obtener el sulfóxido correspondiente de Fórmula 18



h63

10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-063358- -00003-0000

Fecha: 2010-09-16 16:43:29 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Evs: 378 FASENACIONALI
Act 44 RESFUESTAREQUE Folios: 10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800174089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 77,762
FECHA : SEPTIEMBRE 16 DE 2010

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
DLARTE RAISDEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	379377145	16/09/2010	3,796,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

hsh

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
OLAFTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
PFIZER INC.

REFERENCIA	Eradicación No.	10 63358
	Solicitud internacional	PCT/IB2008/054873
	Fecha inicio fase nacional	26/06/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	12387
	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,



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

09 MAR. 2011

jfernand