

✓

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 00-024428-B-00002-0000

Fecha: 2010-12-06 17:32:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 6

Re: Expediente No. 00-024.428B

Solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE 2,3,4,6,7,11b-
HEXAHIDRO-1H-PRIDIDO[2,1-a]ISOQUINOLINAS"

Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC.

Nuestra Ref.: P2000/000045B

RESPUESTA AL OFICIO No 11588, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 311
DE FECHA 09 DE SEPTIEMBRE DE 2010.
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

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 solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar y con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado para la presente solicitud divisional el 25 de junio de 2010.

Así entonces, el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto contiene los siguientes cambios:

- En la Reivindicación 1 se limitan los radicales R^1 , R^3 y R^{10} , y se elimina el radical R_y ;
- Se incluyen las definiciones de los términos "arilo" y "het" en la Reivindicación 1;

Valga anotar que ésta modificación efectuada al Capítulo Reivindicatorio cumple a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que de ninguna manera implica una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

2. a- El Examinador argumenta que el título de la solicitud debe ser modificado, con el fin de que se mencione la estructura básica de benzo[a]quinolizina de los compuestos de Fórmulas (IV) y (V), que son la materia de la presente invención.

b- Atendiendo a la solicitud del Examinador, el título de la invención ha sido modificado de la siguiente manera:

“DERIVADOS DE 2,3,4,6,7,11b-HEXAHIDRO-1H-PRIDIDO[2,1-a]ISOQUINOLINAS”

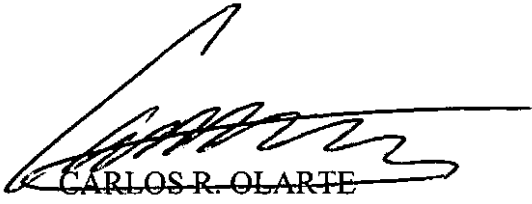
3. a- El Examinador señala que los sustituyentes de la fórmula general (IV) incluyen una excesiva cantidad de significados, que generan un gran número de compuestos, y que de acuerdo con el esquema de síntesis 1, podrían no estar enteramente soportados en el Capítulo Descriptivo. El Examinador señala, a manera de ejemplo, que los compuestos de Fórmula (V) que se pueden obtener mediante el proceso de síntesis contienen como sustituyente R^{10} los grupos -O-metilo, -O-bencilo y OH, como sustituyente R^3 el grupo propilo, y como sustituyentes X- R^1 el grupo bencilo. Adicionalmente, el Examinador señala que los términos “arilo” y “het” son muy generales y poco concisos.

El Examinador sugiere limitar los compuestos de Fórmula (IV) exclusivamente a los compuestos ilustrados en el Capítulo Descriptivo, según el procedimiento de síntesis allí descrito, y con actividad moduladora del receptor glucocorticoide.

b- Tomando en consideración las observaciones del Examinador, el Capítulo Reivindicatorio Modificado ha sido limitado para reclamar exclusivamente compuestos de Fórmula (IV) en los que: R^{10} es -O-metilo, -O-bencilo u OH, R^3 es propilo, y X- R^1 es bencilo. Adicionalmente, se han adicionado las definiciones de los términos “arilo” y “het” en la Reivindicación 1, de acuerdo con el Capítulo Descriptivo, página 37, líneas 28 a 34, y página 38, líneas 1 a 3.

4. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de fondo No. 3184 han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tengan por cumplidos los requisitos de patentabilidad, y se proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

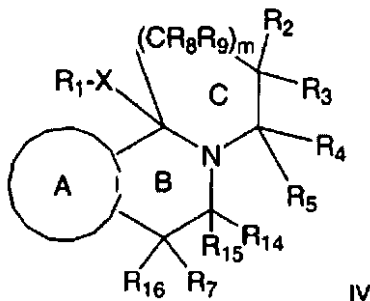
T.P. 74.295

Anexos:

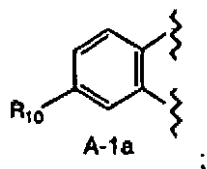
- Capítulo Reivindicatorio Modificado.

