

# OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-058068- -00002-0000

Fecha: 2011-09-22 16:38:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. \_\_\_\_\_ S. \_\_\_\_\_ D. \_\_\_\_\_

**Re: Expediente N°. 11-058.068**

**Solicitud de Patente de Invención "PIRROLIDINAS"**

**Solicitante: PFIZER LIMITED**

**Nuestra Ref: P2011/000085**

**RESPUESTA AL OFICIO N° 11490 NOTIFICADO**

**POR FIJACION EN LISTA No. 276, DE FECHA 22 DE JULIO DE 2011,**

**(EXAMEN DE FORMA ART 12)**

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., 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 por 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 Capitulo Reivindicatorio Modificado en donde se eliminaron las Reivindicaciones 15 a 21. Las Reivindicaciones restantes se reenumeraron, quedando un total de 16 reivindicaciones en total. Así las cosas adjunto un recibo por valor de \$162.000 que cubre la tasa correspondiente a 6 reivindicaciones adicionales.
2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de Reivindicaciones en el presente trámite.

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**NIT : 800.176.089-2**

- / -

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

**RECIBO DE CAJA**

**No. 11 - 0093326**

Bogotá D.C., Septiembre 22 de 2011 - 14:40:32

**RECIBIDO DE : OLARTE MOURE & ASOCIADOS**

**NI 830.122.870**

**\*\*\* Soporte del Pago \*\*\***

| TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO  | FECHA PAGO | VR PAGO      |
|--------------|-----------------|-----------|-----------|------------|--------------|
| CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 408398605 | 21/09/2011 | 4.447.000.00 |

**\*\*\* Conceptos Pagados \*\*\***

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                                            | Vr. UNIDITARIO | Vr. CONCEPTO        |
|-------|-------------------------|-----------------------------------------------------|----------------|---------------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 82 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN NUEVAS CREACIONES | 162.000.00     | 162.000.00          |
|       |                         |                                                     |                | <b>\$162.000.00</b> |

**SON: \*\*CIENTO SESENTA Y DOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE\*\***

Responsable: \_\_\_\_\_

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. \_\_\_\_\_

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**



**No. 11-058068- -00002-0000**

Fecha: 2011-09-22 16:38:58 Dep. 2020 DIR. NUEVAS CR  
 Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASE NACIONAL I  
 Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 9

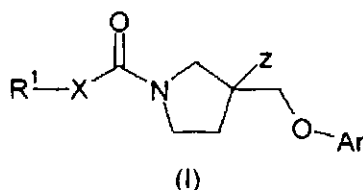
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: [www.sic.gov.co](http://www.sic.gov.co) e-mail: [info@sic.gov.co](mailto:info@sic.gov.co) Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Septiembre 22 de 2011 - 14:40:35

## CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO (Modificaciones Voluntarias)

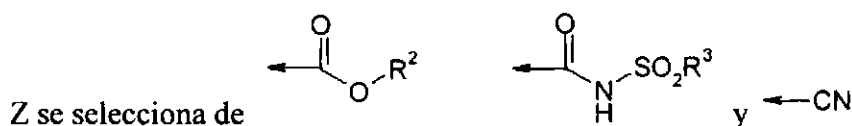
1. - Un compuesto de Fórmula (I)



en la que:

$R^1$  es un grupo fenilo opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de F, Cl, Br, CN, alquilo  $C_{1-4}$ , alquiltio  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , fluoroalquilo  $C_{1-6}$  y fluoroalcoxi  $C_{1-6}$ , o es un grupo cicloalquilo  $C_{3-6}$ ;

X representa un enlace directo, NH u O;



$R^2$  es H o alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de flúor;

$R^3$  es alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de flúor;

