



No. 04-062934-00006-0000

Fecha: 2007-06-13 16:20:55 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

A - COLOMBIA
FUNDADA EN 1941

APARIADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3284270 57-1-8088700
FAX: 57-1-3284271 57-1-8088701
CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jllico@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re: P1.-SANOFI-AVENTIS.-Solicitud de Patente de Invención Fase Nacional PCT para
"DERIVADOS DE 5-(PIRIDIN-3-IL)-1-AZABICICLO[3.2.1]OCTANO, SU
PREPARACION Y SU APLICACIÓN EN TERAPÉUTICA".-Clase C07D 471/08.-
Expediente número 04-062.934.-

1. Me refiero a mi memorial de 9 de Junio de 2006.

2. Por medio del presente me permito manifestar a usted que es deseo del solicitante modificar voluntariamente la presente solicitud con el fin de limitar el alcance de la reivindicación 1, introducir una nueva reivindicación 5 y aclarar un error de carácter tipográfico en el Ejemplo 3 de la descripción, tal como se explica a continuación:

- (I) En la reivindicación 1 ahora modificada se ha incluido una condición de exclusión al fin de la misma, de conformidad con la cual no se considerarán dentro del alcance de la solicitud los compuestos 5-(2-bromopiridin-5-IL)-1-azabicclo[3.2.1]oct-3-eno; 5-(2-cloropiridin-5-IL)-1-azabicclo[3.2.1]oct-3-eno y 5-(2-fluoropiridin-5-IL)-1- azabicclo[3.2.1]oct-3-eno;
- (II) Se ha incluido una nueva reivindicación 5, de conformidad con la cual se solicita protección específica para los compuestos bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-IL)-1- azabicclo[3.2.1]oct-3-eno (2:1); bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-IL)-1- azabicclo[3.2.1]octano (2:1) y bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-IL)-1- azabicclo[3.2.1]oct-2-eno (2:1). El sustento para esta nueva reivindicación se puede encontrar en los compuestos correspondientes a los numerales 1, 2 y 3 de la Tabla que aparece en la página 14 de la descripción, en donde se señala la identidad de los sustituyentes que dan lugar a estos compuestos específicos cuando se realizan los reemplazos correspondientes sobre la fórmula general I; y
- (III) Finalmente, se ha corregido el nombre del compuesto del Ejemplo 3, el cual se encuentra al comienzo de la página 10, reemplazando la expresión incorrecta "octano", que se encuentra al final del nombre del compuesto químico allí descrito, por el término correcto "oct-3-eno". El sustento para esta modificación se puede encontrar en el paso final del mismo Ejemplo 3, esto es, en el numeral 3.3 de la página 11, en donde se expone el nombre correcto para el compuesto como Etanodiloato de 5-[2-(3-metilfenil)piridin-5-IL)-1-azabicclo[3.2.1]oct-3-eno, ya que este corresponde al producto final obtenido en dicho ejemplo.

Sobre este particular, atentamente me permito manifestar que las anteriores modificaciones no amplían de ninguna manera el alcance de la presente solicitud tal como fue originalmente presentada, toda vez que las mismas solamente obedecen a distinguir de manera más clara y precisa las enseñanzas de la presente invención y, en el caso particular de la nueva reivindicación 5, a proteger un objeto específico que se encuentra incluido dentro de dichas enseñanzas.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibo número 07 - 43,365 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas;
- (b) Formulario único de modificaciones y correcciones;
- (c) Copia de la nueva página 10 del capítulo descriptivo, que reemplaza a la originalmente presentada mediante mi solicitud de 1 de Julio de 2004, en la cual se ha realizado la modificación expuesta anteriormente; y
- (d) Copias de las nuevas páginas 26 a 28 del capítulo reivindicatorio, que reemplazan al originalmente presentado, en el cual se han realizado las modificaciones expuestas anteriormente.

4. En vista de todo lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar de conformidad la presente solicitud y conceder el privilegio de patente solicitado.

Señor Superintendente,

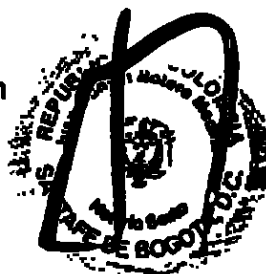
Alicia Lloreda Ricaurte
ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. **13 JUN 2007**
Ante mí **JUAN MANUEL BOTERO MEDINA**
NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTÁ

Comparecieron: *Alicia Lloreda Ricaurte*
R. Ricaurte

quien (as) exhibió(eron) la(s) C.C.
C.C. 39.690.713
T.P. 53.215
y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparece(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto. En constancia
firma esta diligencia.

Alicia Lloreda Ricaurte
ALICIA LLOREDA RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES.
2000-10

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

②

SOLICITANTE

Nombre: SANOFI-AVENTIS, una sociedad organizada y existente de conformidad con las leyes de Francia

Dirección: 174 Avenue de France 75013, Paris, Francia

Teléfono: 326 42 70 Fax: 606 97 01

E-mail: jilcco@lloredacamacho.com

Domicilio: Paris, Francia

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número _____

③

REPRESENTANTE APODERADO

Nombre: ALICIA LLORED A RICAURTE

Dirección: Calle 72 No. 5-83 Piso 6o.

Teléfono: 326 42 70

Fax: 606 97 01

E-mail: jilcco@lloredacamacho.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39'169.713 TP 53.215

④

Número de expediente:

04-062.934

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada Modificación voluntaria limitando el alcance de la reivindicación 1, introduciendo nueva reivindicación 5 y aclarando error tipográfico en el Ejemplo 3 de la descripción.

⑥

Comprobante de pago No. 07 - 43.365

Fecha 30-05-07

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Certificado de existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

⑧

NOMBRE ALICIA LLORED A RICAURTE

FIRMA

C.C. 39'690.713

T.P. 53.215

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 04-062934-00006-0000

Fecha: 2007-08-13 16:20:55 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evt: 379 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 8

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 43,363
FECHA : MAYO 30 DE 2007

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	53092641	30/05/2007	1,530,000.00

CONCEPTO

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	99,000.
	TOTAL :	99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Etanodioato de 5-[2-(3-metilfenil)piridin-5-il)-1-azabicyclo [3.2.1] oct-3-eno (1:1).

3.1. 3-Hidroxi-3-(2-bromopiridin-5-il)-1-azabicyclo [2.2.2] octano.

Se introducen en un balón tricol de 2000 ml 27,6 g (0,116 mol) de 2,5-dibromopiridina en 1000 ml de éter etílico, se enfria el medio reaccionante a -67°C y se agregan 56 ml (0,140 mol) de una solución de 2,5 M de butil litio en hexano, gota a gota en 10 min. Se deja agitar el medio a -67°C durante 45 min antes de agregar 14,5 g (0,116 mol) de 1-azabicyclo [2.2.2] octano-3-ona en solución en 150 ml de éter etílico en 45 min se deja agitar a -67°C durante 3 h.

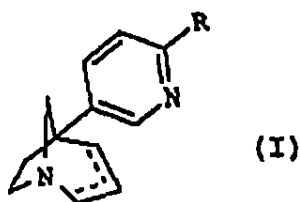
Se agregan 300 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio, luego 200 ml de una solución acuosa concentrada de hidróxido de sodio, se extrae la fase acuosa con cloroformo, se secan las fases orgánicas y se las concentra bajo presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía sobre columna de gel de sílice, y se procede a la elución con una mezcla 95/5/0,5, luego 80/15/1,5 de cloroformo, metanol y amoníaco.

Se obtienen 19,7 g de producto en forma de sólido amorfo.

3.2. 5-(2-bromopiridin-5-il)-1-azabicyclo [3.2.1] oct-3-eno

REIVINDICACIONES

1. Compuesto, en forma de enantiómero puro o en forma de mezcla de enantiómeros, que responde a la fórmula general (I):



en la cual R representa un átomo de halógeno o un grupo cicloalquilo (C_3-C_6) o un grupo fenilo substituido por uno o varios grupos elegidos entre un átomo de halógeno, o un grupo alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), nitro, amino, dialquilamino (C_1-C_3), trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano, hidroxilo, acetilo o metilendioxo, o un grupo piperidinilo, o morfolin-4-ilo, o pirrolidin-1-ilo, o azetidín-1-ilo, o azepín-1-ilo, o piridinilo, o quinolinilo, o tienilo, o pirazinilo, o furilo, o benzofurilo, o benzotienilo, o indolilo, o pirimidinilo o isoxazolilo, o fenoxazinilo, o fenoxatiinilo, o dibenzotienilo, o dibenzofurilo, o pirrolilo o naftilo, y cada uno de esos grupos puede eventualmente ser substituido por uno o varios grupos elegidos entre los átomos de halógenos, los grupos

alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), trifluorometoxi, trifluorometilo, nitro, ciano, hidroxilo, amino, dialquilamino (C₁-C₃) o cicloalquilamino (C₁-C₆), y se sabe que entre los dos enlaces carbono-carbono representados por ---, uno es simple y el otro puede ser simple o doble, en estado de base o de sal derivada de adición con un ácido;

siendo excluidos los siguientes compuestos:

- 5-(2-bromopiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-3-ano
- 5-(2-cloropiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-3-ano
- 5-(2-fluoropiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-3-ano.

2. Compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R representa o bien un átomo de halógeno o un grupo fenilo substituido por uno o varios grupos elegidos entre los átomos de halógenos y los grupos alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), nitro, amino, trifluorometilo, ciano, hidroxilo, acetilo o metilendioxi, o bien un grupo piridinilo, o bien un grupo tienilo, o bien un grupo indolilo, o bien un grupo pirimidinilo eventualmente substituido por uno o varios grupos alcoxi (C₁-C₆).
3. Medicamento caracterizado porque consiste en un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1.

4. Composición farmacéutica caracterizada porque contiene un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, asociado a un excipiente.
5. Un compuesto elegido entre los siguientes compuestos:
- bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-3-eno (2:1);
 - bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]octano (2:1);
 - bromhidrato de 5-(2-fenilpiridin-5-il)-1-azabicyclo[3.2.1]oct-2-eno (2:1).