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO **(Primer Examen de Fondo)**

1. Un compuesto de Fórmula IV



un isómero del mismo, un profármaco de dicho compuesto o isómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto, isómero o profármaco; en el que R_8 es -H; R_9 es -H; m es 2; R_7 es -H; R_{14} es -H; R_{15} es -H; R_{16} es -H; y el anillo A es el



grupo de Fórmula A-1a

$X-R^1$ es bencilo;

R_2 es a) -H, b) -halo, c) -OH, d) -alquilo (C_1-C_6) sustituido con 0 o 1 -OH, e) - $NR_{12}R_{13}$, f) -Z-C(O)O-alquilo (C_1-C_6), g) -Z-C(O) $NR_{12}R_{13}$, h) -O-alquilo (C_1-C_6), i) -Z-O-C(O)-alquilo (C_1-C_6), j) -Z-O-alquil(C_1-C_3)-C(O)- $NR_{12}R_{13}$, k) -Z-O- alquil (C_1-C_3)-C(O)-O-alquilo (C_1-C_6), l) -O-alquenilo (C_2-C_6), m) -O-alquinilo(C_2-C_6), n) -O-Z-het, o) -COOH, p) -C(OH) $R_{12}R_{13}$, o q) -Z-CN;

R_3 es propilo;

con tal que uno de R_2 y R_3 esté ausente cuando haya un doble enlace entre CR_2R_3 (la posición 7) y el grupo F (la posición 8) del anillo C;

o R_2 y R_3 son considerados conjuntamente para formar a) $=CHR_{11}$, b) $=NOR_{11}$, c) $=O$, d) $N-NR_{12}$, e) $=N-NR_{12}-C(O)-R_{12}$, f) oxiranilo, o g) 1,3-dioxolan-4-ilo;

R_4 y R_5 son independientemente, para cada caso, a) -H, b) -CN, c) -alquilo (C_1-C_6) sustituido con de 0 a 3 halo, d) -alquenilo (C_2-C_6) sustituido con de 0 a 3 halo, e) -alquinilo (C_2-C_6) sustituido con de 0 a 3 halo, f) -O-alquilo (C_1-C_6) sustituido con de 0 a 3 halo, g) -O-alquenilo (C_2-C_6) sustituido con de 0 a 3 halo, h) -O- alquinilo (C_2-C_6)

5

sustituido con de 0 a 3 halo, i) halo, j) -OH, k) cicloalquilo (C_3-C_6), o l) cicloalquenilo (C_3-C_6);

o R_4 y R_5 son considerados conjuntamente para formar $=O$;

R_{10} es -O-metilo, -O-bencilo o -OH;

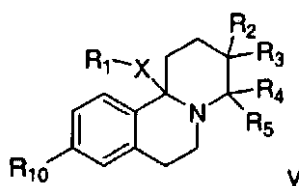
R_{11} es a) -H, b) -alquilo (C_1-C_5), c) -cicloalquilo(C_3-C_6), o d) -alquil (C_0-C_3)-arilo;

cada uno de R_{12} y R_{13} es independientemente, para cada caso, a) -H, b) -alquilo (C_1-C_6) en el que 1 o 2 átomos de carbono, salvo el átomo de carbono conectivo, pueden estar opcionalmente reemplazados por 1 ó 2 heteroátomos independientemente seleccionados entre S, O y N y en el que cada átomo de carbono está sustituido con de 0 a 6 halo, c) -alquenilo (C_2-C_6) sustituido con de 0 a 6 halo, o d) -alquinilo (C_2-C_6) en el que 1 átomo de carbono, salvo el átomo de carbono conectivo, puede estar opcionalmente reemplazado por 1 átomo de oxígeno y en el que cada átomo de carbono está sustituido con de 0 a 6 halo; o R_{12} y R_{13} son considerados junto con N para formar het;

arilo se refiere a un anillo aromático de 5, 6 o 7 miembros opcionalmente sustituido, que incluye anillos poliaromáticos;

het se refiere a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente saturado o insaturado, de 5, 6 o 7 miembros, que contiene 1 a 3 heteroátomos, seleccionados del grupo que comprende nitrógeno, oxígeno y azufre, e incluye cualquier grupo bicíclico en el que cualquiera de los anillos heterocíclicos anteriores está fusionado con un anillo de benceno o con otro anillo heterocíclico; y el átomo de nitrógeno puede estar en el estado oxidado que proporciona la forma N-óxido; y sustituido con de 0 a 3 sustituyentes independientes.

2. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, de Fórmula V



un isómero del mismo, un profármaco de dicho compuesto o isómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto, isómero o profármaco; en el que

Z es independientemente, en cada caso, -alquilo (C_0-C_2);

6

cada uno de R_4 y R_5 es hidrógeno o ambos se consideran conjuntamente para formar $=O$; y

R_{12} y R_{13} son independientemente, para cada caso, a) $-H$ o b) $-alquilo (C_1-C_4)$.

3. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1, un isómero del mismo, un profármaco de dicho compuesto o isómero, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto, isómero o profármaco; y un vehículo o agente diluyente farmacéuticamente aceptable.