Ar es un grupo aromático que consiste en 1, 2 o 3 anillos aromáticos, en los que dichos anillos aromáticos se seleccionan cada uno independientemente de fenilo y un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados cada uno independientemente de N, O y S, y en los que dichos anillos aromáticos, si son 2 o más, pueden estar condensados y/o enlazados por uno o más enlaces covalentes, y en los que dichos anillos aromáticos están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de F, Cl, CN, OH, alquilo  $C_{1-6}$ , alquiltio  $C_{1-6}$ , fluoroalquilo  $C_{1-6}$ , fluoroalquiltio  $C_{1-6}$ , fluoroalcoxi  $C_{1-6}$ , alcoxi  $C_{1-6}$ ,  $SO_2R^4$ ,  $NR^5R^6$ ,  $NHSO_2R^7$ ,  $SO_2NR^8R^9$ ,  $CONR^{10}R^{11}$  y  $NHCOR^{12}$ ;

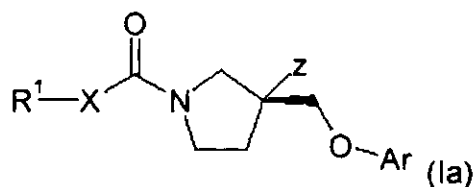
$R^4$  y  $R^7$  son cada uno independientemente alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de flúor;

$R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  y  $R^{12}$  son cada uno independientemente H o alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de flúor;

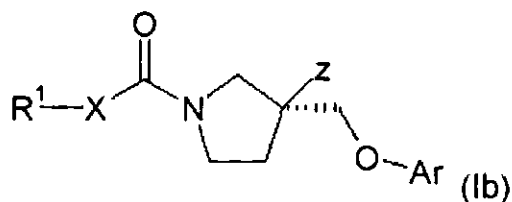
o su sal farmacéuticamente aceptable, solvato (incluyendo hidrato) o profármaco.

2. Un compuesto según la Reivindicación 1, que es un compuesto de Fórmula (Ia)

4



o un compuesto de fórmula (Ib)



en la que R<sup>1</sup>, X, Ar y Z son como se definió en la Reivindicación 1, o su sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco.

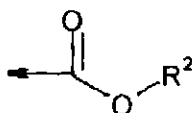
3. Un compuesto según la Reivindicación 1 o 2, en el que R<sup>1</sup> es un grupo fenilo opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, alquilo C<sub>1-4</sub> y alcoxi C<sub>1-4</sub>, o es un grupo cicloalquilo C<sub>3-6</sub>.

4. Un compuesto según la Reivindicación 3, en el que R<sup>1</sup> es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, 2-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-etoxifenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo o 4-metilfenilo.

5. Un compuesto según la Reivindicación 4, en el que R<sup>1</sup> es 4-metoxifenilo o 4-fluorofenilo.

6. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, en el que X representa un enlace directo.

7. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6, en el que Z es



8. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7, en el que Z es -COOH.

9. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8, en el que Ar es un grupo aromático que consiste en 1, 2 o 3 anillos aromáticos, en los que dichos anillos aromáticos se seleccionan cada uno independientemente de fenilo y un anillo

heteroaromático de 5 ó 6 miembros que comprende (a) de 1 a 4 átomos de nitrógeno, (b) un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, o (c) un átomo de oxígeno o un átomo de azufre y 1 o 2 átomos de nitrógeno; y en los que dichos anillos aromáticos, si son 2 o más, pueden estar condensados y/o enlazados por uno o más enlaces covalentes, y en los que dichos anillos aromáticos están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de F, Cl, CN, OH, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquiltio C<sub>1-6</sub>, fluoroalquilo C<sub>1-6</sub>, fluoroalquiltio C<sub>1-6</sub>, fluoroalcoxi C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NHSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> y NHCOR<sup>12</sup>.

10. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, en el que Ar es fenilo, naftilo, bifenilo, piridinilfenilo, pirimidinilfenilo, fenilpiridinilo, fenilpirimidinilo, fenilpirazinilo o pirazinilfenilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de F, Cl, CN, OH, alquilo C<sub>1-6</sub>, alquiltio C<sub>1-6</sub>, fluoroalquilo C<sub>1-6</sub>, fluoroalquiltio C<sub>1-6</sub>, fluoroalcoxi C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NHSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> y NHCOR<sup>12</sup>.

11. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 10, en el que Ar es fenilo, naftilo, bifenilo, piridinilfenilo, pirimidinilfenilo, fenilpiridinilo, fenilpirimidinilo, fenilpirazinilo o pirazinilfenilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 ó 2 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de F, Cl, CN, -CONH<sub>2</sub> y alcoxi C<sub>1-6</sub>.

12. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 11, en el que Ar es 2,3-difluorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 4-(4-cianofenil)fenilo, 4-(4-fluorofenil)fenilo, 4-(5-cloropiridin-2-il)fenilo, 4-(5-cianopiridin-2-il)fenilo, 4-(5-cloropirimidin-2-il)fenilo, 4-(5-cianopirimidin-2-il)fenilo, 4-(5-fluoropirimidin-2-il)fenilo, 4-(5-aminocarbonilpirimidin-2-il)fenilo, 2-(4-clorofenil)piridin-5-ilo, 2-(4-fluorofenil)piridin-5-ilo, 2-(4-cianofenil)piridin-5-ilo, 2-(4-clorofenil)pirimidin-5-ilo, 5-(4-clorofenil)pirazin-2-ilo o 5-(4-fluorofenil)pirazin-2-ilo.

13. Un compuesto según la Reivindicación 1 o 2, seleccionado de:

ácido 3-{[(4'-cianobifenil-4-il)oxi]metil}-1-(4-fluorobenzoil)pirrolidin-3-carboxílico (R<sup>1</sup> = 4-fluorofenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(4-cianofenil)fenilo);

ácido 3-{[(4'-cianobifenil-4-il)oxi]metil}-1-(4-metoxibenzoil)pirrolidin-3-carboxílico (R<sup>1</sup> = 4-metoxifenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(4-cianofenil)fenilo);

ácido 3-{[4-(5-cloropirimidin-2-il)fenoxi]metil}-1-(4-fluorobenzoil)pirrolidin-3-carboxílico (R<sup>1</sup> = 4-fluorofenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(5-cloropirimidin-2-il)fenilo);

ácido 1-(4-clorobenzoil)-3-{{4-(5-cloropiridin-2-il)fenoxi}metil}pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ =4-clorofenilo, X=enlace directo, Z=-COOH, Ar=4-(5-cloropiridin-2-il)fenilo);

ácido 1-(4-clorobenzoil)-3-{{6-(4-clorofenil)piridin-3-il}oxi}metil}pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ =4-clorofenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 2-(4-clorofenil)piridin-5-ilo);

ácido 3-{{4-(5-cloropirimidin-2-il)fenoxi}metil}-1-(2-metoxibenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$  = 2-metoxifenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(5-cloropirimidin-2-il)fenilo);

ácido 3-{{2-(4-clorofenil)pirimidin-5-il}oxi}metil}-1-(4-fluorobenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ =4-fluorofenilo, X=enlace directo, Z=-COOH, Ar = 2-(4-clorofenil)pirimidin-5-ilo);

ácido 3-{{4-(5-cianopiridin-2-il)fenoxi}metil}-1-(4-fluorobenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$  = 4-fluorofenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(5-cianopiridin-2-il)fenilo);

ácido 3-{{4-(5-cloropirimidin-2-il)fenoxi}metil}-1-(4-metoxibenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ = 4-metoxifenilo, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 4-(5-cloropirimidin-2-il)fenilo);

ácido 3-{{6-(4-clorofenil)piridin-3-il}oxi}metil}-1-(4-fluorobenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ =4-fluorofenil, X = enlace directo, Z = -COOH, Ar = 2-(4-clorofenil)piridin-5-ilo);

ácido 3-{{6-(4-clorofenil)piridin-3-il}oxi}metil}-1-(2-metoxibenzoil)pirrolidin-3-carboxílico ( $R^1$ =2-metoxifenilo, X=enlace directo, Z = -COOH, Ar = 2-(4-clorofenil)piridin-5-ilo);

o su sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco de cualquiera de ellos.

14. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto según una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 13, o su sal farmacéuticamente aceptable, solvato (incluyendo hidrato) o profármaco, y un excipiente, diluyente, vehículo o adyuvante farmacéuticamente aceptable.

15. Un compuesto de fórmula:

